



(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) 
1-0021017

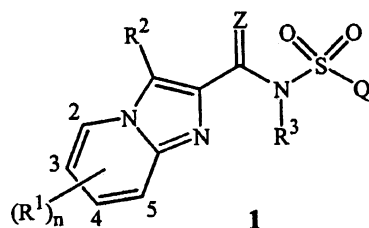
(51)⁷ **A61K 31/4745, C07D 487/04**

(13) **B**

-
- (21) 1-2011-02596 (22) 04.05.2010
(86) PCT/US2010/033471 04.05.2010 (87) WO2010/129500 11.11.2010
(30) 61/175,206 04.05.2009 US
(45) 27.05.2019 374 (43) 25.06.2012 291
(73) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898, United State of America
(72) LAHM George P. (US), LETT Renee Marie (US), SMITH Brenton Todd (US),
SMITH Benjamin Kenneth (US), DALY C. Anne (US)
(74) Văn phòng luật sư Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)
-

(54) **HỢP CHẤT SULFONAMIT, CHẾ PHẨM CHỨA CHÚNG, PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ GIUN TRÒN KÝ SINH VÀ HẠT ĐÃ ĐƯỢC XỬ LÝ**

(57) **Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức 1, N-oxit, và các muối của nó,**



trong đó:

Z là O hoặc S; và

R¹, R², R³, Q và n là như được xác định trong phần mô tả.

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 và phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh bao gồm bước cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế.

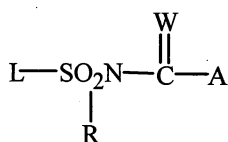
Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến một số hợp chất sulfonamid, N-oxit của chúng, các muối và chế phẩm thích hợp để sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp, và các phương pháp sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh trong môi trường nông nghiệp lẫn môi trường phi nông nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Việc phòng trừ các giun tròn ký sinh là vô cùng quan trọng để đạt được năng suất thu hoạch cao. Sự hư hại của rễ do giun tròn gây ra có thể làm giảm đáng kể sản lượng và chất lượng cây trồng và do đó dẫn đến làm tăng giá thành cho người tiêu dùng. Do sự phát triển tính kháng rộng rãi với thuốc trừ giun ở các loài ký sinh giun tròn, giun tròn tiếp tục gây những vấn đề khó khăn cho vật nuôi bất chấp các tác nhân hóa trị liệu được sử dụng. Vẫn có nhu cầu về hợp chất mới hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, độ độc thấp hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có các kiểu tác động khác nhau.

Công bố đơn patent châu Âu số 0 244 166 A2 mô tả các hợp chất có công thức i ở dạng thuốc diệt cỏ:



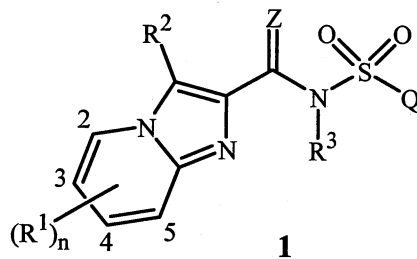
i

trong đó, không kể những cái khác, R là H hoặc phân tử thế hữu cơ, W là O hoặc S, L là gốc aryl hoặc heteroaryl, và A được chọn từ nhóm dị nhân hai vòng, ba vòng và bốn vòng.

Hợp chất theo sáng chế không được bộc lộ trong công bố này.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể), N-oxit, và các muối của chúng, và chế phẩm chứa chúng và mô tả việc dùng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphthalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc

lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ và R^{14} ;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R^4 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{4a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^5 độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C_1-C_6 alkyl;

mỗi R^6 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{6a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, $C(O)R^{13}$ hoặc $C(O)OR^{13}$;

mỗi R^7 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử

thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂–C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R^{7a} độc lập là C₁–C₆ alkyl hoặc C₁–C₆ haloalkyl;

mỗi R⁸ độc lập là H, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl hoặc C₂–C₆ haloalkynyl; hoặc C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl, C₆–C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅–C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl hoặc C₂–C₆ alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂–C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R^{8a} độc lập là C₁–C₆ alkyl hoặc C₁–C₆ haloalkyl;

mỗi R⁹ độc lập là H, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl hoặc C₂–C₆ haloalkynyl; hoặc C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl, C₆–C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅–C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl hoặc C₂–C₆ alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂–C₆

alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1 – C_6 alkyl hoặc C_1 – C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, C_6 – C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{11a} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl;

mỗi R^{12} độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, C_6 – C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{13} độc lập là H , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{14} độc lập là C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{15} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi m độc lập là 0, 1 hoặc 2; và

n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4.

Sáng chế cũng đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể), N-oxit, và các muối của nó, và chế phẩm chứa chúng và sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh như được mô tả trên đây, và trong bản mô tả này, miễn là khi n bằng 2 và một R^1 là CF_3 ở vị trí 3 của công thức 1 và R^1 kia là Cl ở vị trí 5 của công thức 1, và R^2 và R^3 là H , thì Q không phải là 2-

clophenyl, 2-clo-6-metylphenyl, 2,6-diclophenyl, 2-clo-4-flophenyl, 2,5-bis(2,2,2-trifloetoxy)phenyl, 2,4,6-triclophenyl, 2-clo-5-(triflometyl)phenyl hoặc 3,5-dimetyl-4-isoxazolyl.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng. Theo một phương án thực hiện, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm để phòng trừ giun tròn ký sinh chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm trên đây còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh bao gồm bước cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, (ví dụ, chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này). Sáng chế cũng đề xuất phương pháp trong đó giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm trên đây còn tùy ý chứa lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ hạt tránh khỏi giun tròn ký sinh bao gồm bước cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó (ví dụ, chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này). Sáng chế cũng đề xuất hạt đã được xử lý.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả này, các thuật ngữ "bao gồm", "chứa", "có", "khác biệt ở chỗ" hoặc các biến thể của chúng, được dự định để bao hàm các phương án không mang tính loại trừ. Ví dụ, khi chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp bao gồm một số phần tử thì nó không nhất thiết chỉ giới hạn ở các phần tử này mà có thể bao gồm các phần tử khác được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có đối với các chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp này.

Cụm từ chuyển tiếp "gồm" không bao gồm phần tử, bước hoặc thành phần bất kỳ không được chỉ rõ. Nếu xuất hiện trong yêu cầu bảo hộ, cụm từ này sẽ bao hàm các nguyên liệu ngoài các nguyên liệu được nêu, ngoại trừ các tạp chất được kết hợp thông thường với nguyên liệu đó. Khi cụm từ "bao gồm" xuất hiện trong mệnh đề chính của yêu cầu bảo hộ, chứ không phải ngay sau phần mở đầu, thì nó

chỉ giới hạn ở phần tử được nêu trong mệnh đề đó; các phần tử khác không bị loại trừ khỏi yêu cầu bảo hộ được giữ nguyên.

Cụm từ chuyển tiếp “về cơ bản chứa” được sử dụng để xác định chế phẩm hoặc phương pháp bao gồm nguyên liệu, các bước, dấu hiệu, hợp phần, hoặc phần tử, ngoài các nguyên liệu, các bước, dấu hiệu, hợp phần, hoặc phần tử được mô tả trong tài liệu, với điều kiện là các nguyên liệu, các bước, dấu hiệu, hợp phần, hoặc phần tử này không làm ảnh hưởng nhiều đến dấu hiệu đặc trưng cơ bản và mới của đối tượng sáng chế. Thuật ngữ “về cơ bản chứa” nằm ở mức giữa của thuật ngữ “chứa” và “bao gồm”.

Khi tác giả sáng chế xác định sáng chế hoặc một phần của sáng chế bằng thuật ngữ mở rộng được, ví dụ, “chứa,” cần phải hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả cũng mô tả sáng chế bằng cách sử dụng các thuật ngữ “về cơ bản chứa” hoặc “bao gồm.”

Ngoài ra, trừ khi chỉ có dẫn khác, “hoặc” dùng để chỉ hoặc bao hàm chứ không phải hoặc loại trừ. Ví dụ, điều kiện “A hoặc B” được thỏa mãn trong các trường hợp sau: A đúng (hoặc có mặt) và B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Các mạo từ không xác định “một” đứng trước phần tử hoặc thành phần theo sáng chế cũng không bị giới hạn để chỉ một số trường hợp (có nghĩa là biến cố) của phần tử hoặc thành phần này. Vì vậy “một” phải được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của phần tử hoặc thành phần cũng dùng để chỉ cả số nhiều trừ khi số này có nghĩa rõ ràng là số ít.

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

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

Như được đề cập trong bản mô tả và phần yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ “diệt ký sinh trùng” và “có tác dụng diệt ký sinh trùng” dùng để chỉ tác dụng đáng kể đối với giun tròn ký sinh để tạo ra sự bảo vệ thực vật, động vật hoặc người khỏi loài gây hại này. Tác dụng diệt ký sinh trùng thường đề cập đến việc làm giảm sự xuất hiện hoặc hoạt tính của giun tròn ký sinh. Tác dụng đối với giun tròn bao gồm chết hoại, chết, làm chậm sự phát triển, làm giảm sự di động hoặc làm giảm khả năng tồn tại trên hoặc trong vật chủ thực vật, động vật hoặc người, làm giảm ăn và ức chế sinh sản. Các tác dụng này đối với giun tròn ký sinh tạo ra tác dụng phòng trừ (bao gồm ngăn ngừa, làm giảm hoặc hạn chế) sự quấy phá hoặc nhiễm ký sinh của thực vật, động vật hoặc người. Vì vậy “phòng trừ” giun tròn ký sinh nghĩa là đạt được hiệu quả diệt loài ký sinh đối với giun tròn. Các cụm từ “lượng hữu hiệu có tác dụng diệt loài ký sinh” và “lượng hữu hiệu sinh học” trong trường hợp ứng dụng hợp chất hóa học để phòng trừ giun tròn ký sinh dùng để chỉ lượng hợp chất đủ để phòng trừ giun tròn ký sinh.

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

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

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

Trong các phần nêu trên, thuật ngữ "alkyl", được sử dụng riêng lẻ hoặc trong hợp chất như "alkylthio" hoặc "haloalkyl" gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh như, metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl, pentyl hoặc hexyl khác nhau. "Alkenyl" gồm alken mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, và các chất đồng phân butenyl, pentenyl và

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

"Alkoxy" gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, n-propyloxy, isopropyloxy và các chất đồng phân butoxy, pentoxy và hexyloxy khác nhau. "Alkoxyalkyl" dùng để chỉ việc thay thế alkoxy trên alkyl. Ví dụ về "alkoxyalkyl" bao gồm CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ và $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

"Xycloalkyl" bao gồm, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl. Thuật ngữ "xycloalkylalkyl" dùng để chỉ việc thế xycloalkyl trên gốc alkyl. Ví dụ về "xycloalkylalkyl" gồm xyclopropylmetyl, xyclopentyletyl, và các gốc xycloalkyl khác được gắn với nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh. "Xycloalkenyl" bao gồm các nhóm như xyclopentenyl và xyclohexenyl cũng như các nhóm có hơn một liên kết đôi như 1,3- và 1,4-xyclohexadienyl. Thuật ngữ "xycloalkylxycloalkyl" để chỉ việc thế xycloalkyl trên vòng xycloalkyl khác, trong đó mỗi vòng xycloalkyl độc lập có từ 3 đến 7 cạnh nhân nguyên tử cacbon. Ví dụ về xycloalkylxycloalkyl bao gồm xyclopropylxyclopropyl (như 1,1'-bixyclopropyl-1-yl, 1,1'-bixyclopropyl-2-yl), xyclohexylxyclopentyl (như 4-xyclopentylxyclohexyl) và xyclohexylxyclohexyl (như 1,1'-bixyclohexyl-1-yl), và các chất đồng phân *cis*- và *trans*-xycloalkylxycloalkyl khác nhau (như (1*R*,2*S*)-1,1'-bixyclopropyl-2-yl và (1*R*,2*R*)-1,1'-bixyclopropyl-2-yl).

Thuật ngữ "halogen", khi được sử dụng riêng rẽ hoặc trong từ kết hợp như "haloalkyl" hoặc khi sử dụng trong bản mô tả như "alkyl được thế bằng halogen" bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Ngoài ra, khi sử dụng trong từ kết hợp như "haloalkyl" hoặc khi sử dụng trong bản mô tả như "alkyl được thế bằng halogen", alkyl có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng nguyên tử halogen có thể tương tự hoặc khác nhau. Ví dụ về "haloalkyl" hoặc "alkyl được thế bằng halogen" bao gồm F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 và CF_3CCl_2 . Thuật ngữ "haloalkoxy", "haloalkenyl", "haloalkynyl" và các chất tương tự, được định nghĩa tương tự như thuật ngữ "haloalkyl". Ví dụ về "haloalkoxy" bao gồm CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ và $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Ví dụ về "haloalkenyl" bao gồm $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ và $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$. Ví dụ về "haloalkynyl" bao gồm $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ và $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$.

Các ký hiệu hoá học viết tắt C(O) được sử dụng trong bản mô tả này là gốc cacbonyl. Ví dụ, C(O)CH₃ là nhóm axetyl. Các ký hiệu hoá học viết tắt CO₂ và

$C(O)O$ được sử dụng trong bản mô tả này là gốc este. Ví dụ, CO_2Me và $C(O)OMe$ là este metyl.

“OCN” nghĩa là $-O-C\equiv N$, và “SCN” nghĩa là $-S-C\equiv N$.

Tổng số nguyên tử cacbon trong phân tử thể được biểu thị bằng tiền tố “Ci-Cj” trong đó i và j bằng từ 1 đến 14. C_2 alkoxyalkyl chọn CH_3OCH_2 ; C_3 alkoxyalkyl chọn, ví dụ, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ hoặc $CH_3CH_2OCH_2$; và C_4 alkoxyalkyl chọn các chất đồng phân khác nhau của nhóm alkyl được thể bằng nhóm alkoxy chứa tổng số bốn nguyên tử cacbon, ví dụ bao gồm $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ và $CH_3CH_2OCH_2CH_2$.

Khi hợp chất được thể bằng phân tử thể mang chỉ số dưới cho thấy số lượng phân tử thể có thể vượt quá 1, phân tử thể này (khi chúng vượt quá 1) độc lập được chọn từ nhóm chứa các phân tử thể đã xác định, ví dụ, R^1 , n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4. Khi một nhóm chứa phân tử thể có thể là hydro, ví dụ R^2 hoặc R^3 , thì khi phân tử thể là hydro, hiểu rằng nó tương đương với nhóm này không được thể. Khi nhóm có thể biến đổi được thể hiện được gắn tùy ý vào một vị trí, ví dụ, $(R^v)_r$ trong U-29 của các Phụ lục 1, trong đó r có thể bằng 0, thì hydro có thể ở vị trí thậm chí không được thể hiện trong định nghĩa của nhóm có thể biến đổi. Khi một hoặc nhiều vị trí trên nhóm được nêu là “không thể” hoặc “không được thể”, thì hydro nguyên tử được gắn vào để chiếm lấy hoá trị tự do bất kỳ.

Trừ khi có quy định khác, “vòng” hoặc “hệ vòng” là thành phần có công thức 1 (ví dụ, phân tử thể Q) là vòng cacbon hoặc dị vòng. Thuật ngữ “hệ vòng” để chỉ hai hoặc nhiều vòng ngưng tụ. Thuật ngữ “nhân dị vòng” hoặc “dị vòng” dùng để chỉ nhân, trong đó ít nhất một nguyên tử tạo thành khung vòng không phải là cacbon, ví dụ, nitơ, oxy hoặc lưu huỳnh. Thông thường, nhân dị vòng chứa không nhiều hơn 4 nguyên tử nitơ, không nhiều hơn 2 nguyên tử oxy và không nhiều hơn 2 nguyên tử lưu huỳnh. Trừ khi có quy định khác, nhân dị vòng có thể là nhân bão hòa, không bão hòa một phần, hoặc không bão hòa hoàn toàn. Thuật ngữ “hệ nhân dị vòng” dùng để chỉ hệ nhân có ít nhất một nhân của hệ nhân là nhân dị vòng. Trừ khi có quy định khác, nhân dị vòng hoặc hệ nhân có thể được gắn qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ bất kỳ bằng cách thay thế nguyên tử hydro trên nguyên tử cacbon hoặc nitơ này.

Thuật ngữ “thơm” có nghĩa là mỗi nguyên tử nhân về cơ bản nằm trên cùng một mặt phẳng và có quỹ đạo p vuông góc với mặt phẳng nhân, và trong đó điện tử $(4n + 2) \pi$, khi n là số nguyên dương, liên hợp với nhân theo quy tắc Huckel. Khi nhân dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn đáp ứng quy tắc Huckel, thì nhân này cũng được gọi là “nhân dị vòng thơm”. Thuật ngữ “hệ nhân dị vòng thơm” dùng để chỉ hệ nhân dị vòng có ít nhất một nhân của hệ nhân là nhân thơm.

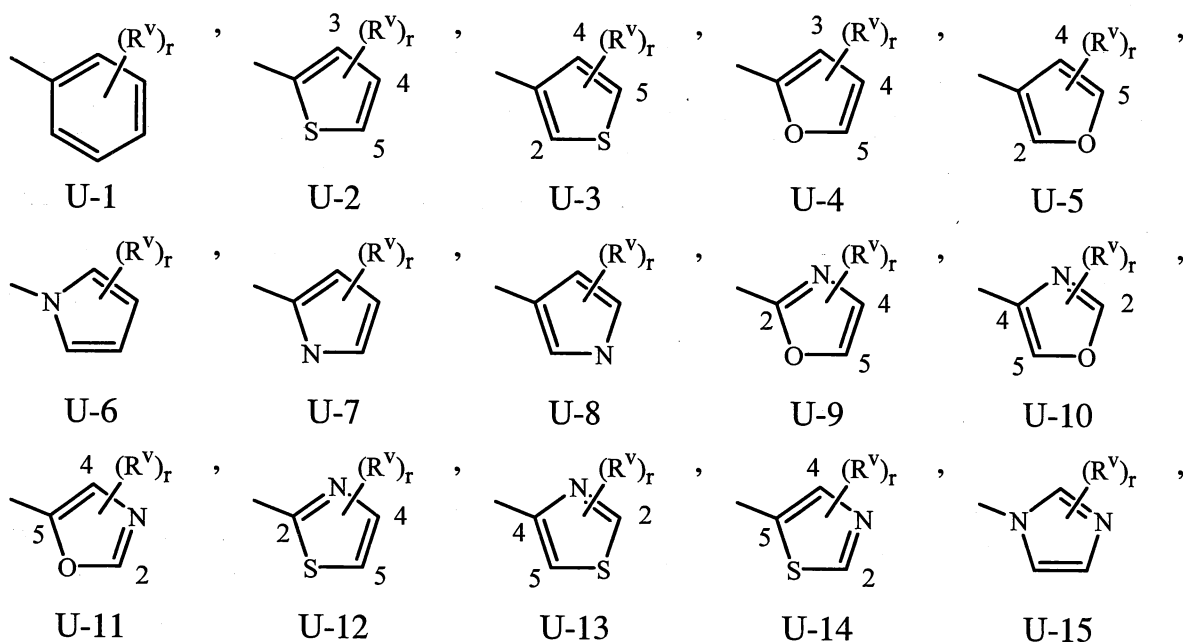
Như được sử dụng trong bản mô tả này, sẽ áp dụng các định nghĩa sau trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “tùy ý được thế” được sử dụng hoán đổi với cụm từ “được thế hoặc không được thế” hoặc với thuật ngữ “(không) được thế”. Cụm từ “tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế” có nghĩa là không có phần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

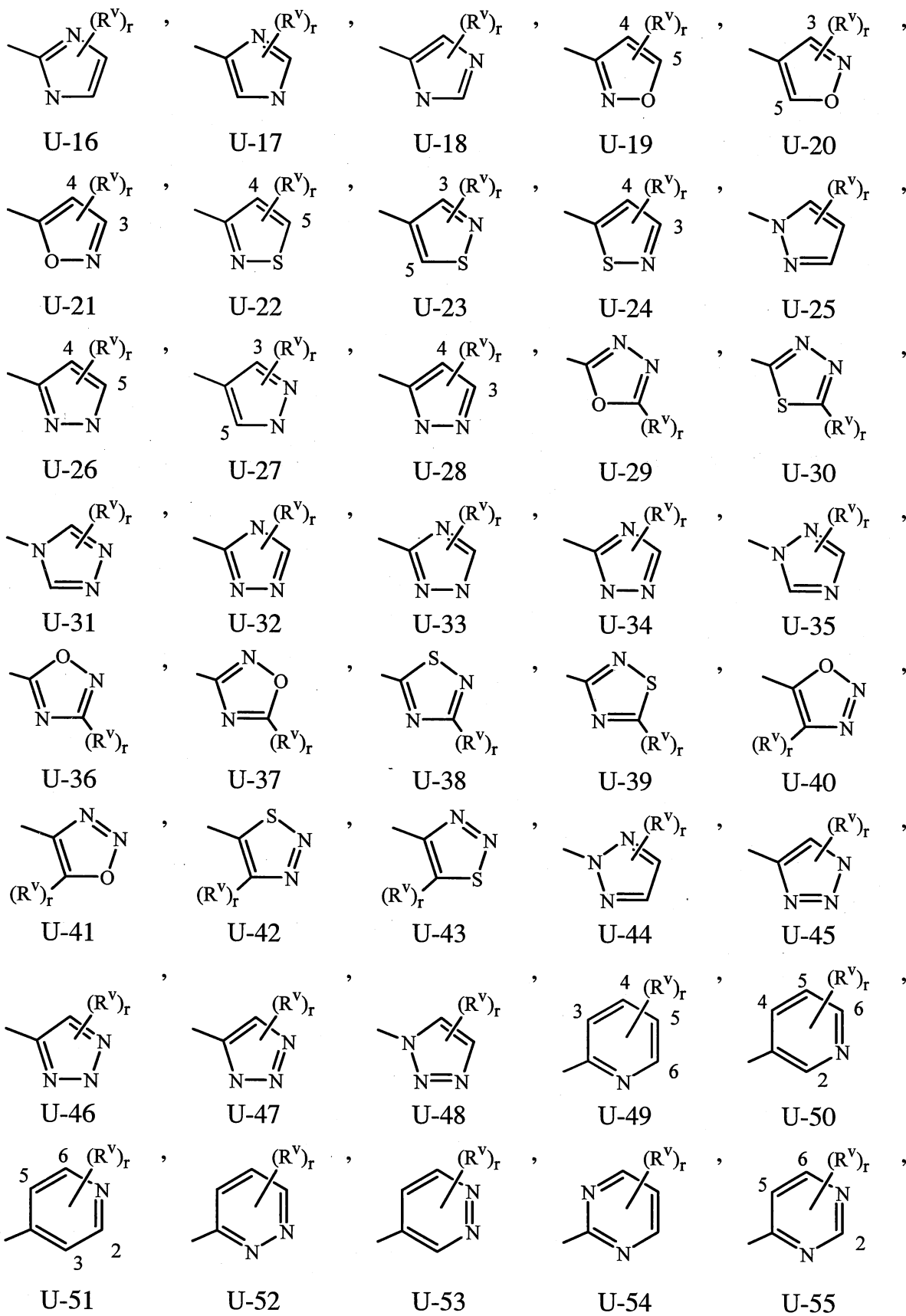
Khi một phần tử thế là nhân dị thơm chứa nitơ có 5 hoặc 6 cạnh, nó có thể được gắn vào phần còn lại có công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ trên nhân có sẵn bất kỳ, trừ khi có quy định khác.

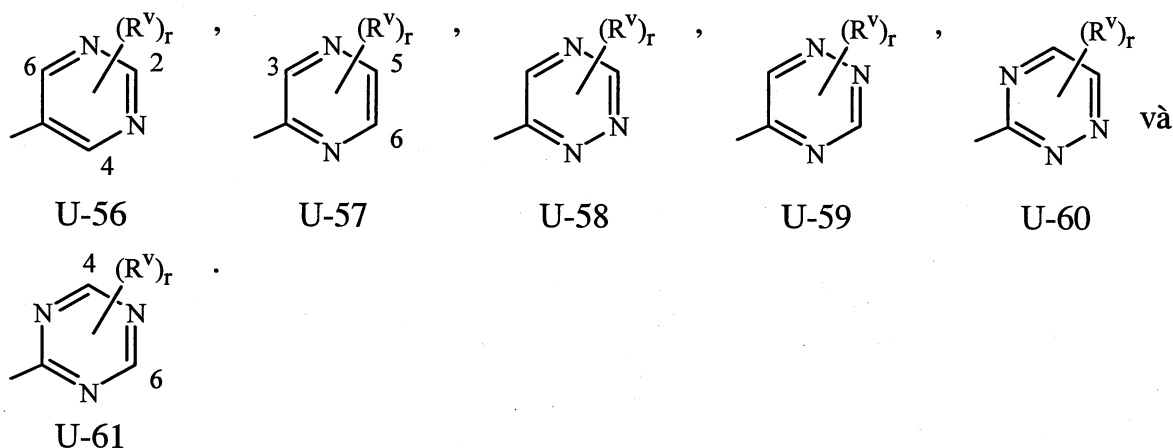
Ví dụ về phenyl tùy ý được thế bằng từ một đến ba phần tử thế là nhân được minh họa dưới dạng U-1 trong Phụ lục 1, trong đó R^V là như đã được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với R^1 , R^2 , R^3 hoặc Q và r là số nguyên từ 0 đến 5.

Ví dụ về nhân dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế bao gồm các nhân từ U-2 đến U-61 như được minh họa trong Phụ lục 1, trong đó R^V là phần tử thế bất kỳ như đã được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với R^1 , R^2 , R^3 hoặc Q và r là số nguyên từ 0 đến 4, bị hạn chế bởi số vị trí có thể trên mỗi nhóm U. Do U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 và U-43 chỉ có một vị trí có thể, đối với các nhóm U này, r bị hạn chế đến các số nguyên 0 hoặc 1 và r bằng 0 có nghĩa là nhóm U không được thế và hydro có mặt ở vị trí được biểu thị bằng $(R^V)_r$.

Phụ lục 1

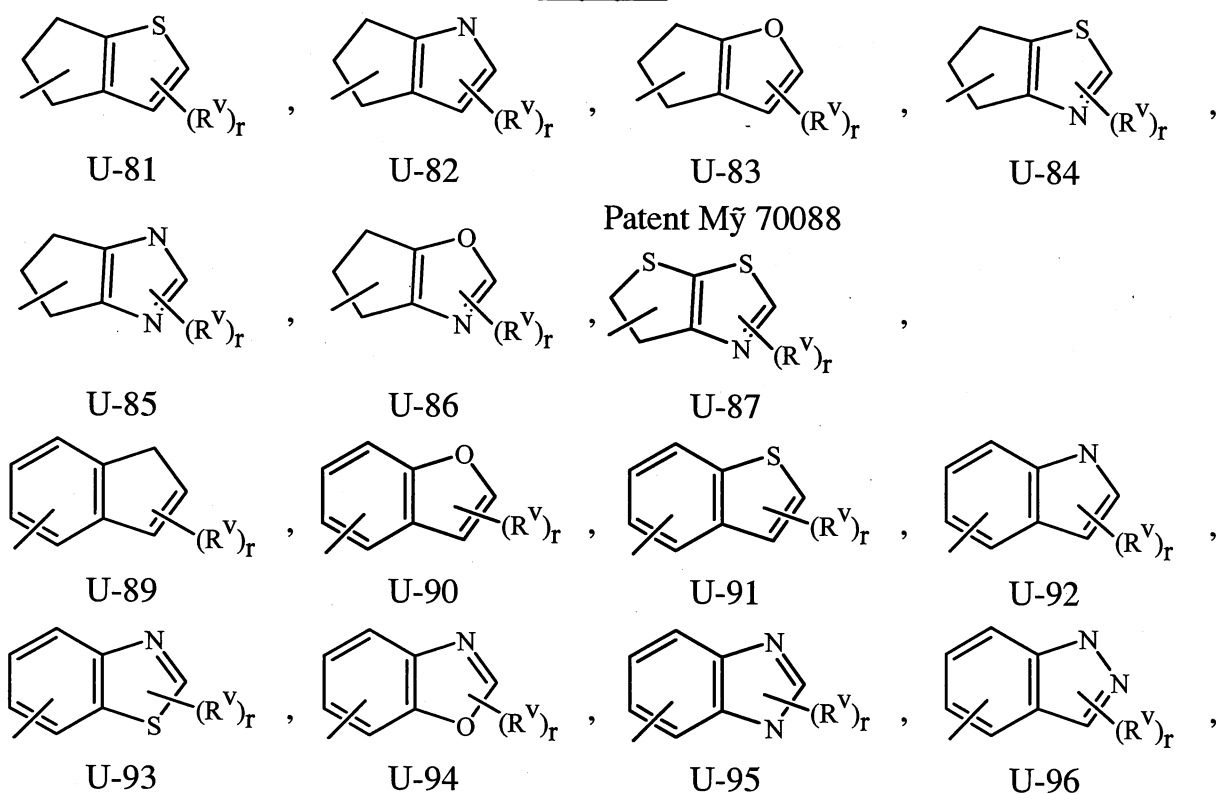


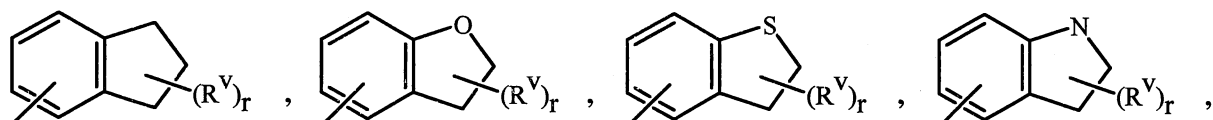




Như nêu trên, Q có thể là (trong số các cái khác) hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh tùy ý được thế bằng các phân tử thế được chọn từ nhóm các phân tử thế như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về hệ nhân hai vòng dị thơm có 8, 9 hoặc 10 cạnh tùy ý được thế bao gồm các vòng U-81 đến U-123 được minh họa trong Phụ lục 3 trong đó R^V là phân tử thế bất kỳ như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q, và r thường là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4.

Phụ lục 3



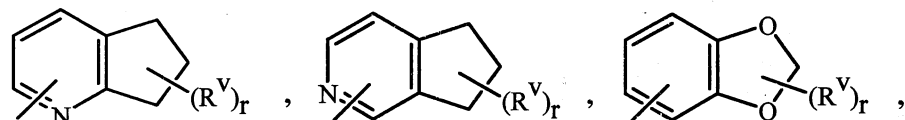


U-97

U-98

U-99

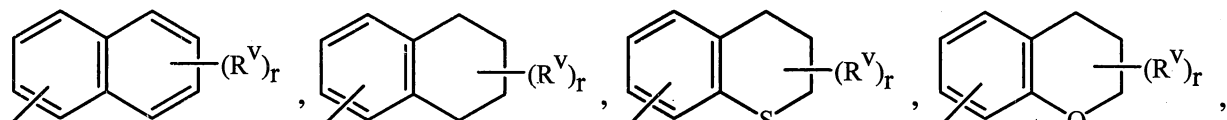
U-100



U-101

U-102

U-103

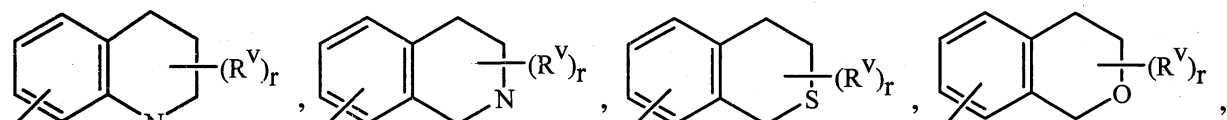


U-105

U-106

U-107

U-108

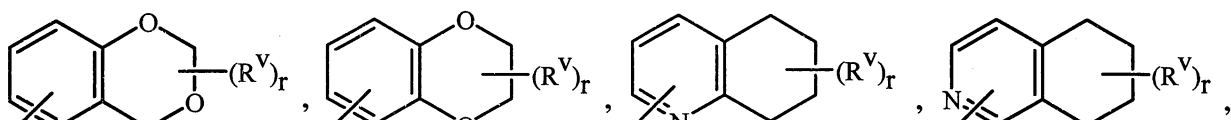


U-109

U-110

U-111

U-112

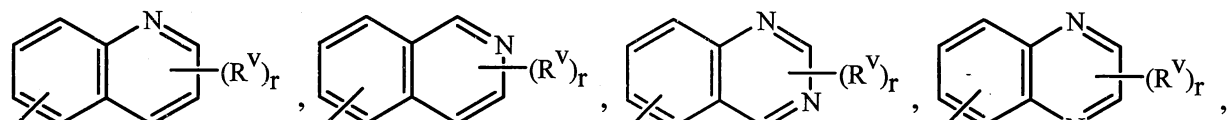


U-113

U-114

U-115

U-116

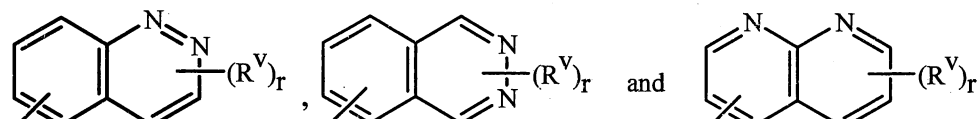


U-117

U-118

U-119

U-120



U-121

U-122

U-123

Mặc dù nhóm R^V được nêu trong các công thức cấu tạo từ U-1 đến U-123, cần lưu ý là chúng không cần phải có mặt do chúng là phần tử thế tùy ý. Nguyên tử nitơ cần có phần tử thế để làm đầy hoá trị của chúng được thế bằng H hoặc R^V . Lưu ý rằng khi điểm gắn kết giữa $(R^V)_r$ và nhóm U được minh hoạ dưới dạng nổi, $(R^V)_r$ có thể được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử nitơ có thể bất kỳ của nhóm U. Lưu ý rằng khi điểm gắn kết trên nhóm U được minh hoạ dưới dạng nổi, nhóm U có thể được gắn vào phần còn lại có công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có thể bất kỳ của nhóm U bằng cách thay thế nguyên tử hydro. Lưu ý

rằng một số nhóm U chỉ có thể được thế bằng dưới 4 nhóm R^V (ví dụ, từ U-2 đến U-5, từ U-7 đến U-48 và từ U-52 đến U-61).

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

Các hợp chất theo sáng chế có thể tồn tại ở dạng một hoặc một số chất đồng phân lập thể. Các chất đồng phân lập thể khác nhau bao gồm chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atropin và chất đồng phân dị hình. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ hiểu rằng một chất đồng phân lập thể có thể hoạt động mạnh hơn và/hoặc có thể biểu hiện các tác dụng có lợi khi được làm giàu so với chất/các chất đồng phân lập thể khác hoặc khi được tách khỏi chất/các chất đồng phân lập thể khác. Ngoài ra, người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng biết cách tách, làm giàu, và/hoặc điều chế chọn lọc các chất đồng phân lập thể này. Các hợp chất theo sáng chế có thể ở dạng hỗn hợp của chất đồng phân lập thể, chất đồng phân lập thể riêng rẽ hoặc ở dạng quang hoạt.

Hợp chất được chọn từ hợp chất có công thức 1, (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể, N-oxit, và các muối của nó), thường tồn tại ở hơn một dạng, và do đó công thức 1 bao gồm tất cả các dạng kết tinh và không kết tinh của hợp chất có công thức 1. Dạng không kết tinh bao gồm các phương án là chất rắn như sáp và gồm cũng như các phương án là chất lỏng như dung dịch và chất nóng chảy. Dạng kết tinh bao gồm các phương án về cơ bản là dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp đa hình (tức là các dạng kết tinh khác nhau). Thuật ngữ “đa hình” dùng để chỉ dạng kết tinh cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng kết tinh khác nhau, các dạng này có bố trí và/hoặc cấu hình riêng khác nhau của phân tử trong mạng tinh thể. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hoá học tương tự, chúng cũng có thể có thành phần khác do sự có mặt hoặc không có mặt của nước hoặc phân tử khác đồng kết tinh, có thể liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng tinh thể. Chất đa hình có thể khác về đặc điểm hoá học, lý học và sinh học như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ bền hoá học, điểm chảy, độ hút ẩm, khả năng tạo huyền phù, tốc độ hoà tan và độ sinh khả dụng. Người có hiểu biết trong lĩnh vực này sẽ đánh giá đúng dạng đa hình của hợp chất có công thức 1 có thể bộc lộ tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế chế phẩm hữu ích) hơn dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp chứa chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách dạng đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 có thể đạt được bằng phương pháp mà người có hiểu biết trong lĩnh

vực này đã biết kể cả, ví dụ, việc kết tinh bằng cách sử dụng dung môi và nhiệt độ được lựa chọn.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cần phải hiểu rằng không phải tất cả các dị vòng chứa nitơ đều có thể tạo thành N-oxit vì nitơ cần cặp đơn để có thể oxy hóa thành oxit; Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng cần hiểu rằng các dị vòng chứa nitơ này có thể tạo thành N-oxit. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng cần hiểu rằng amin bậc ba có thể tạo thành N-oxit. Các phương pháp tổng hợp để điều chế N-oxit của dị vòng và amin bậc ba là đã biết đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này bao gồm oxy hóa dị vòng và amin bậc ba bằng axit peroxy như axit peraxetic và axit 3-cloperbenzoic (MCPBA), hydrogen peroxit, alkyl hydroperoxit như *t*-butyl hydroperoxit, natri perborat, và dioxiran như dimetyldioxiran. Các phương pháp điều chế N-oxit này đã được mô tả rộng rãi và xem xét trong tài liệu, xem ví dụ: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler và B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton và A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett và B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler và B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press; và G. W. H. Cheeseman và E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cần hiểu rằng do trong môi trường và trong các điều kiện vật lý các muối của hợp chất hóa học ở trạng thái cân bằng với các dạng không phải là muối tương ứng, các muối này có chung mục đích sử dụng hóa học các dạng không phải là muối. Do đó, rất nhiều loại muối của hợp chất có công thức 1 có thể sử dụng để phòng trừ giun tròn ký sinh. Các muối của hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc hữu cơ như bromhydric, clohydric, nitric, phosphoric, sulfuric, axetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salixylic, tartaric, 4-toluensulfonic hoặc axit valeric. Khi hợp chất có công thức 1 chứa gốc axit như axit cacboxylic, phenol hoặc sulfonylamit (tức là khi R^3 là H), các muối cũng bao gồm các muối được tạo thành bằng các bazơ hữu cơ và vô cơ như pyridin, trietylamin hoặc amoniac, hoặc amit, hydroxua, hydroxit hoặc cacbonat của natri, kali, lithi, canxi, magie hoặc bari. Do đó, sáng chế bao gồm hợp chất được chọn từ hợp chất có công thức 1, N-oxit và các muối của chúng.

Các phương án của sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Trong các phương án sau, hợp chất có công thức 1 bao gồm các chất đồng phân lập thể, N-oxit, và muối của chúng, và "hợp chất có công thức 1" bao gồm định nghĩa của phần tử thể được nêu trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có quy định khác trong phần Các phương án thực hiện sáng chế.

Phương án 1. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là O.

Phương án 2. Hợp chất có công thức 1 trong đó Z là S.

Phương án 3. Hợp chất có công thức 1 hoặc Phương án 1 hoặc 2 trong đó mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, OR^4 , C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl.

Phương án 3a. Hợp chất theo Phương án 3 trong đó mỗi R^1 độc lập là halogen, C_1-C_6 haloalkyl hoặc C_1-C_6 haloalkoxy (tức là OR^4 và R^4 là C_1-C_6 haloalkyl).

Phương án 3b. Hợp chất theo Phương án 3a trong đó n bằng 2, và một R^1 là ở vị trí 3 của công thức 1, và R^1 thứ hai nằm ở vị trí 5 của công thức 1.

Phương án 3c. Hợp chất theo Phương án 3a hoặc 3b trong đó mỗi R^1 độc lập là halogen hoặc C_1-C_2 haloalkyl.

Phương án 3d. Hợp chất theo Phương án 3c trong đó mỗi R^1 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 3e. Hợp chất theo Phương án 3c trong đó n bằng 2, và mỗi R^1 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 3f. Hợp chất có công thức 1 trong đó n bằng 1, và R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3 của công thức 1.

Phương án 3g. Hợp chất có công thức 1 trong đó n bằng 2, và một R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3 của công thức 1, và R^1 thứ hai là Cl và nằm ở vị trí 5 của công thức 1.

Phương án 3h. Hợp chất có công thức 1 trong đó n bằng 2, và một R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3 của công thức 1, và R^1 thứ hai là Br và nằm ở vị trí 5 của công thức 1.

Phương án 3i. Hợp chất có công thức 1 trong đó n bằng 2, và một R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3 của công thức 1, và R^1 thứ hai là F và nằm ở vị trí 5 của công thức 1.

Phương án 4. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-3i trong đó Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thể độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl,

C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4a. Hợp chất theo Phương án 4 trong đó Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3 haloalkyl và $C(O)R^{7b}$; mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{7b} độc lập là C_1-C_3 alkyl.

Phương án 4b. Hợp chất theo Phương án 4 trong đó Q là phenyl, pyridinyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, furanyl hoặc thienyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4c. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là phenyl, pyridinyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, furanyl hoặc thienyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.

Phương án 4d. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4e. Hợp chất theo Phương án 4d trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3 haloalkyl và $C(O)R^{7b}$; mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{7b} độc lập là C_1-C_3 alkyl.

Phương án 4f. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

- Phương án 4g. Hợp chất theo Phương án 4f trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.
- Phương án 4h. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là pyrazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.
- Phương án 4i. Hợp chất theo Phương án 4h trong đó Q là pyrazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.
- Phương án 4j. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là oxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.
- Phương án 4k. Hợp chất theo Phương án 4j trong đó Q là oxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.
- Phương án 4l. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là thiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.
- Phương án 4m. Hợp chất theo Phương án 4l trong đó Q là thiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.
- Phương án 4n. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là isoxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6

alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$,
 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4o. Hợp chất theo Phương án 4n trong đó Q là isoxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.

Phương án 4p. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là isothiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4q. Hợp chất theo Phương án 4p trong đó Q là isothiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.

Phương án 4r. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là furanyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4s. Hợp chất theo Phương án 4r trong đó Q là furanyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.

Phương án 4t. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là thienyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 4u. Hợp chất theo Phương án 4t trong đó Q là thienyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^{4a} , C_1-C_3 alkyl và C_1-C_3 haloalkyl; và mỗi R^{4a} độc lập là C_1-C_3 alkyl hoặc C_1-C_3 haloalkyl.

Phương án 4v. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm

halogen, xyano, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(X)R^7$ và $C(O)OR^8$.

Phương án 4w. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(X)R^7$ và $C(O)OR^8$.

Phương án 4x. Hợp chất theo Phương án 4b trong đó Q là furanyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(X)R^7$ và $C(O)OR^8$.

Phương án 5. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-4x trong đó R^2 là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl.

Phương án 5a. Hợp chất theo Phương án 5 trong đó R^2 là H, F, Cl, Br hoặc C_1-C_2 alkyl.

Phương án 5b. Hợp chất theo Phương án 5a trong đó R^2 là H, Cl, Br hoặc CH_3 .

Phương án 5c. Hợp chất theo Phương án 5a trong đó R^2 là H.

Phương án 6. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-5c trong đó R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ hoặc $S(O)_mR^9$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 OR^4 .

Phương án 6a. Hợp chất theo Phương án 6 trong đó R^3 là H hoặc C_1-C_6 alkyl.

Phương án 6b. Hợp chất theo Phương án 6a trong đó R^3 là H.

Phương án 7. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-6b trong đó R^4 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Phương án 8. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-7 trong đó R^5 is H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy

ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}.

Phương án 9. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-8 trong đó R⁶ is H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl hoặc C₄-C₈ xycloalkylalkyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và OR^{4a};

Phương án 10. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-9 trong đó R⁷ is H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl, C₆-C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}.

Phương án 11. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-10 trong đó R⁸ is H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl, C₆-C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁-C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} hoặc S(O)₂NR¹¹R¹².

Phương án 12. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1-11 trong đó R⁹ là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₁-C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} hoặc S(O)₂NR¹¹R¹².

Phương án 13. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1–12 trong đó R^{10} là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl.

Phương án 14. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 1–13 trong đó R^{14} là C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 – C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11R12}$.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–14 trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và phần mô tả về các cải biến trong các phương án không những đề cập đến hợp chất có công thức 1 mà còn đề cập đến hợp chất ban đầu và hợp chất trung gian có thể sử dụng để điều chế hợp chất có công thức 1. Ngoài ra, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–14 trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, và tổ hợp bất kỳ của chúng, đề cập đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Tổ hợp của các phương án 1–14 được minh họa bởi:

Phương án A. Hợp chất có công thức 1 trong đó

Z là O; và

Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án B. Hợp chất theo Phương án A trong đó

Q là phenyl, pyridinyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, furanyl hoặc thienyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^{5R6} , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11R12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án C. Hợp chất theo Phương án B trong đó
mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, OR^4 , C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6
haloalkyl;

R^2 là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl;

R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ hoặc $S(O)_mR^9$;
hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 OR^4 ; và

n bằng 1 hoặc 2.

Các phương án đặc biệt bao gồm hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm
bao gồm:

8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxypheyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit,

8-clo-*N*-[(4-xyano-2,5-dimetylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit,

N-[(5-axetyl-2-clophenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-
2-carboxamit,

8-clo-*N*-[(3-metyl-2-thienyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-
carboxamit,

8-clo-*N*-[(4-metyl-2-thienyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-
carboxamit,

8-clo-*N*-[(3-clo-1-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo-
[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,

8-clo-*N*-[(5-metoxi-2-nitrophenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit,

8-clo-*N*-[(2-clo-5-etylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-
carboxamit,

8-clo-*N*-[(1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo-
[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,

8-bromo-*N*-[(2-clo-5-metoxypheyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit,

N-[(2-bromo-5-metylphenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit,

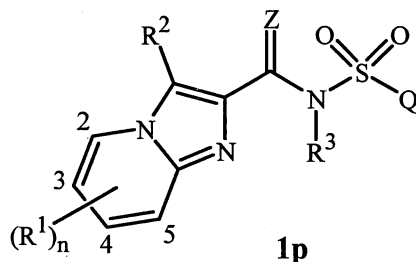
8-clo-*N*-[(2-clo-5-metylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-
carboxamit,

8-clo-*N*-[(3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit, và

N-[(5-axetyl-2-metylphenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]-
pyridin-2-carboxamit.

Các phương án khác nữa theo sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Trong các phương án sau, công thức 1p bao gồm các chất đồng phân lập thể, N-oxit, và các muối của nó, và “hợp chất có công thức 1p” bao gồm định nghĩa về các phân tử thể được nêu cụ thể trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi được xác định rõ hơn trong các phương án.

Phương án 15. Hợp chất có công thức 1p



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ hoặc $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4

alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²;

R³ là H, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ hoặc S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅–C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C₂–C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a}, N(R¹⁰)C(O)R^{7a} và R¹⁴;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R⁴ độc lập là H, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl hoặc C₂–C₆ haloalkynyl; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} hoặc S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄

alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R^{4a} độc lập là H, C₁-C₆ alkyl hoặc C₁-C₆ haloalkyl;

mỗi R⁵ độc lập là H, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ hoặc S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C₁-C₆ alkyl;

mỗi R⁶ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a};

mỗi R^{6a} độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C(O)R¹³ hoặc C(O)OR¹³;

mỗi R⁷ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R^{7a} độc lập là C₁-C₆ alkyl hoặc C₁-C₆ haloalkyl;

mỗi R^8 độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 – C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, NR^5aR^{6a} , $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{8a} độc lập là C_1 – C_6 alkyl hoặc C_1 – C_6 haloalkyl;

mỗi R^9 độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_1 – C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, NR^5aR^{6a} , $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1 – C_6 alkyl hoặc C_1 – C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn

từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng halogen, xyano, nitro, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11a}R¹², S(O)_mR^{9a} hoặc S(O)₂NR^{11a}R¹²; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11a}R¹², OR^{4a}, C₂–C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR^{11a}R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R^{10a})C(O)R^{7a};

mỗi R^{11a} độc lập là H, C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl hoặc C₂–C₆ alkynyl;

mỗi R¹² độc lập là H, C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl hoặc C₂–C₆ alkynyl;

mỗi R¹³ độc lập là H hoặc C₁–C₄ alkyl;

mỗi R¹⁴ độc lập là C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅–C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C₂–C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi m độc lập là 0, 1 hoặc 2; và

n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4.

Phương án 16. Hợp chất có công thức 1p trong đó Z là O.

Phương án 17. Hợp chất có công thức 1p trong đó Z là S.

Phương án 18. Hợp chất có công thức 1p hoặc Phương án 1 hoặc 2 trong đó mỗi R¹ độc lập là halogen, xyano, nitro, OR⁴, C₁–C₆ alkyl hoặc C₁–C₆ haloalkyl.

Phương án 18a. Hợp chất theo Phương án 18 trong đó mỗi R¹ độc lập là halogen, C₁–C₆ haloalkyl hoặc C₁–C₆ haloalkoxy (tức là OR⁴ và R⁴ là C₁–C₆ haloalkyl).

Phương án 18b. Hợp chất theo Phương án 18a trong đó n bằng 2, và một R^1 là ở vị trí 3, và R^1 thứ hai nằm ở vị trí 5.

Phương án 18c. Hợp chất theo Phương án 18a hoặc 18b trong đó mỗi R^1 độc lập là halogen hoặc C_1 – C_2 haloalkyl.

Phương án 18d. Hợp chất theo Phương án 18c trong đó mỗi R^1 độc lập là Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 18e. Hợp chất theo Phương án 18c trong đó n bằng 2, và mỗi R^1 độc lập là Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 18f. Hợp chất có công thức 1p trong đó n bằng 1, và R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3.

Phương án 18g. Hợp chất có công thức 1p trong đó n bằng 2, và một R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3, và R^1 thứ hai là Cl và nằm ở vị trí 5.

Phương án 18h. Hợp chất có công thức 1p trong đó n bằng 2, và một R^1 là CF_3 và nằm ở vị trí 3, và R^1 thứ hai là Br và nằm ở vị trí 5.

Phương án 19. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–18h trong đó Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19a. Hợp chất theo Phương án 19 trong đó Q là phenyl, pyridinyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl hoặc thienyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19b. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19c. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 alkyl, C_2 – C_4 alkenyl, C_2 – C_4 alkynyl, C_1 – C_4 haloalkyl, C_2 – C_4 haloalkenyl, C_2 – C_6

alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$,
 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19d. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là pyrazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19e. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là oxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19f. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là thiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19g. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là isoxazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19h. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là isothiazolyl tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19i. Hợp chất theo Phương án 19a trong đó Q là thienyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Phương án 19j. Hợp chất theo Phương án 19b trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^4 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(X)R^7$ và $C(O)OR^8$.

Phương án 19k. Hợp chất theo Phương án 19c trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, OR^4 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(X)R^7$ và $C(O)OR^8$.

Phương án 20. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–19k trong đó R^2 là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl.

Phương án 20a. Hợp chất theo Phương án 20 trong đó R^2 là H, F, Cl, Br hoặc C_1-C_2 alkyl.

Phương án 20b. Hợp chất theo Phương án 20a trong đó R^2 là H, Cl, Br hoặc CH_3 .

Phương án 21. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–20b trong đó R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ hoặc $S(O)_mR^9$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 OR^4 .

Phương án 21a. Hợp chất theo Phương án 21 trong đó R^3 là H hoặc C_1-C_6 alkyl.

Phương án 21b. Hợp chất theo Phương án 21a trong đó R^3 là H.

Phương án 22. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–21b trong đó R^4 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Phương án 23. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–22 trong đó R^5 is H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$.

Phương án 24. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–23 trong đó R^6 is H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl hoặc C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl và OR^{4a} ;

Phương án 25. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–24 trong đó R^7 is H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$.

Phương án 26. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–25 trong đó R^8 is H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 – C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 – C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Phương án 27. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–26 trong đó R^9 là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl hoặc C_2 – C_6 haloalkynyl; hoặc C_1 – C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 haloalkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_2 – C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Phương án 28. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–27 trong đó R^{10} là H, C_1 – C_6 alkyl, C_1 – C_6 haloalkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl.

Phương án 29. Hợp chất có công thức 1p hoặc hợp chất bất kỳ của các phương án 15–28 trong đó R^{14} là C_3 – C_7 xycloalkyl, C_4 – C_8 xycloalkylalkyl

hoặc C₅–C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ haloalkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₂–C₆ haloalkynyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ hoặc S(O)₂NR¹¹R¹².

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 15–29 trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và phần mô tả về các cải biến trong các phương án không những đề cập đến hợp chất có công thức 1p mà còn đến hợp chất ban đầu và hợp chất trung gian có thể sử dụng để điều chế hợp chất có công thức 1p. Ngoài ra, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 15–29 trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, và tổ hợp bất kỳ của chúng, đề cập đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Tổ hợp của các phương án 15–29 được minh họa bởi:

Phương án A1. Hợp chất có công thức 1p trong đó

Z là O; và

Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C₂–C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a}.

Phương án B1. Hợp chất theo Phương án A1 trong đó

Q là phenyl, pyridinyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl hoặc thienyl, mỗi nhóm tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ alkyl, C₂–C₄ alkenyl, C₂–C₄ alkynyl, C₁–C₄ haloalkyl, C₂–C₄ haloalkenyl, C₂–C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a}.

Phương án C1. Hợp chất theo Phương án B1 trong đó

mỗi R¹ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, OR⁴, C₁–C₆ alkyl hoặc C₁–C₆ haloalkyl;

R² là H, halogen hoặc C₁–C₆ alkyl;

R³ là H, C₁–C₆ alkyl, C₁–C₆ haloalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸ hoặc S(O)_mR⁹; hoặc C₁–C₆ alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 OR⁴; và

n bằng 1 hoặc 2.

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

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

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

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

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

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

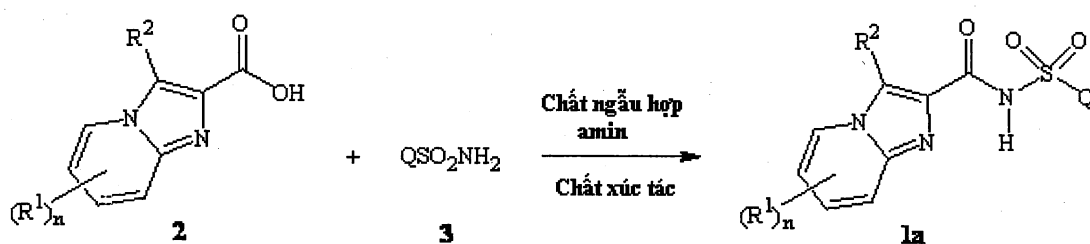
Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ hạt khỏi giun tròn ký sinh bao gồm bước cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây.

Phương án của sáng chế cũng bao gồm phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh chúng tiếp xúc với hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó với lượng hữu hiệu về mặt sinh học, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này), với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật.

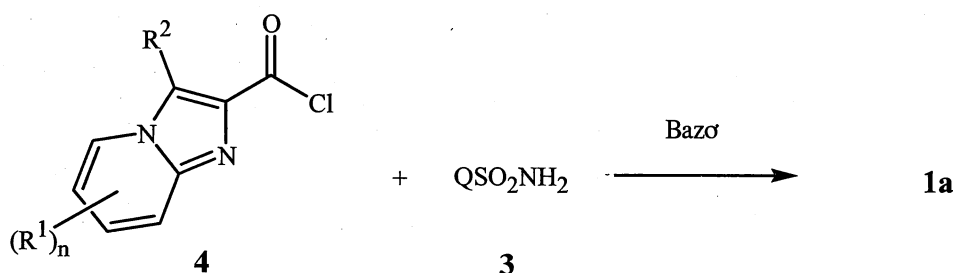
Sáng chế cũng đề xuất phương pháp, trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh chúng được cho tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó với lượng hữu hiệu về mặt sinh học và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý chứa thêm ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung với lượng hữu hiệu sinh học, với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật.

Một hoặc nhiều phương pháp trong số các phương pháp và các dạng biến đổi sau như được mô tả trên các Sơ đồ từ 1–8 có thể sử dụng để điều chế hợp chất có công thức 1. Định nghĩa về X, Q, R¹, R² và R³ trong hợp chất có công thức 1a–1c và 2–10 dưới đây là như được xác định trên đây trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, trừ khi có quy định khác. Hợp chất có công thức 1a–1c là các nhóm phụ có công thức 1 và toàn bộ các phần tử thế của hợp chất có công thức 1a–1c là như được xác định trên đây đối với hợp chất có công thức 1, trừ khi có quy định khác. Nhiệt độ trong phòng nằm trong khoảng từ 20 đến 25°C.

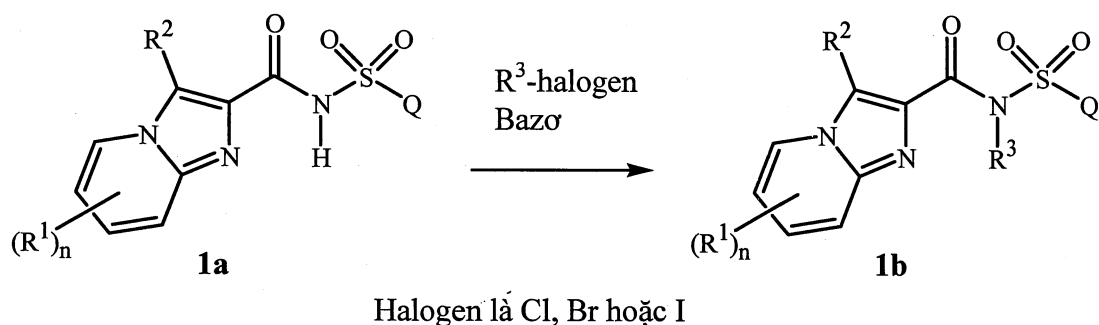
Hợp chất có công thức 1a (tức là Công thức 1 trong đó Z là oxy và R³ là H) có thể được điều chế bằng phản ứng của axit cacboxylic có công thức 2 với aryl hoặc heteroaryl sulfonamit có công thức 3 như được thể hiện trong Sơ đồ 1. Thông thường, chất ngẫu hợp amit và chất xúc tác như *N,N*-dimetylaminopyridin (DMAP) được sử dụng trong phương pháp của Sơ đồ 1. Chất ngẫu hợp amit bao gồm 1-ethyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimide hydroclorua (EDC), *N,N'*-dixyclohexylcarbodiimide (DCC) và 1,1'-carbonyldiimidazol (CDI). Phản ứng có thể được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ trong phòng đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi. Các dung môi thông thường bao gồm rượu, ete, este, amit và hydrocacbon được halogen hoá. Bước D của Ví dụ tổng hợp 1 mô tả nhóm điều kiện hữu ích cụ thể sử dụng EDC/DMAP trong hỗn hợp dung môi với tỷ lệ 1:1 của *t*-butanol và diclometan.

Sơ đồ 1

Hợp chất có công thức **1a** có thể được điều chế bằng phản ứng của clorua của axit cacboxylic có công thức **4** với aryl hoặc heteroaryl sulfonamid có công thức **3** như được thể hiện trong Sơ đồ 2. Phản ứng thường bao gồm việc sử dụng bazơ như triethylamin hoặc pyridin và tùy ý chất xúc tác như DMAP với sự có mặt của dung môi. Phản ứng có thể được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ trong phòng đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi. Các dung môi thông thường bao gồm ete, este và hydrocacbon được halogen hoá.

Sơ đồ 2

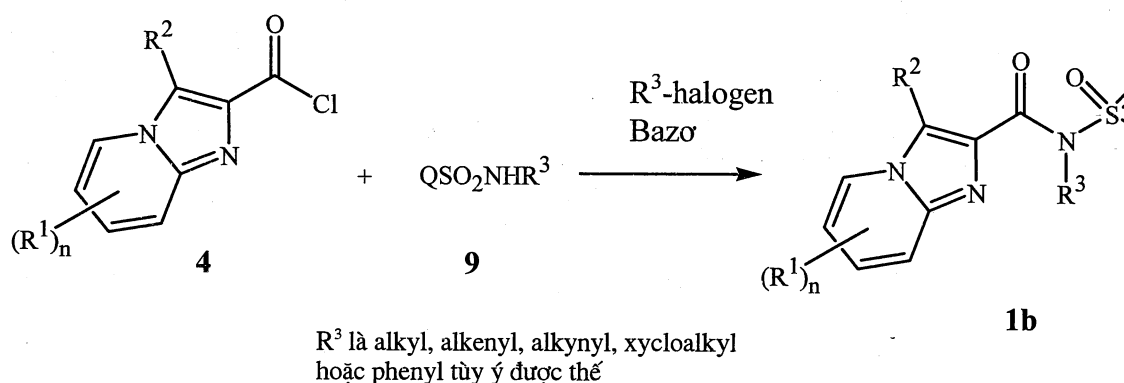
Hợp chất có công thức **1b** trong đó R^3 là alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc xycloalkyl tùy ý được thể có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức **1a** với alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc xycloalkyl halogenua và bazơ được thể thích hợp như được thể hiện trong Sơ đồ 3. Các điều kiện phản ứng thông thường bao gồm kali cacbonat ở dạng bazơ và DMF ở dạng dung môi.

Sơ đồ 3

Hợp chất có công thức 1b trong đó R^3 là $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_2R^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$ có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức 1a với axyl hoặc sulfonyl halogenua (ví dụ, $ClC(X)R^7$, $ClC(O)OR^8$, $ClC(O)NR^{11}R^{12}$, $ClS(O)_2R^9$ hoặc $ClS(O)_2NR^{11}R^{12}$) bằng phương pháp axyl hóa hoặc sulfonyl hóa đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

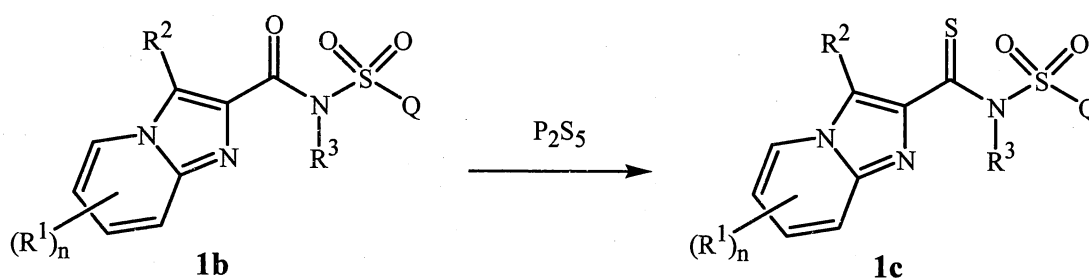
Hợp chất có công thức 1b trong đó R^3 là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl hoặc phenyl tùy ý được thể có thể được điều chế bằng phản ứng của axit clorua có công thức 4 với sulfonamit có công thức 9 như được thể hiện trong Sơ đồ 4. Theo cách khác, hợp chất có công thức 1b trong đó R^3 là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl hoặc phenyl tùy ý được thể có thể được điều chế bằng phản ứng của axit cacboxylic có công thức 2 với sulfonamit có công thức 9 bằng phương pháp của Sơ đồ 1.

Sơ đồ 4



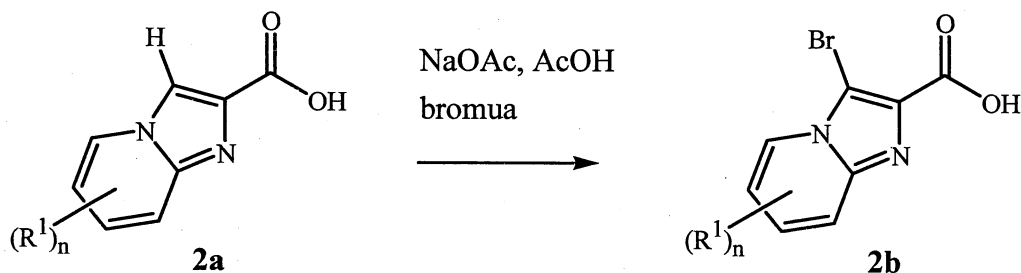
Các thioamit có công thức 1c (tức là Công thức 1 trong đó X là lưu huỳnh) có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức 1b (tức là Công thức 1 trong đó X là O) with thiation reagents như phospho pentasulfua hoặc chất phản ứng Lawesson như được thể hiện trong Sơ đồ 5.

Sơ đồ 5



Hợp chất có công thức 2b (tức là Công thức 2 trong đó R^2 là brom) có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức 2a (tức là Công thức 2 trong đó R^2 là H) với brom trong axit axetic với sự có mặt của natri axetat như được mô tả trong *Heterocycles* 2002, 57(1), 21–38.

Sơ đồ 6

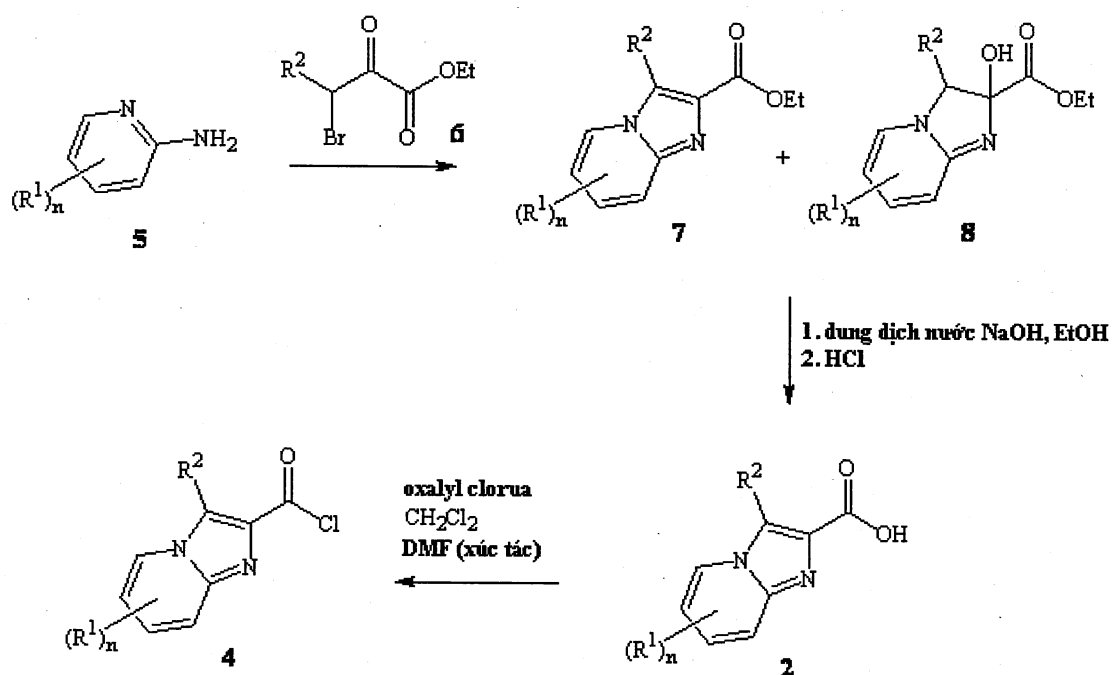


Hợp chất có công thức 2 trong đó R^2 là xyano có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức 2b với CuCN bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Hợp chất có công thức 2 trong đó R^2 là nitro có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất có công thức 2a với axit nitric/axit sulfuric như được mô tả trong *Bioorganic Med. Chem. Lett.* 2005, 15(11), 2790–2794. Hợp chất có công thức 2 trong đó R^2 là OR^4 , NR^5R^6 hoặc SR^9 có thể được điều chế từ hợp chất có công thức 2 trong đó R^2 là F bằng các phản ứng thế chuẩn đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Hợp chất có công thức 2 trong đó R^2 là F có thể được điều chế như được mô tả trong *Russian Chem. Bull.* 2005, 54(2), 470–471.

Axit cacboxylic có công thức 2 và axit clorua có công thức 4 có thể được điều chế bằng các phản ứng được thể hiện trong Sơ đồ 7. Phản ứng của 2-aminopyridin được thế thích hợp có công thức 5 với 2-bromopyruvat có công thức 6 trong đó R^2 là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, $C(O)R^7$, $C(O)OR^8$ hoặc $C(O)NR^{11}R^{12}$ tùy ý được thế, hoặc phenyl tùy ý được thế, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ trong phòng đến nhiệt độ sôi của dung môi thu được este cacboxylic có công thức 7 cùng lượng biến thiên của rượu có công thức 8. Đun nóng hỗn hợp phản ứng đến sôi trong dung môi như 1,2-dimetoxyetan thu được chuyển hóa hoàn toàn của rượu 8 thành este 7. Xử lý hỗn hợp của este 7 và 8 bằng dung dịch nước bazơ hydroxit như natri hydroxit trong dung môi trộn lẫn được với nước như etanol thu được este hydrolysis để tạo thành axit cacboxylic có công thức 2 sau khi axit hóa bằng axit mạnh như axit clohydric. Phương pháp này được mô tả chi tiết trong Bước C của Ví dụ tổng hợp 1. Axit cacboxylic có công thức 2 có thể được chuyển hóa thành

clorua axit có công thức 4 bằng các phương pháp thông thường đã biết như xử lý bằng thionyl clorua hoặc oxalyl clorua với lượng xúc tác của *N,N*-dimetylformamit (DMF) ở trạng thái phân cực vừa phải, dung môi không proton bao gồm điclotetan, đicloetan, toluen và etyl axetat. Sản phẩm trung gian có công thức 6 có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp tổng hợp đã biết, bao gồm brom hóa pyruvat hoặc lactat tùy ý được thế (este alpha-hydroxy). Các điều kiện phản ứng thông thường bao gồm brom hóa trực tiếp bằng brom (xem, ví dụ, *JACS* 1944, 66, 1656–1659) hoặc CuBr^2 trong etyl axetat/clorofom (xem, ví dụ, *JOC* 2002, 67(4), 1102–1108), hoặc phản ứng của lactat với *N*-bromosuccinimit trong CCl_4 (xem, ví dụ, *JACS* 1954, 76, 5796–5797).

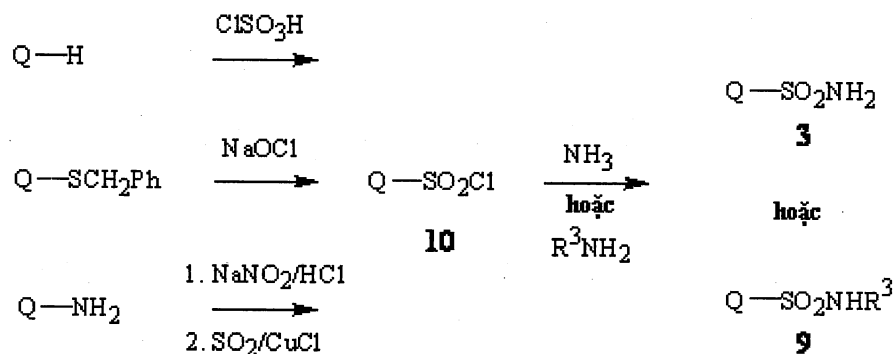
Sơ đồ 7



Sulfonamit có các công thức 3 và 9 là đã biết trong tài liệu hoá học hoặc có bán trên thị trường. Như được thể hiện trong Sơ đồ 8, sulfonamit có công thức 3 được điều chế dễ dàng từ các sulfonyl clorua tương ứng có công thức 10 bằng phản ứng với amoniac, trong khi đó sulfonamit có công thức 9 được điều chế dễ dàng từ các sulfonyl clorua tương ứng có công thức 10 bằng phản ứng với R^3NH_2 . Các sản phẩm trung gian sulfonyl clorua có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng rất nhiều phương pháp đã biết trong tài liệu. Ba trong số các phương pháp điều chế sulfonyl clorua phổ biến nhất được thể hiện trong Sơ đồ 8, bao gồm

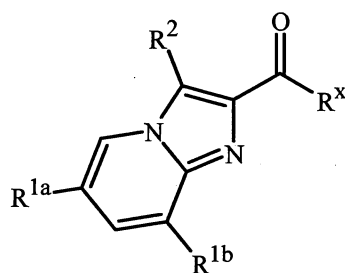
(a) closulfonyl hóa trực tiếp hệ thơm và hệ dị vòng thơm bằng axit closulfonic, (b) oxy hóa sulfua (ví dụ, bằng natri hypoclorua) với sự có mặt của axit clohydric, và (c) việc diazo hoá và closulfonyl hóa amin thơm và dị thơm. Ba phương pháp này chỉ có ý nghĩa minh họa; rất nhiều phương pháp tổng hợp khác có thể sử dụng để điều chế sulfonyl clorua và sulfonamit.

Sơ đồ 8



Ví dụ về sản phẩm trung gian có thể sử dụng để điều chế hợp chất theo sáng chế được thể hiện trong các Bảng từ I-1 đến I-12. Các từ viết tắt sau được sử dụng trong các Bảng: Me nghĩa là metyl, Et nghĩa là etyl, *i*-Pr nghĩa là isopropyl, *n*-Pr nghĩa là propyl thường, OMe nghĩa là metoxy và SMe nghĩa là thiometoxi.

Bảng I-1

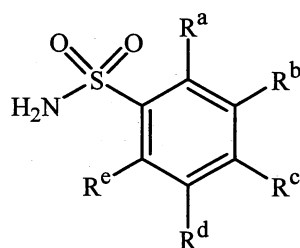


R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x
H	H	H	Cl	H	H	Cl	Cl
H	H	H	OH	H	H	Cl	OH
H	H	H	OCH ₃	H	H	Cl	OCH ₃
H	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	H	H	Cl	CF ₃	H	Cl	Cl
CF ₃	H	H	OH	CF ₃	H	Cl	OH
CF ₃	H	H	OCH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₃

R1a	R1b	R2	R ^x	R1a	R1b	R2	R ^x
CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl
CF ₃	Cl	H	OH	CF ₃	Cl	Cl	OH
CF ₃	Cl	H	OCH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₃
CF ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Br	H	Cl	CF ₃	Br	Cl	Cl
CF ₃	Br	H	OH	CF ₃	Br	Cl	OH
CF ₃	Br	H	OCH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₃
CF ₃	Br	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	H	Cl	Cl	H	Cl	Cl
Cl	H	H	OH	Cl	H	Cl	OH
Cl	H	H	OCH ₃	Cl	H	Cl	OCH ₃
Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Cl	Cl	H	OH	Cl	Cl	Cl	OH
Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
Cl	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
Br	H	H	Cl	Br	H	Cl	Cl
Br	H	H	OH	Br	H	Cl	OH
Br	H	H	OCH ₃	Br	H	Cl	OCH ₃
Br	H	H	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Br	Br	H	Cl	Br	Br	Cl	Cl
Br	Br	H	OH	Br	Br	Cl	OH
Br	Br	H	OCH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₃
Br	Br	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	H	Br	Cl	H	H	CH ₃	Cl
H	H	Br	OH	H	H	CH ₃	OH
H	H	Br	OCH ₃	H	H	CH ₃	OCH ₃
H	H	Br	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	H	Br	Cl	CF ₃	H	CH ₃	Cl
CF ₃	H	Br	OH	CF ₃	H	CH ₃	OH
CF ₃	H	Br	OCH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Cl	Br	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	Cl
CF ₃	Cl	Br	OH	CF ₃	Cl	CH ₃	OH
CF ₃	Cl	Br	OCH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃

<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R2</u>	<u>R^x</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R2</u>	<u>R^x</u>
CF ₃	Br	Br	Cl	CF ₃	Br	CH ₃	Cl
CF ₃	Br	Br	OH	CF ₃	Br	CH ₃	OH
CF ₃	Br	Br	OCH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Br	Cl	Cl	H	CH ₃	Cl
Cl	H	Br	OH	Cl	H	CH ₃	OH
Cl	H	Br	OCH ₃	Cl	H	CH ₃	OCH ₃
Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	Br	Cl	Cl	Cl	CH ₃	Cl
Cl	Cl	Br	OH	Cl	Cl	CH ₃	OH
Cl	Cl	Br	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
Cl	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Br	H	Br	Cl	Br	H	CH ₃	Cl
Br	H	Br	OH	Br	H	CH ₃	OH
Br	H	Br	OCH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₃
Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Br	Br	Br	Cl	Br	Br	CH ₃	Cl
Br	Br	Br	OH	Br	Br	CH ₃	OH
Br	Br	Br	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
Br	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃

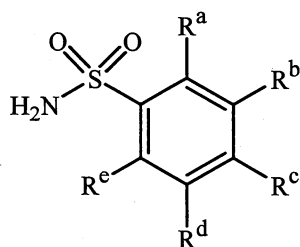
Bảng I-2



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Me	H	H	H
H	F	H	H	H	Me	F	H	H	H
H	Cl	H	H	H	Me	Cl	H	H	H
H	Br	H	H	H	Me	Br	H	H	H
H	CF ₃	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H
H	xyano	H	H	H	Me	xyano	H	H	H

H	OMe	H	H	H	Me	OMe	H	H	H
H	SMe	H	H	H	Me	SMe	H	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	Me	H	H	H	Cl	Me	H	H	H
F	F	H	H	H	Cl	F	H	H	H
F	Cl	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H
F	Br	H	H	H	Cl	Br	H	H	H
F	CF ₃	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H
F	xyano	H	H	H	Cl	xyano	H	H	H
F	OMe	H	H	H	Cl	OMe	H	H	H
F	SMe	H	H	H	Cl	SMe	H	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	Me	H	H	H	CF ₃	Me	H	H	H
Br	F	H	H	H	CF ₃	F	H	H	H
Br	Cl	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H
Br	Br	H	H	H	CF ₃	Br	H	H	H
Br	CF ₃	H	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H
Br	xyano	H	H	H	CF ₃	xyano	H	H	H
Br	OMe	H	H	H	CF ₃	OMe	H	H	H
Br	SMe	H	H	H	CF ₃	SMe	H	H	H
xyano	H	H	H	H	xyano	Br	H	H	H
xyano	Me	H	H	H	xyano	CF ₃	H	H	H
xyano	F	H	H	H	xyano	xyano	H	H	H
xyano	Cl	H	H	H	xyano	OMe	H	H	H
					xyano	SMe	H	H	H

Bảng I-2a

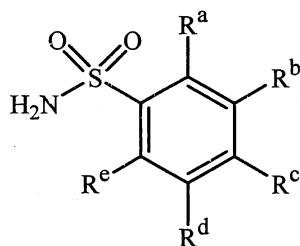


<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	Me	H	Me	H	H	Me	H
H	H	H	Et	H	Me	H	H	Et	H

H	H	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	H	H	<i>i</i> -Pr	H
H	H	H	F	H	Me	H	H	F	H
H	H	H	Cl	H	Me	H	H	Cl	H
H	H	H	Br	H	Me	H	H	Br	H
H	H	H	CF ₃	H	Me	H	H	CF ₃	H
H	H	H	xyano	H	Me	H	H	xyano	H
H	H	H	OMe	H	Me	H	H	OMe	H
H	H	H	Oet	H	Me	H	H	OEt	H
H	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
H	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	Me	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
H	H	H	SMe	H	Me	H	H	SMe	H
H	H	H	C(O)CH ₃	H	Me	H	H	C(O)CH ₃	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	Me	H	Cl	H	H	Me	H
F	H	H	Et	H	Cl	H	H	Et	H
F	H	H	<i>i</i> -Pr	H	Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	H
F	H	H	F	H	Cl	H	H	F	H
F	H	H	Cl	H	Cl	H	H	Cl	H
F	H	H	Br	H	Cl	H	H	Br	H
F	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	CF ₃	H
F	H	H	xyano	H	Cl	H	H	xyano	H
F	H	H	OMe	H	Cl	H	H	OMe	H
F	H	H	Oet	H	Cl	H	H	OEt	H
F	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
F	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
F	H	H	SMe	H	Cl	H	H	SMe	H
F	H	H	C(O)CH ₃	H	Cl	H	H	C(O)CH ₃	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	Me	H
Br	H	H	Et	H	CF ₃	H	H	Et	H
Br	H	H	<i>i</i> -Pr	H	CF ₃	H	H	<i>i</i> -Pr	H
Br	H	H	F	H	CF ₃	H	H	F	H
Br	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H	Cl	H
Br	H	H	Br	H	CF ₃	H	H	Br	H
Br	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H
Br	H	H	xyano	H	CF ₃	H	H	xyano	H
Br	H	H	OMe	H	CF ₃	H	H	OMe	H

Br	H	H	Oet	H	CF ₃	H	H	OEt	H
Br	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
Br	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
Br	H	H	SMe	H	CF ₃	H	H	SMe	H
Br	H	H	C(O)CH ₃	H	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	H
xyano	H	H	H	H	xyano	H	H	CF ₃	H
xyano	H	H	Me	H	xyano	H	H	xyano	H
xyano	H	H	Et	H	xyano	H	H	OMe	H
xyano	H	H	<i>i</i> -Pr	H	xyano	H	H	OEt	H
xyano	H	H	F	H	xyano	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
xyano	H	H	Cl	H	xyano	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
xyano	H	H	Br	H	xyano	H	H	SMe	H
					xyano	H	H	C(O)CH ₃	H

Bảng I-2b

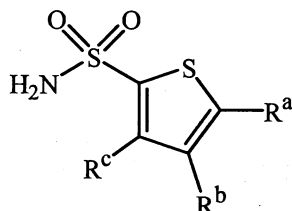


<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>
H	H	F	H	H	Cl	H	F	H	H
H	H	F	Cl	H	Cl	H	F	Cl	H
H	H	F	Br	H	Cl	H	F	Br	H
H	H	F	Me	H	Cl	H	F	Me	H
H	H	F	Et	H	Cl	H	F	Et	H
H	H	F	OMe	H	Cl	H	F	OMe	H
H	H	F	axetyl	H	Cl	H	F	axetyl	H
H	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
H	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H
H	H	Cl	Br	H	Cl	H	Cl	Br	H
H	H	Cl	Me	H	Cl	H	Cl	Me	H
H	H	Cl	Et	H	Cl	H	Cl	Et	H
H	H	Cl	OMe	H	Cl	H	Cl	OMe	H
H	H	Cl	axetyl	H	Cl	H	Cl	axetyl	H
H	H	Br	H	H	Cl	H	Br	H	H

H	H	Br	Cl	H	Cl	H	Br	Cl	H
H	H	Br	Br	H	Cl	H	Br	Br	H
H	H	Br	Me	H	Cl	H	Br	Me	H
H	H	Br	Et	H	Cl	H	Br	Et	H
H	H	Br	OMe	H	Cl	H	Br	OMe	H
H	H	Br	axetyl	H	Cl	H	Br	axetyl	H
H	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
H	H	Me	Cl	H	Cl	H	Me	Cl	H
H	H	Me	Br	H	Cl	H	Me	Br	H
H	H	Me	Me	H	Cl	H	Me	Me	H
H	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	Et	H
H	H	Me	OMe	H	Cl	H	Me	OMe	H
H	H	Me	axetyl	H	Cl	H	Me	axetyl	H
Br	H	F	H	H	Me	H	F	H	H
Br	H	F	Cl	H	Me	H	F	Cl	H
Br	H	F	Br	H	Me	H	F	Br	H
Br	H	F	Me	H	Me	H	F	Me	H
Br	H	F	Et	H	Me	H	F	Et	H
Br	H	F	OMe	H	Me	H	F	OMe	H
Br	H	F	axetyl	H	Me	H	F	axetyl	H
Br	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
Br	H	Cl	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H
Br	H	Cl	Br	H	Me	H	Cl	Br	H
Br	H	Cl	Me	H	Me	H	Cl	Me	H
Br	H	Cl	Et	H	Me	H	Cl	Et	H
Br	H	Cl	OMe	H	Me	H	Cl	OMe	H
Br	H	Cl	axetyl	H	Me	H	Cl	axetyl	H
Br	H	Br	H	H	Me	H	Br	H	H
Br	H	Br	Cl	H	Me	H	Br	Cl	H
Br	H	Br	Br	H	Me	H	Br	Br	H
Br	H	Br	Me	H	Me	H	Br	Me	H
Br	H	Br	Et	H	Me	H	Br	Et	H
Br	H	Br	OMe	H	Me	H	Br	OMe	H
Br	H	Br	axetyl	H	Me	H	Br	axetyl	H
Br	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
Br	H	Me	Cl	H	Me	H	Me	Cl	H
Br	H	Me	Br	H	Me	H	Me	Br	H
Br	H	Me	Me	H	Me	H	Me	Me	H

Br	H	Me	Et	H	Me	H	Me	Et	H
Br	H	Me	OMe	H	Me	H	Me	OMe	H
Br	H	Me	axetyl	H	Me	H	Me	axetyl	H

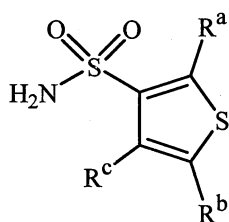
Bảng I-3



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br
H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			
Br	H	Br	Et	H	Br			
Br	Me	H	Et	Me	H			
Br	Me	Me	Et	Me	Me			
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl			
Br	Me	Br	Et	Me	Br			
Br	Et	H	Et	Et	H			

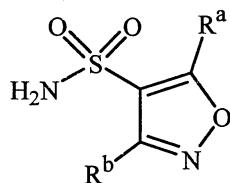
Br	Et	Me	Et	Et	Me
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl
Br	Et	Br	Et	Et	Br
Br	Cl	H	Et	Cl	H
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br

Bảng I-4



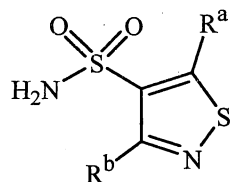
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			
Et	H	Cl	Br	H	Cl			
Et	Me	H	Br	Me	H			
Et	Me	Me	Br	Me	Me			
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl			
Et	Et	H	Br	Et	H			
Et	Et	Me	Br	Et	Me			
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl			

Bảng I-5



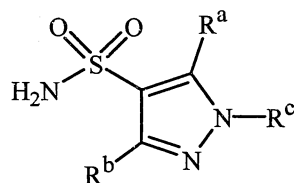
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

Bảng I-6



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

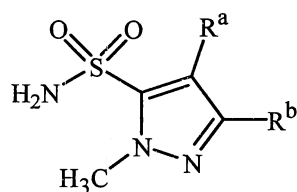
Bảng I-7



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me

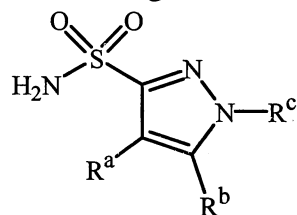
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

Bảng I-8



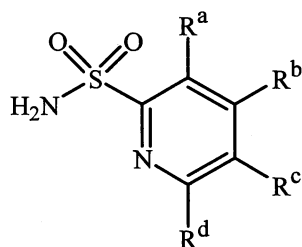
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	<i>i</i> -Pr	Me	<i>i</i> -Pr	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	<i>i</i> -Pr
H	<i>n</i> -Pr	Me	<i>n</i> -Pr	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	<i>n</i> -Pr

Bảng I-9



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

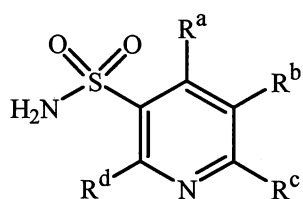
Bảng I-10



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
Me	H	H	H	Cl	H	H	H
Me	H	H	Me	Cl	H	H	Me

Me	H	H	Ome	Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H	Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me	Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	Ome	Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H	Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me	Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	Ome	Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H	Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me	Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	Ome	Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	Ome	Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H	Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	Ome	Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H	Br	OMe	Me	H
Br	H	H	Me	Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	Ome	Br	OMe	Me	OMe
Br	OMe	H	H	Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me	Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	Ome	Br	Me	H	OMe
Br	H	Me	H	Br	Me	Me	H
Br	H	Me	Me	Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	Ome	Br	Me	Me	OMe

Bảng I-11

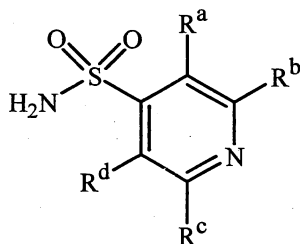


<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃	Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl

H	H	H	Br	Me	H	H	Br
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br	Me	H	Me	Br
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H
H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H
H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me

H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

Bảng I-12



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

Đã biết rằng, một số chất phản ứng và phản ứng các điều kiện được mô tả ở trên để điều chế hợp chất có công thức 1 có thể không tương thích với một số chức năng có trong các sản phẩm trung gian. Trong một số trường hợp, sự kết hợp bộ bảo vệ/khử bảo vệ hoặc sự hoán chuyển nhóm chức trong quá trình tổng hợp sẽ hỗ trợ tạo ra các sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ sẽ là hiển nhiên đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật tổng hợp hoá học (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ hiểu rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng đã định như được mô tả trong sơ đồ riêng lẻ bất kỳ, có thể cần thực hiện thêm các bước tổng hợp thông thường không được mô tả chi tiết để hoàn thành quy trình tổng hợp hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ hiểu rằng có thể cần thực hiện kết hợp các bước được minh hoạ trong các sơ đồ nêu trên

theo một thứ tự ngoài thứ tự được đưa ra theo bộ cụ thể để điều chế hợp chất có công thức 1.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ hiểu rằng hợp chất có công thức 1 và các sản phẩm trung gian theo sáng chế có thể được đưa vào các phản ứng ái điện tử, ái nhân, gốc, hữu cơ-kim loại, oxy hoá, và khử khác nhau để bổ sung phân tử thế hoặc cải biến phân tử thế đang tồn tại.

Không cần nghiên cứu kỹ hơn, bằng cách sử dụng phân mô tả nêu trên tin rằng người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng sáng chế ở mức tối đa. Các ví dụ tổng hợp sau, vì vậy, được hiểu chỉ có ý nghĩa minh họa, và không làm giới hạn phân mô tả theo bất kỳ cách nào. Các bước trong Ví dụ tổng hợp sau minh họa quy trình cho từng bước trong quá trình biến đổi tổng hợp chung và nguyên liệu ban đầu trong từng bước có thể không cần thiết được điều chế bằng các quy trình điều chế cụ thể sử dụng toàn bộ quy trình được mô tả trong các Ví dụ hoặc Bước khác. Phổ ^1H NMR được tính theo ppm từ tetrametylsilan; “s” nghĩa là vạch đơn, “d” nghĩa là vạch đôi, “dd” nghĩa là cặp vạch đôi, “br s” nghĩa là vạch đơn rộng. Nhiệt độ trong phòng nằm trong khoảng từ 20–25°C.

Ví dụ thực hiện sáng chế**Ví dụ tổng hợp 1**

Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxyphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Bước A: Điều chế 2-clo-5-metoxybenzensulfonyl clorua

Bình 3 cổ được gắn kèm bình ngưng đá khô được bổ sung axit axetic (80mL) và đồng clorua (0,8 g). Hỗn hợp được làm lạnh đến 0°C, lưu huỳnh đioxit (5mL) được ngưng tụ vào bình phản ứng, và tiếp theo hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 30 phút. Các bình đáy tròn 200 mL riêng rẽ được bổ sung axit clohydric đặc (32mL), axit axetic (8mL) và 2-clo-5-metylanilin hydroclorua (3,2g, 16 mmol). Hỗn hợp này được làm lạnh đến 0°C, và natri nitrit (1,25g, 18,1 mmol) trong nước (8mL) được bổ sung từng giọt trong khi vẫn giữ nhiệt độ dưới 10°C. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 30 phút và tiếp theo được cho từng giọt vào dung dịch lưu huỳnh đioxit. Hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 1 h. Nước được bổ sung từng giọt, và chất rắn màu nâu vàng kết tủa. Chất rắn này được tách bằng cách lọc và rửa bằng nước để thu được 2,5 g hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,64 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 3,89 (s, 3H).

Bước B: Điều chế 2-clo-5-metoxybenzensulfonamit

Dung dịch của 2-clo-5-metoxybenzensulfonyl clorua (2,5g, 10,4 mmol) (tức là sản phẩm của Bước A) trong tetrahydrofuran (30mL) được bổ sung 30% amoni hydroxit (3,0 mL, 25,7 mmol) từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, huyền phù được tạo thành trong khoảng thời gian này. Hỗn hợp này được bổ sung nước (10mL), và tetrahydrofuran được làm bay hơi trong điều kiện áp suất giảm để thu được nước huyền phù của chất rắn màu nâu vàng. Chất rắn này được tách bằng cách lọc và rửa bằng nước để thu được 2,2 g hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,63 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 5,13 (br s, 2H), 3,85 (s, 3H).

Bước C: Điều chế axit 8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxylic

Dung dịch của 2-amino-3-clo-5-(triflometyl)pyridin (24,7g, 126 mmol) trong 1,2-dimethoxyetan (260mL) ở 0°C được bổ sung etyl bromopyruvat (17,43 mL, 138 mmol) từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và được khuấy trong ba ngày để tạo thành huyền phù. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng được

chiết bằng diclometan (2 x 200mL) và rửa bằng nước (2 x 200mL). Phần chiết diclometan gộp lại được làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn rắn. Phần rửa nước gộp lại được bão hoà bằng natri cacbonat, được chiết bằng etyl axetat (2 x 200mL), và làm khô bằng magie sulfat. Phần chiết etyl axetat gộp lại và phần cặn thu được từ phần cô đặc của diclometan được gộp lại, và hỗn hợp này được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn.

Chất rắn này được hoà tan trong etanol (800mL), và dung dịch natri hydroxit 50% (40g, 500 mmol) kết hợp với bổ sung nước (150mL) được bổ sung từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm để tạo thành huyền phù. Hỗn hợp phản ứng được axit hóa đến pH 2 bằng axit clohydric đặc và tiếp theo làm lạnh và khuấy trong vài giờ để kết tủa chất rắn. Sản phẩm rắn được tách bằng cách lọc sử dụng phễu lọc bằng thủy tinh, rửa bằng nước, và làm khô bằng không khí trong điều kiện dòng không khí qua đêm để thu được 13 g hợp chất nêu ở đề mục ở dạng chất rắn. ^1H NMR (CDCl_3) δ 8,51 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,55 (s, 1H).

Bước D: Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxyphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Axit cacboxylic từ Bước C (243 mg, 0,92 mmol) được bổ sung dung dịch của 4-(dimethylamino)pyridin (340 mg, 2,76 mmol) và 1-(3-dimethyl-aminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (232 mg, 2,3 mmol) trong *t*-butanol (5mL) và diclometan (5mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, 2-clo-5-metoxybenzensulfonamit (190 mg, 0,86 mmol) được bổ sung, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, diclometan (200mL) được bổ sung, hỗn hợp được chiết bằng axit clohydric 1N (3 x 100mL), và pha hữu cơ riêng rẽ được làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được rửa nhẹ bằng dietyl ete để thu được 240 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn màu trắng, điểm nóng chảy 211-212°C. ^1H NMR (CDCl_3) δ 10,10 (br s, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,54 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,09 (dd, 1H), 3,91 (s, 3H).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế 8-clo-*N*-[(4-xyano-2,5-dimethylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Bước A: Điều chế 4-bromo-2,5-dimethylbenzensulfonamit

Axit closulfonic (4,2 mL, 63 mmol) được làm lạnh đến 10°C được bổ sung 2-bromo-*p*-xylen (5,0g, 27 mmol) từng giọt trong 15 phút. Hỗn hợp phản ứng được khuấy thêm trong 10 phút, và tiếp theo được rót kết hợp khuấy vào 125 mL đá vụn để kết tủa chất rắn màu trắng. Chất rắn này được tách bằng cách lọc và rửa bằng nước. Chất rắn này được hoà tan trong tetrahydrofuran (40mL) và dung dịch amoni hydroxit 30% (8,0mL) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 10 phút và cô trong điều kiện áp suất giảm để kết tủa chất rắn màu trắng. Chất rắn này được tách bằng cách lọc và rửa bằng nước để thu được 4,6 g hợp chất nêu ở đề mục ở dạng chất rắn. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,87 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 4,75 (br s, 2H), 2,61 (s, 3H), 2,41 (s, 3H).

Bước B: Điều chế 4-xyano-2,5-dimethylbenzensulfonamit

Dung dịch của 4-bromo-2,5-dimethylbenzensulfonamit (4,6g, 22 mmol, sản phẩm của Bước A) trong *N*-metyl pyrrolidinon (30mL) được bổ sung đồng xyanua (2,5g, 28 mmol), và hỗn hợp phản ứng được đun nóng ở 200°C trong 30 phút. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng được để nguội và rót vào 200mL đá vụn để kết tủa chất rắn. Hỗn hợp này được bổ sung diclometan (500mL), và hỗn hợp được làm ấm để hòa tan chất rắn màu trắng. Tiếp theo, hỗn hợp được lọc để loại bỏ phần rắn không tan bất kỳ, các pha được tách, và diclometan được rửa bằng nước (2 x 100mL), làm khô bằng magie sulfat, và làm bay hơi trong điều kiện áp suất giảm để thu được dầu. Dầu này được hoà tan trong tetrahydrofuran (30mL) và nước (30mL), và dung dịch được cô trong điều kiện áp suất giảm để kết tủa chất rắn. Chất rắn này được tách bằng lọc và rửa bằng nước để thu được 2,5 g hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,98 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 4,89 (br s, 2H), 2,66 (s, 3H), 2,58 (s, 3H).

Bước C: Điều chế 8-clo-*N*-[(4-xyano-2,5-dimethylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Dung dịch của axit 8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxylic (2,5g, 9,5 mmol, được điều chế như được mô tả trong Ví dụ 1 Bước C) trong *t*-butanol (70mL) và diclometan (70mL) được bổ sung 4-(dimethylamino)pyridin (3,47g, 28,4 mmol) và 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (4,54g, 23,7 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút sau đó 4-xyano-2,5-dimethylbenzensulfonamit (1,85g, 8,85 mmol) được bổ sung, và tiếp tục khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, diclometan (200mL) được bổ sung,

hỗn hợp được rửa bằng axit clohydric 1N (3 x 100mL), pha hữu cơ được gộp lại và làm khô bằng magie sulfat và tiếp theo được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được tách bằng lọc, rửa nhẹ bằng dietyl ete, và tái kết tinh ra khỏi hexan/etyl axetat để thu được 1,5 g hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn, điểm nóng chảy 228-229°C. ^1H NMR (CDCl_3) δ 9,97 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,54 (s, 1H), 2,71 (s, 3H), 2,63 (s, 3H).

Ví dụ tổng hợp 3

Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-etylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Bước A: Điều chế 2-clo-5-etylbenzenesulfonyl clorua

Axit closulfonic (4,0 mL, 59 mmol) được làm lạnh đến 0°C và 1-clo-4-etylbenzen (1,0 mL, 7,5 mmol) được bổ sung từng giọt trong 30 phút. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 45 phút ở 0°C, rót kết hợp khuấy vào 125 mL đá vụn, và tiếp theo được chiết bằng etyl axetat (2 x 100mL). Lớp etyl axetat được gộp lại, rửa bằng nước (100mL), và làm khô bằng magie sulfat. Etyl axetat được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được dầu được xác định là khoảng hỗn hợp chất đồng phân với tỷ lệ 1:1. Hỗn hợp này được sắc ký trên gel oxit silic rửa giải bằng gradien hexan/etyl axetat để thu được 0,41 g hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,97 (s, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 2,75 (q, 2H), 1,29 (t, 3H).

Bước B: Điều chế 2-clo-5-etylbenzenesulfonamit

Dung dịch của 2-clo-5-etylbenzenesulfonyl clorua (0,41g, 1,7 mmol, sản phẩm của Bước A) trong tetrahydrofuran (30mL) được bổ sung 30% amoni hydroxit (0,41 mL, 3,5 mmol) từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, huyền phù được tạo thành trong khoảng thời gian này. Hỗn hợp này được bổ sung nước (10mL), và tetrahydrofuran được làm bay hơi trong điều kiện áp suất giảm để kết tủa chất rắn. Chất rắn này được hoà tan trong dietyl ete, làm khô bằng magie sulfat, và cô trong điều kiện áp suất giảm. Dietyl ete và hexan được bổ sung để kết tủa chất rắn. Chất rắn này được tách bằng lọc để thu được 190 mg hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,95 (s, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,08 (br s, 2H), 2,71 (q, 2H), 1,25 (t, 3H).

Bước C: Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-etylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Dung dịch của axit 8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxylic (100 mg, 0,38 mmol, được điều chế như được mô tả trong Ví dụ 1 Bước C) trong hỗn hợp 1:1 của *t*-butanol (5mL) và diclometan (5mL) được bổ sung 4-(đimetylaminopyridin (138 mg, 1,1 mmol) và 1-(3-đimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (182 mg, 0,95 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, 2-clo-5-etylbenzensulfonamit (74 mg, 0,34 mmol) được bổ sung, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm. Tiếp theo, diclometan (100mL) được bổ sung, hỗn hợp được rửa bằng axit clohydric 1N (3 x 50mL), và pha hữu cơ được làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được rửa nhẹ bằng dietyl ete để thu được 84 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn, điểm nóng chảy 214-215°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 10,12 (br s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,40 (s, 2H), 2,77 (q, 2H), 1,30 (t, 3H).

Ví dụ tổng hợp 4

Điều chế 8-clo-*N*-[(1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Bước A: Điều chế 1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonamit

Dung dịch của 1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonylclorua (0,154g, 0,73 mmol, Matrix Scientific) trong tetrahydrofuran (10mL) được bổ sung từng giọt dung dịch nước của 30% amoni hydroxit (0,20 mL, 1,7 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 1 giờ, nước (2mL) được bổ sung, và dung môi được cô trong điều kiện áp suất giảm để kết tủa chất rắn. Chất rắn này được tách bằng lọc, rửa nhẹ bằng nước, và làm khô để thu được 41 mg hợp chất nêu ở đề mục. ¹H NMR (CDCl₃) δ 7,80 (s, 1H), 4,75 (br s, 1H), 4,11 (q, 2H), 2,44 (s, 3H), 1,49 (t, 3H).

Bước B: Điều chế 8-clo-*N*-[(1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Dung dịch của 8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-axit cacboxylic (63 mg, 0,24 mmol, được điều chế như được mô tả trong Ví dụ 1 Bước C) trong hỗn hợp 1:1 của *t*-butanol (5mL) và diclometan (5mL) được bổ sung 4-

(đimetylaminopyridin (88 mg, 0,71 mmol) và 1-(3-đimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (117 mg, 0,60 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, sau đó 1-ethyl-3-methyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonamid (41 mg, 0,22 mmol, sản phẩm của Bước A) được bổ sung, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Diclometan (100mL) được bổ sung và hỗn hợp được rửa bằng axit clohydric 1N (3 x 50mL). Pha hữu cơ được tách, làm khô bằng magie sulfat, và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được tạo huyền phù trong hỗn hợp của diethyl ete và hexan, lọc, và làm khô để thu được 25 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn, điểm nóng chảy 189-190°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 9,85 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 4,14 (q, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,51 (t, 3H).

Ví dụ tổng hợp 5

Điều chế 8-clo-*N*-[(3-clo-1-ethyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamid

Bước A: Điều chế 1-ethyl-1*H*-pyrazol-3-ylamin

Dung dịch kali cacbonat (2,76g, 20,0 mmol) trong nước (10mL) được bổ sung ethyl hydrazin oxalat (3,0g, 20 mmol) tiếp theo bổ sung từng giọt 2-cloacrylonitril (1,6 mL, 20 mmol) trong 30 phút. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 2 h, và tiếp theo được đun nóng ở 50°C trong 2 h. Hỗn hợp phản ứng được làm nguội và được chiết bằng ethyl axetat (2 x 100mL). Ethyl axetat được làm khô bằng magie sulfat và làm bay hơi trong điều kiện áp suất giảm để thu được dầu. Dầu này được sắc ký trên gel oxit silic rửa giải bằng hexan và ethyl axetat ở dạng dung môi rửa giải để thu được 540 mg hợp chất nêu ở đề mục. ¹H NMR (CDCl₃) δ 7,12 (d, 1H) 5,57 (d, 1H), 3,96 (q, 2 H), 3,59 (br s, 1H), 1,42 (t, 3H).

Bước B: Điều chế 3-clo-1-ethyl-1*H*-pyrazol

Dung dịch của 1-ethyl-1*H*-pyrazol-3-ylamin (0,54g, 4,86 mmol, sản phẩm của Bước A) trong axit clohydric đặc (5mL) ở 0°C được bổ sung dung dịch natri nitrit (369 mg, 5,35 mmol) trong nước (1mL) từng giọt trong khi vẫn duy trì nhiệt độ dưới 10°C. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 30 phút, dung dịch đồng (I) clorua trong axit clohydric đặc (2mL) được bổ sung từng giọt, và hỗn hợp phản ứng thu được tiếp theo đun nóng đến 60°C. Lượng xúc tác của đồng clorua được

bổ sung ở 60°C (khởi mào sự giải phóng khí). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 5 phút và tiếp theo được rót vào 100 mL đá vụn chứa 50% natri hydroxit (5mL) và khuấy kỹ. Hỗn hợp nước được chiết bằng điclorometan (2 x 150mL), và lớp hữu cơ được tách, rửa bằng nước, làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được 0,42 g hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,31 (d, 1H), 6,15 (d, 1H), 4,11 (q, 2H), 1,47 (t, 3H).

Bước C: Điều chế 3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonyl clorua

3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol (0,42g, 3,2 mmol, sản phẩm của Bước B) được bổ sung vào axit closulfonic (2,0 mL, 30 mmol) ở nhiệt độ trong phòng và hỗn hợp được làm ấm từ từ đến 100°C, và tiếp theo được đun nóng ở 100-110°C trong 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm nguội, rót kết hợp khuấy vào 150 mL đá vụn, và được chiết vào dietyl ete (2 x 100mL). Phần chiết ete được gộp lại, rửa bằng nước (100mL), làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được 0,5 g hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất dầu. ^1H NMR (CDCl_3) δ 8,00 (s, 1 H), 4,20 (q, 2 H), 1,56 (t, 3H).

Bước D: Điều chế 3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonamit

Dung dịch của 3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonyl clorua (0,5 g, 2,2 mmol, sản phẩm của Bước C) trong tetrahydrofuran (20mL) được bổ sung 30% amoni hydroxit (3,0 mL, 24 mmol) từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được đun nóng đến sôi bằng súng nhiệt và tiếp theo được khuấy trong 30 phút. Tetrahydrofuran được loại ra trong điều kiện áp suất giảm, nước (50mL) được bổ sung, hỗn hợp phản ứng được chiết vào etyl axetat (2 x 100mL). Etyl axetat được làm khô bằng magie sulfat và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được rửa bằng hexan, và làm khô để thu được 282 mg hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,84 (s, 1H), 4,94 (br s, 1H), 4,15 (q, 2H), 1,51 (t, 3H).

Bước E: Điều chế 8-clo-*N*-[(3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Dung dịch của axit 8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxylic (110 mg, 0,42 mmol, được điều chế như được mô tả trong Ví dụ 1 Bước C) trong hỗn hợp 1:1 của *t*-butanol (5mL) và điclorometan (5mL) được bổ sung 4-(đimetylaminopyridin (152 mg, 1,25 mmol) và 1-(3-đimetylaminopropyl)-3-

ethylcarbodiimide hydrochloride (96 mg, 0,5 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, sau đó 3-clo-1-ethyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonamide (81 mg, 0,38 mmol, sản phẩm của Bước D) được bổ sung và tiếp tục khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, diclometan (100mL) được bổ sung và hỗn hợp được chiết bằng axit clohydric 1N (3 x 50mL). Pha hữu cơ riêng rẽ được gộp lại, làm khô bằng magie sulfate, và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được tạo huyền phù trong hỗn hợp của diethyl ete và hexan và lọc để thu được 85 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn, điểm nóng chảy 184-185°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 9,96 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,54 (s, 1H), 4,17 (q, 2H), 1,54 (t, 3H).

Ví dụ tổng hợp 6

Điều chế 8-bromo-*N*-[(2-clo-5-metoxyphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamide

Bước A: Điều chế 8-bromo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-axit cacboxylic

Dung dịch của 2-amino-3-bromo-5-(triflometyl)pyridin (10,0g, 41,5 mmol) trong 1,2 dimetoxietan (300mL) ở nhiệt độ trong phòng được bổ sung ethyl bromopyruvate (9,889g, 45,64 mmol) từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được đun hồi lưu trong 18 giờ. 1,2-dimetoxietan được loại ra trong điều kiện áp suất giảm và phần rắn còn lại được tái kết tinh ra khỏi 1-clobutan. Chất rắn này được tách bằng lọc và làm khô để thu được chất rắn màu trắng nhờ, axit 8-bromo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-cacboxylic, ethyl este (11,044 g).

Chất rắn thu được trên đây được hòa tan trong tetrahydrofuran (150mL) và dung dịch của LiOH (2,353g, 98,29 mmol) trong nước (100mL) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Tetrahydrofuran được loại ra trong điều kiện áp suất giảm để thu được dung dịch nước được làm nguội đến 5°C. HCl loãng được bổ sung từng giọt cho đến khi đạt được độ pH < 5,0. Sau vài phút chất rắn bắt đầu kết tủa ra khỏi dung dịch. Chất rắn này được gộp lại bằng cách lọc, rửa một lần bằng nước (50mL), và làm khô trong tủ sấy chân không trong 18 h ở 80°C để thu được 8,632 g hợp chất nêu ở đề mục ở dạng chất rắn. ¹H NMR (dmsd-d₆) δ 13,17 (br s, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,03 (s, 1H).

Bước B: Điều chế 8-bromo-*N*-[(2-clo-5-metoxyphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Sản phẩm của Bước A (200 mg, 0,647 mmol) được bổ sung dung dịch của 4-(đimetylaminopyridin (237 mg, 1,94 mmol) và 1-(3-đimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (309 mg, 1,62 mmol) trong hỗn hợp 1:1 của *t*-butanol (5mL) và diclometan (5mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, 2-clo-5-metoxybenzensulfonamit (129 mg, 0,582 mmol) được bổ sung, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Diclometan (200mL) tiếp theo được bổ sung, hỗn hợp được chiết bằng axit clohydric 1N (3 x 100mL), và pha hữu cơ riêng rẽ được gộp lại, làm khô bằng magie sulfat, và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được rửa nhẹ bằng dietyl ete để thu được 234 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn màu trắng, điểm nóng chảy 191-192°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 10,1 (br s, 1H), 8,51 (s, 1H), 8,30 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,08 (dd, 1H) 3,91 (s, 3H).

Ví dụ tổng hợp 7

Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxyphenyl)sulfonyl]-3-metyl-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Bước A: Điều chế etyl este của axit 3-bromo-2-oxo-butyric

Axit 2-Oxo-butyric (10,0g, 97,2 mmol) được hoà tan trong etanol (100mL) và mono hydrat của axit *p*-toluen sulfonic (0,1 g) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được đun hồi lưu trong 48 h. Sau khi làm nguội hỗn hợp phản ứng đến nhiệt độ trong phòng, etanol được loại bỏ trong điều kiện áp suất giảm để tạo ra 11,4 g etyl este của axit 2-oxo-butyric.

Etyl este của axit 2-oxo-butyric được điều chế trên đây được hoà tan trong clorofom (100mL) và brom (20,964g, 131,19 mmol) được bổ sung từng giọt ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được để khuấy trong 18 giờ. Cô hỗn hợp phản ứng trong điều kiện áp suất giảm thu được 12,0 g hợp chất nêu ở đề mục ở dạng dầu màu da cam. ¹H NMR (CDCl₃) δ 4,39 (q, 2H), 4,32 (q, 1H), 1,88 (d, 3H), 1,39 (t, 3H).

Bước B: Điều chế axit 8-clo-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-cacboxylic

Dung dịch 2-amino-3-clo-5-(triflometyl)pyridin (11,3g, 57,5 mmol) trong đioxan (200mL) ở nhiệt độ trong phòng được bổ sung từng giọt etyl este của axit 3-bromo-2-oxo-butyric (12,017g, 57,49 mmol, sản phẩm của Bước A). Hỗn hợp phản ứng được đun hồi lưu trong 24 h, làm nguội, và đioxan được loại ra trong điều kiện áp suất giảm. Sắc ký trên gel oxit silic rửa giải bằng gradien hexan/etyl axetat thu được 17,3 g etyl este của axit 8-clo-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-cacboxylic ở dạng chất rắn.

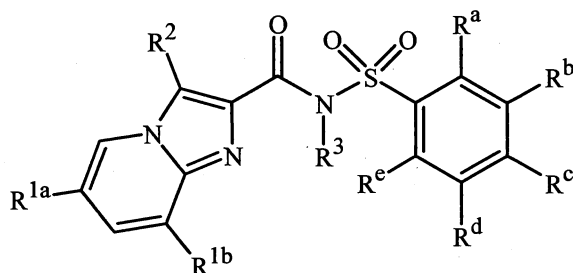
Chất rắn này được điều chế trên đây được hoà tan trong tetrahydrofuran (100mL) và dung dịch LiOH (3,365g, 140,8 mmol) trong nước (50mL) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Tetrahydrofuran được loại ra trong điều kiện áp suất giảm để thu được dung dịch nước được làm nguội đến 5°C. HCl loãng được bổ sung từng giọt cho đến khi đạt được độ pH < 5,0. Sau vài phút chất rắn bắt đầu kết tủa. Chất rắn này được gộp lại bằng cách lọc, rửa bằng nước (50mL), và làm khô ở 80°C trong tủ sấy chân không trong 18 h để thu được 15,7 g chất rắn. ¹H NMR (dms_o-d₆) δ 13,1 (br s, 1H), 8,84 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 2,82 (s, 3H).

Bước C: Điều chế 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxypheⁿyl)sulfonyl]-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit

Axit cacboxylic được điều chế trong Bước B (200 mg, 0,72 mmol) được bổ sung dung dịch của 4-(đimetylaminopyridin (262 mg, 2,15 mmol) và 1-(3-đimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimitt hydroclorua (344 mg, 1,79 mmol) trong hỗn hợp dung môi với tỷ lệ 1:1 của *t*-butanol (5mL) và điclotetan (5mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 15 phút, 2-clo-5-metoxypheⁿylsulfonamit (143 mg, 0,65 mmol) được bổ sung, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, điclotetan (200mL) được bổ sung, hỗn hợp được chiết bằng axit clohydric 1N (3 x 100mL), và các lớp hữu cơ riêng rẽ được gộp lại, làm khô bằng magie sulfat, và cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn. Chất rắn này được rửa nhẹ bằng dietyl ete để thu được 118 mg hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn màu trắng, điểm nóng chảy 222-223°C. ¹H NMR (dms_o-d₆) δ 10,0 (br s, 1H), 8,94 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,30 (dd, 1H), 3,87 (s, 3H) 2,71 (s, 3H).

Bằng các quy trình được mô tả trong bản mô tả này cùng với các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này, có thể điều chế được các hợp chất của các Bảng từ 1 đến 22 dưới đây. Các từ viết tắt sau được sử dụng trong các Bảng: Me nghĩa là metyl, Et nghĩa là etyl, OMe nghĩa là metoxy, Sme nghĩa là methylthio, và NMe₂ nghĩa là dimethylamino.

Bảng 1



R^{1a} là CF₃, R^{1b} là Cl, R² và R³ là H

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^e</u>
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Me	H	H	H
H	Et	H	H	H	Me	Et	H	H	H
H	F	H	H	H	Me	F	H	H	H
H	Cl	H	H	H	Me	Cl	H	H	H
H	Br	H	H	H	Me	Br	H	H	H
H	CF ₃	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H
H	xyano	H	H	H	Me	xyano	H	H	H
H	OMe	H	H	H	Me	OMe	H	H	H
H	SMe	H	H	H	Me	SMe	H	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	Me	H	H	H	Cl	Me	H	H	H
F	Et	H	H	H	Cl	Et	H	H	H
F	F	H	H	H	Cl	F	H	H	H
F	Cl	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H
F	Br	H	H	H	Cl	Br	H	H	H
F	CF ₃	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H
F	xyano	H	H	H	Cl	xyano	H	H	H
F	OMe	H	H	H	Cl	OMe	H	H	H
F	SMe	H	H	H	Cl	SMe	H	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	Me	H	H	H	CF ₃	Me	H	H	H
Br	Et	H	H	H	CF ₃	Et	H	H	H
Br	F	H	H	H	CF ₃	F	H	H	H

Br	Cl	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H
Br	Br	H	H	H	CF ₃	Br	H	H	H
Br	CF ₃	H	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H
Br	xyano	H	H	H	CF ₃	xyano	H	H	H
Br	OMe	H	H	H	CF ₃	OMe	H	H	H
Br	SMe	H	H	H	CF ₃	SMe	H	H	H
xyano	H	H	H	H	xyano	Br	H	H	H
xyano	Me	H	H	H	xyano	CF ₃	H	H	H
xyano	Et	H	H	H	xyano	xyano	H	H	H
xyano	F	H	H	H	xyano	OMe	H	H	H
xyano	Cl	H	H	H	xyano	SMe	H	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Et	H	H	Me	H	Et	H	H
H	H	F	H	H	Me	H	F	H	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Br	H	H	Me	H	Br	H	H
H	H	CF ₃	H	H	Me	H	CF ₃	H	H
H	H	xyano	H	H	Me	H	xyano	H	H
H	H	OMe	H	H	Me	H	OMe	H	H
H	H	SMe	H	H	Me	H	SMe	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Et	H	H	Cl	H	Et	H	H
F	H	F	H	H	Cl	H	F	H	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Br	H	H	Cl	H	Br	H	H
F	H	CF ₃	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H
F	H	xyano	H	H	Cl	H	xyano	H	H
F	H	OMe	H	H	Cl	H	OMe	H	H
F	H	SMe	H	H	Cl	H	SMe	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Et	H	H	CF ₃	H	Et	H	H
Br	H	F	H	H	CF ₃	H	F	H	H
Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Br	H	H	CF ₃	H	Br	H	H
Br	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H

Br	H	xyano	H	H	CF ₃	H	xyano	H	H
Br	H	OMe	H	H	CF ₃	H	OMe	H	H
Br	H	SMe	H	H	CF ₃	H	SMe	H	H
xyano	H	H	H	H	xyano	H	Br	H	H
xyano	H	Me	H	H	xyano	H	CF ₃	H	H
xyano	H	Et	H	H	xyano	H	xyano	H	H
xyano	H	F	H	H	xyano	H	OMe	H	H
xyano	H	Cl	H	H	xyano	H	SMe	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	Me	H	Me	H	H	Me	H
H	H	H	Et	H	Me	H	H	Et	H
H	H	H	F	H	Me	H	H	F	H
H	H	H	Cl	H	Me	H	H	Cl	H
H	H	H	Br	H	Me	H	H	Br	H
H	H	H	CF ₃	H	Me	H	H	CF ₃	H
H	H	H	xyano	H	Me	H	H	xyano	H
H	H	H	OMe	H	Me	H	H	OMe	H
H	H	H	SMe	H	Me	H	H	SMe	H
H	H	H	CO ₂ Me	H	Me	H	H	CO ₂ Me	H
H	H	H	C(O)Me	H	Me	H	H	C(O)Me	H
H	H	H	NMe ₂	H	Me	H	H	NMe ₂	H
H	H	H	nitro	H	Me	H	H	nitro	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	Me	H	Cl	H	H	Me	H
F	H	H	Et	H	Cl	H	H	Et	H
F	H	H	F	H	Cl	H	H	F	H
F	H	H	Cl	H	Cl	H	H	Cl	H
F	H	H	Br	H	Cl	H	H	Br	H
F	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	CF ₃	H
F	H	H	xyano	H	Cl	H	H	xyano	H
F	H	H	OMe	H	Cl	H	H	OMe	H
F	H	H	SMe	H	Cl	H	H	SMe	H
F	H	H	CO ₂ Me	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
F	H	H	C(O)Me	H	Cl	H	H	C(O)Me	H
F	H	H	NMe ₂	H	Cl	H	H	NMe ₂	H
F	H	H	nitro	H	Cl	H	H	nitro	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	Me	H

Br	H	H	Et	H	CF ₃	H	H	Et	H
Br	H	H	F	H	CF ₃	H	H	F	H
Br	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H	Cl	H
Br	H	H	Br	H	CF ₃	H	H	Br	H
Br	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H
Br	H	H	xyano	H	CF ₃	H	H	xyano	H
Br	H	H	OMe	H	CF ₃	H	H	OMe	H
Br	H	H	SMe	H	CF ₃	H	H	SMe	H
Br	H	H	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H
Br	H	H	C(O)Me	H	CF ₃	H	H	C(O)Me	H
Br	H	H	NMe ₂	H	CF ₃	H	H	NMe ₂	H
Br	H	H	nitro	H	CF ₃	H	H	nitro	H
xyano	H	H	H	H	xyano	H	H	xyano	H
xyano	H	H	Me	H	xyano	H	H	OMe	H
xyano	H	H	Et	H	xyano	H	H	SMe	H
xyano	H	H	F	H	xyano	H	H	CO ₂ Me	H
xyano	H	H	Cl	H	xyano	H	H	C(O)Me	H
xyano	H	H	Br	H	xyano	H	H	NMe ₂	H
xyano	H	H	CF ₃	H	xyano	H	H	nitro	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	H	Me	Me	H
H	H	Me	Et	H	Me	H	Me	Et	H
H	H	Me	F	H	Me	H	Me	F	H
H	H	Me	Cl	H	Me	H	Me	Cl	H
H	H	Me	Br	H	Me	H	Me	Br	H
H	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	CF ₃	H
H	H	Me	xyano	H	Me	H	Me	xyano	H
H	H	Me	OMe	H	Me	H	Me	OMe	H
H	H	Me	SMe	H	Me	H	Me	SMe	H
H	H	Me	CO ₂ Me	H	Me	H	Me	CO ₂ Me	H
H	H	Me	C(O)Me	H	Me	H	Me	C(O)Me	H
H	H	Me	NMe ₂	H	Me	H	Me	NMe ₂	H
H	H	Me	nitro	H	Me	H	Me	nitro	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Me	Me	H	Cl	H	Me	Me	H
F	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	Et	H
F	H	Me	F	H	Cl	H	Me	F	H
F	H	Me	Cl	H	Cl	H	Me	Cl	H

F	H	Me	Br	H	Cl	H	Me	Br	H
F	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	CF ₃	H
F	H	Me	xyano	H	Cl	H	Me	xyano	H
F	H	Me	OMe	H	Cl	H	Me	OMe	H
F	H	Me	SMe	H	Cl	H	Me	SMe	H
F	H	Me	CO ₂ Me	H	Cl	H	Me	CO ₂ Me	H
F	H	Me	C(O)Me	H	Cl	H	Me	C(O)Me	H
F	H	Me	NMe ₂	H	Cl	H	Me	NMe ₂	H
F	H	Me	nitro	H	Cl	H	Me	nitro	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Me	Me	H	CF ₃	H	Me	Me	H
Br	H	Me	Et	H	CF ₃	H	Me	Et	H
Br	H	Me	F	H	CF ₃	H	Me	F	H
Br	H	Me	Cl	H	CF ₃	H	Me	Cl	H
Br	H	Me	Br	H	CF ₃	H	Me	Br	H
Br	H	Me	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	CF ₃	H
Br	H	Me	xyano	H	CF ₃	H	Me	xyano	H
Br	H	Me	OMe	H	CF ₃	H	Me	OMe	H
Br	H	Me	SMe	H	CF ₃	H	Me	SMe	H
Br	H	Me	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Me	CO ₂ Me	H
Br	H	Me	C(O)Me	H	CF ₃	H	Me	C(O)Me	H
Br	H	Me	NMe ₂	H	CF ₃	H	Me	NMe ₂	H
Br	H	Me	nitro	H	CF ₃	H	Me	nitro	H
xyano	H	Me	H	H	xyano	H	Me	xyano	H
xyano	H	Me	Me	H	xyano	H	Me	OMe	H
xyano	H	Me	Et	H	xyano	H	Me	SMe	H
xyano	H	Me	F	H	xyano	H	Me	CO ₂ Me	H
xyano	H	Me	Cl	H	xyano	H	Me	C(O)Me	H
xyano	H	Me	Br	H	xyano	H	Me	NMe ₂	H
xyano	H	Me	CF ₃	H	xyano	H	Me	nitro	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Cl	Me	H	Me	H	Cl	Me	H
H	H	Cl	Et	H	Me	H	Cl	Et	H
H	H	Cl	F	H	Me	H	Cl	F	H
H	H	Cl	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H
H	H	Cl	Br	H	Me	H	Cl	Br	H
H	H	Cl	CF ₃	H	Me	H	Cl	CF ₃	H
H	H	Cl	xyano	H	Me	H	Cl	xyano	H

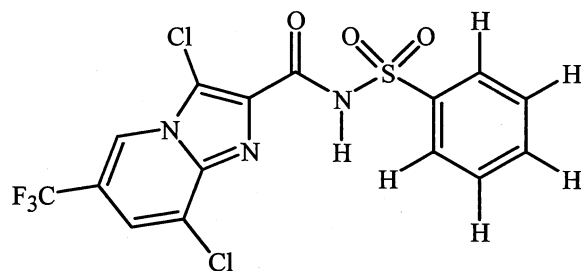
H	H	Cl	OMe	H	Me	H	Cl	OMe	H
H	H	Cl	SMe	H	Me	H	Cl	SMe	H
H	H	Cl	CO ₂ Me	H	Me	H	Cl	CO ₂ Me	H
H	H	Cl	C(O)Me	H	Me	H	Cl	C(O)Me	H
H	H	Cl	NMe ₂	H	Me	H	Cl	NMe ₂	H
H	H	Cl	nitro	H	Me	H	Cl	nitro	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Cl	Me	H	Cl	H	Cl	Me	H
F	H	Cl	Et	H	Cl	H	Cl	Et	H
F	H	Cl	F	H	Cl	H	Cl	F	H
F	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H
F	H	Cl	Br	H	Cl	H	Cl	Br	H
F	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	Cl	CF ₃	H
F	H	Cl	xyano	H	Cl	H	Cl	xyano	H
F	H	Cl	OMe	H	Cl	H	Cl	OMe	H
F	H	Cl	SMe	H	Cl	H	Cl	SMe	H
F	H	Cl	CO ₂ Me	H	Cl	H	Cl	CO ₂ Me	H
F	H	Cl	C(O)Me	H	Cl	H	Cl	C(O)Me	H
F	H	Cl	NMe ₂	H	Cl	H	Cl	NMe ₂	H
F	H	Cl	nitro	H	Cl	H	Cl	nitro	H
Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Cl	Me	H	CF ₃	H	Cl	Me	H
Br	H	Cl	Et	H	CF ₃	H	Cl	Et	H
Br	H	Cl	F	H	CF ₃	H	Cl	F	H
Br	H	Cl	Cl	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H
Br	H	Cl	Br	H	CF ₃	H	Cl	Br	H
Br	H	Cl	CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	CF ₃	H
Br	H	Cl	xyano	H	CF ₃	H	Cl	xyano	H
Br	H	Cl	OMe	H	CF ₃	H	Cl	OMe	H
Br	H	Cl	SMe	H	CF ₃	H	Cl	SMe	H
Br	H	Cl	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Cl	CO ₂ Me	H
Br	H	Cl	C(O)Me	H	CF ₃	H	Cl	C(O)Me	H
Br	H	Cl	NMe ₂	H	CF ₃	H	Cl	NMe ₂	H
Br	H	Cl	nitro	H	CF ₃	H	Cl	nitro	H
xyano	H	Cl	H	H	xyano	H	Cl	xyano	H
xyano	H	Cl	Me	H	xyano	H	Cl	OMe	H
xyano	H	Cl	Et	H	xyano	H	Cl	SMe	H
xyano	H	Cl	F	H	xyano	H	Cl	CO ₂ Me	H

xyano	H	Cl	Cl	H	xyano	H	Cl	C(O)Me	H
xyano	H	Cl	Br	H	xyano	H	Cl	NMe ₂	H
xyano	H	Cl	CF ₃	H	xyano	H	Cl	nitro	H
H	H	xyano	H	H	Me	H	xyano	H	H
H	H	xyano	Me	H	Me	H	xyano	Me	H
H	H	xyano	Et	H	Me	H	xyano	Et	H
H	H	xyano	F	H	Me	H	xyano	F	H
H	H	xyano	Cl	H	Me	H	xyano	Cl	H
H	H	xyano	Br	H	Me	H	xyano	Br	H
H	H	xyano	CF ₃	H	Me	H	xyano	CF ₃	H
H	H	xyano	xyano	H	Me	H	xyano	xyano	H
H	H	xyano	OMe	H	Me	H	xyano	OMe	H
H	H	xyano	SMe	H	Me	H	xyano	SMe	H
H	H	xyano	CO ₂ Me	H	Me	H	xyano	CO ₂ Me	H
H	H	xyano	C(O)Me	H	Me	H	xyano	C(O)Me	H
H	H	xyano	NMe ₂	H	Me	H	xyano	NMe ₂	H
H	H	xyano	nitro	H	Me	H	xyano	nitro	H
F	H	xyano	H	H	Cl	H	xyano	H	H
F	H	xyano	Me	H	Cl	H	xyano	Me	H
F	H	xyano	Et	H	Cl	H	xyano	Et	H
F	H	xyano	F	H	Cl	H	xyano	F	H
F	H	xyano	Cl	H	Cl	H	xyano	Cl	H
F	H	xyano	Br	H	Cl	H	xyano	Br	H
F	H	xyano	CF ₃	H	Cl	H	xyano	CF ₃	H
F	H	xyano	xyano	H	Cl	H	xyano	xyano	H
F	H	xyano	OMe	H	Cl	H	xyano	OMe	H
F	H	xyano	SMe	H	Cl	H	xyano	SMe	H
F	H	xyano	CO ₂ Me	H	Cl	H	xyano	CO ₂ Me	H
F	H	xyano	C(O)Me	H	Cl	H	xyano	C(O)Me	H
F	H	xyano	NMe ₂	H	Cl	H	xyano	NMe ₂	H
F	H	xyano	nitro	H	Cl	H	xyano	nitro	H
Br	H	xyano	H	H	CF ₃	H	xyano	H	H
Br	H	xyano	Me	H	CF ₃	H	xyano	Me	H
Br	H	xyano	Et	H	CF ₃	H	xyano	Et	H
Br	H	xyano	F	H	CF ₃	H	xyano	F	H
Br	H	xyano	Cl	H	CF ₃	H	xyano	Cl	H
Br	H	xyano	Br	H	CF ₃	H	xyano	Br	H
Br	H	xyano	CF ₃	H	CF ₃	H	xyano	CF ₃	H

Br	H	xyano	xyano	H	CF ₃	H	xyano	xyano	H
Br	H	xyano	OMe	H	CF ₃	H	xyano	OMe	H
Br	H	xyano	SMe	H	CF ₃	H	xyano	SMe	H
Br	H	xyano	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	xyano	CO ₂ Me	H
Br	H	xyano	C(O)Me	H	CF ₃	H	xyano	C(O)Me	H
Br	H	xyano	NMe ₂	H	CF ₃	H	xyano	NMe ₂	H
Br	H	xyano	nitro	H	CF ₃	H	xyano	nitro	H
xyano	H	xyano	H	H	xyano	H	xyano	xyano	H
xyano	H	xyano	Me	H	xyano	H	xyano	OMe	H
xyano	H	xyano	Et	H	xyano	H	xyano	SMe	H
xyano	H	xyano	F	H	xyano	H	xyano	CO ₂ Me	H
xyano	H	xyano	Cl	H	xyano	H	xyano	C(O)Me	H
xyano	H	xyano	Br	H	xyano	H	xyano	NMe ₂	H
xyano	H	xyano	CF ₃	H	xyano	H	xyano	nitro	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	H	Me	Me	H	H	H	Me
H	H	H	H	F	Me	H	H	H	F
H	H	H	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
H	H	H	H	Br	Me	H	H	H	Br
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	H	Me	Cl	H	H	H	Me
F	H	H	H	F	Cl	H	H	H	F
F	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H	Cl
F	H	H	H	Br	Cl	H	H	H	Br
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H	Me
Br	H	H	H	F	CF ₃	H	H	H	F
Br	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	Cl
Br	H	H	H	Br	CF ₃	H	H	H	Br
xyano	H	H	H	H	xyano	H	H	H	F
xyano	H	H	H	Me	xyano	H	H	H	Cl
Cl	H	H	OCF ₃	H	xyano	H	H	H	Br
OCF ₃	H	H	Cl	H					

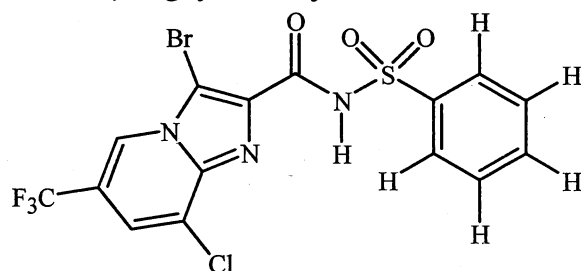
Bảng 2

Bảng 2 được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R² là Cl. Ví dụ, hợp chất đầu tiên trong Bảng 2 trong đó R^{1a} là CF₃, R^{1b} là Cl, R² là Cl, R³ và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay dưới đây.



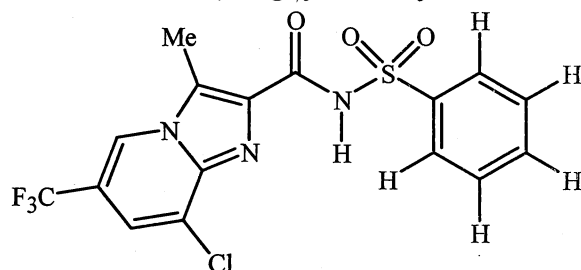
Bảng 3

Bảng 3 được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^2 là Br. Ví dụ, hợp chất đầu tiên trong Bảng 3 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^2 là Br, R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



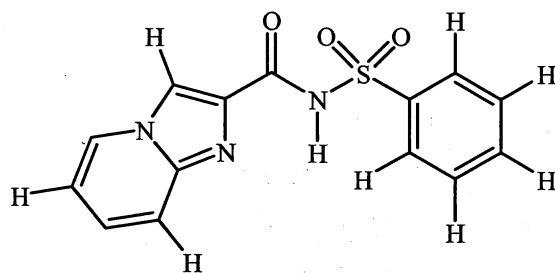
Bảng 4

Bảng 4 được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^2 là Me. Ví dụ, hợp chất đầu tiên trong Bảng 4 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^2 là Me, R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



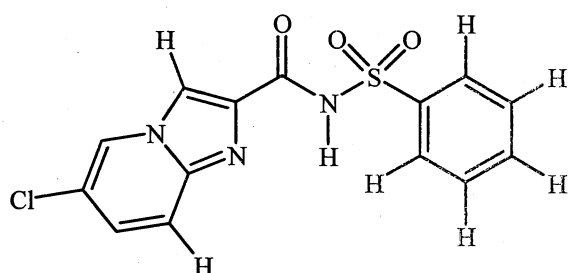
Bảng 5

Bảng 5 được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1a} và R^{1b} là H. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 5 trong đó R^{1a} là H, R^{1b} là H, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



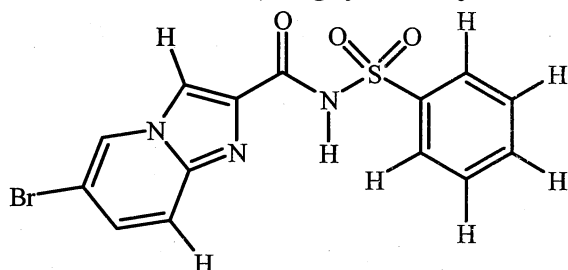
Bảng 5a

Bảng 5a được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1a} là Cl và R^{1b} là H. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 5a trong đó R^{1a} là Cl, R^{1b} là H, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



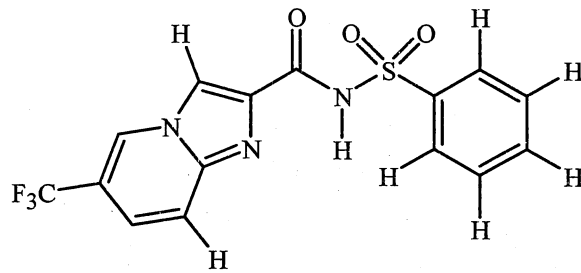
Bảng 5b

Bảng 5b được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1a} là Br và R^{1b} là H. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 5b trong đó R^{1a} là Br, R^{1b} là H, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



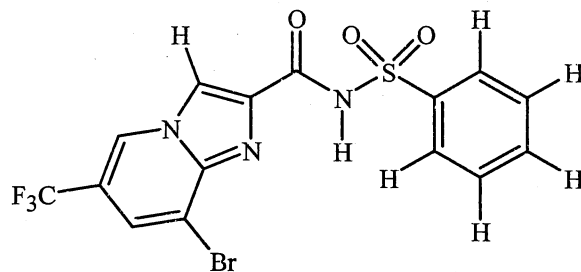
Bảng 5c

Bảng 5c được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1b} là H. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 5c trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là H, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



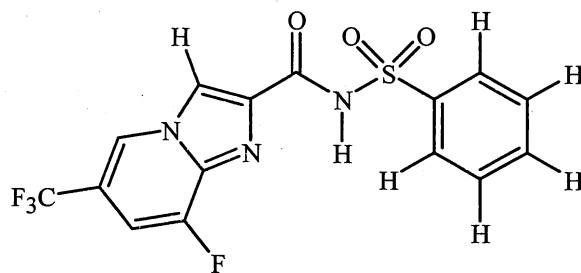
Bảng 6

Bảng 6 được cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1b} là Br. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 6 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Br, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



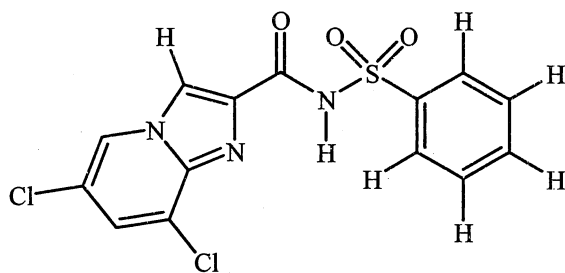
Bảng 6a

Bảng 6 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1b} là F. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 6 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là F, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



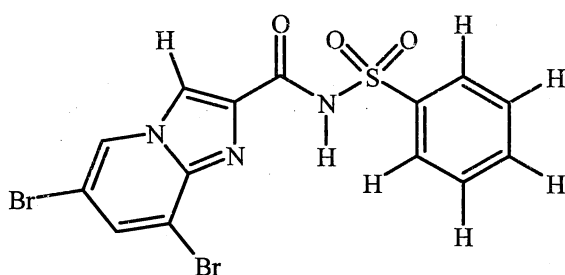
Bảng 7

Bảng 7 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1a} và R^{1b} là Cl. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 7 trong đó R^{1a} và R^{1b} là Cl, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



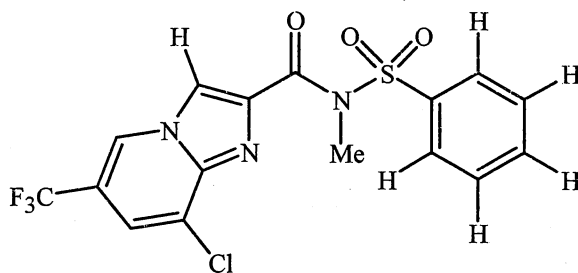
Bảng 8

Bảng 8 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^{1a} và R^{1b} là Br. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 8 trong đó R^{1a} và R^{1b} là Br, và R^2 , R^3 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



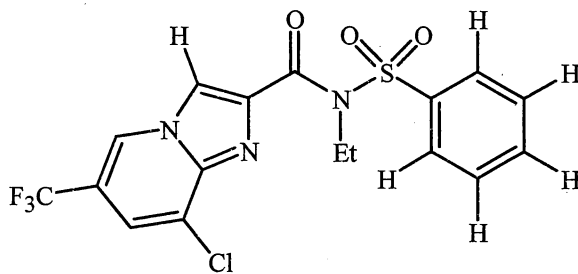
Bảng 9

Bảng 9 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^3 is Me. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 9 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^3 is Me, và R^2 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



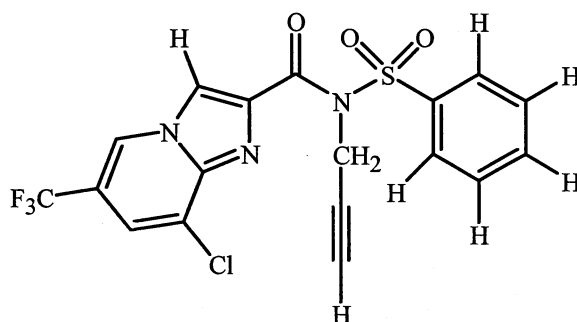
Bảng 10

Bảng 10 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^3 là Et. Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 10 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^3 là Et, và R^2 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



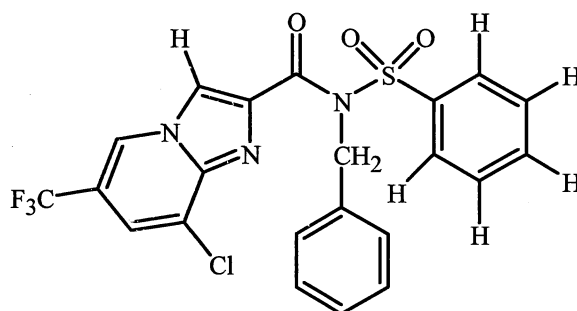
Bảng 11

Bảng 11 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^3 là propargyl (tức là $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$). Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 11 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^3 là propargyl, và R^2 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.

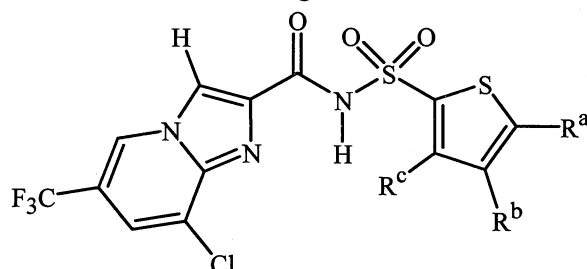


Bảng 12

Bảng 12 có cấu trúc giống như Bảng 1, chỉ khác là R^3 là benzyl (tức là $\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$). Ví dụ, hợp chất thứ nhất trong Bảng 12 trong đó R^{1a} là CF_3 , R^{1b} là Cl, R^3 là benzyl, và R^2 và R_a đến R_e là H có cấu trúc được thể hiện ngay sau đây.



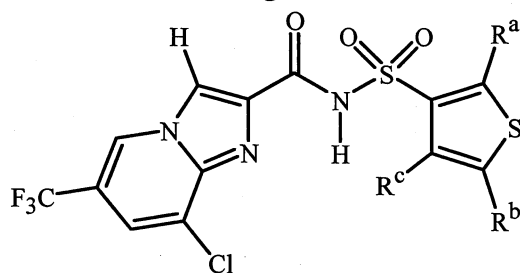
Bảng 13



$\underline{R^a}$	$\underline{R^b}$	$\underline{R^c}$	$\underline{R^a}$	$\underline{R^b}$	$\underline{R^c}$	$\underline{R^a}$	$\underline{R^b}$	$\underline{R^c}$
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br

H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br
H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			
Br	H	Br	Et	H	Br			
Br	Me	H	Et	Me	H			
Br	Me	Me	Et	Me	Me			
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl			
Br	Me	Br	Et	Me	Br			
Br	Et	H	Et	Et	H			
Br	Et	Me	Et	Et	Me			
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl			
Br	Et	Br	Et	Et	Br			
Br	Cl	H	Et	Cl	H			
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me			
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl			
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br			

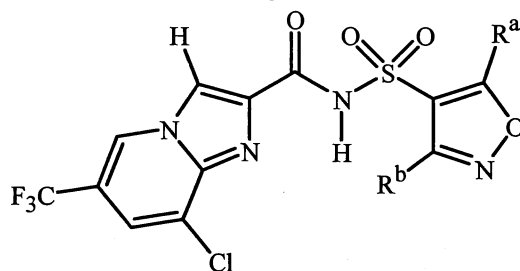
Bảng 14



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H

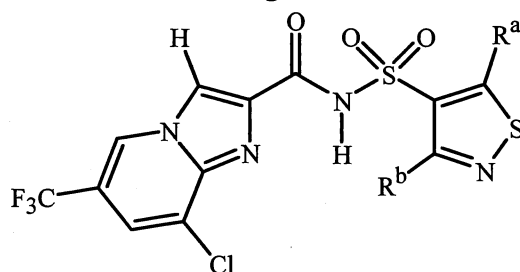
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			
Et	H	Cl	Br	H	Cl			
Et	Me	H	Br	Me	H			
Et	Me	Me	Br	Me	Me			
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl			
Et	Et	H	Br	Et	H			
Et	Et	Me	Br	Et	Me			
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl			

Bảng 15



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

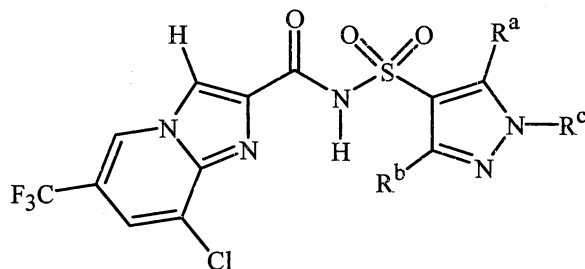
Bảng 16



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H

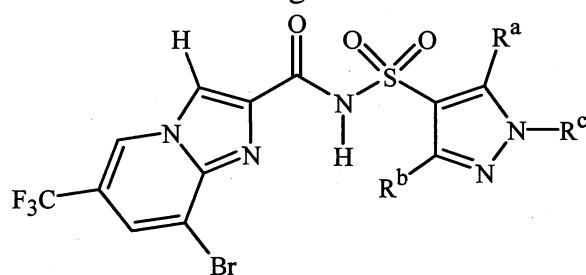
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

Bảng 17



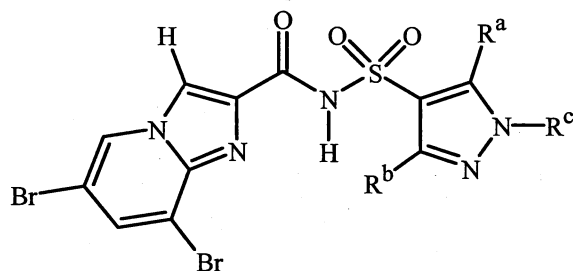
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

Bảng 17a



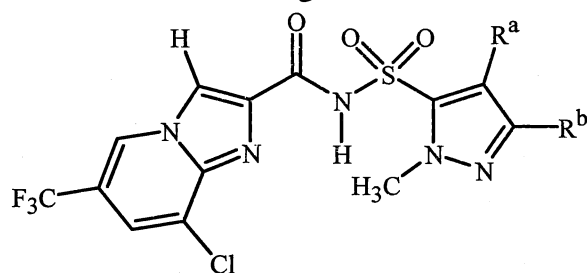
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

Bảng 17b



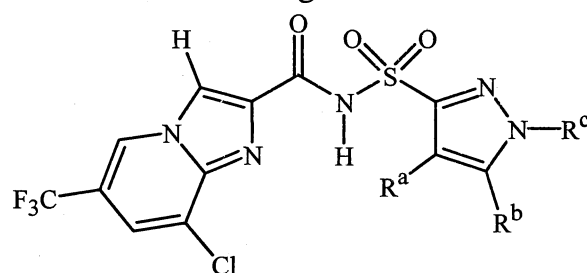
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

Bảng 18



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	<i>i</i> -Pr	Me	<i>i</i> -Pr	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	<i>i</i> -Pr
H	<i>n</i> -Pr	Me	<i>n</i> -Pr	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	<i>n</i> -Pr
H	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Br	OMe

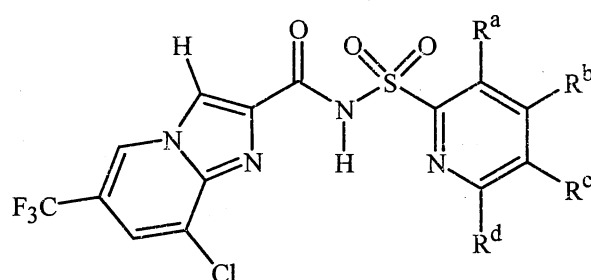
Bảng 19



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et

Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

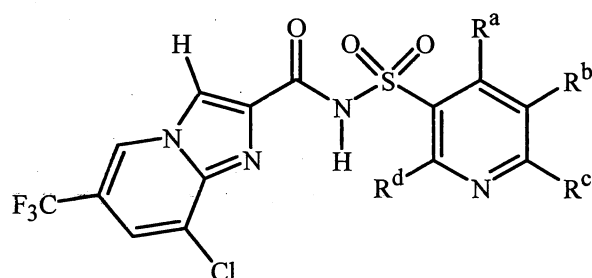
Bảng 20



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
Me	H	H	H	Cl	H	H	H
Me	H	H	Me	Cl	H	H	Me
Me	H	H	OMe	Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H	Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me	Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	OMe	Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H	Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me	Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	OMe	Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H	Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me	Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	OMe	Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H	Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	OMe	Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H	Br	OMe	Me	H

Br	H	H	Me	Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	OMe	Br	OMe	Me	Ome
Br	OMe	H	H	Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me	Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	OMe	Br	Me	H	Ome
Br	H	Me	H	Br	Me	Me	H
Br	H	Me	Me	Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	OMe	Br	Me	Me	Ome

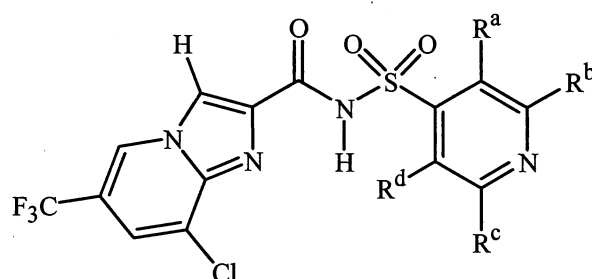
Bảng 21



<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃	Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	H	Br	Me	H	H	Br
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br	Me	H	Me	Br
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H
H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me

H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H
H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me
H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

Bảng 22



<u>R_a</u>	<u>R_b</u>	<u>R_c</u>	<u>R_d</u>	<u>R_a</u>	<u>R_b</u>	<u>R_c</u>	<u>R_d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me

H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

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

Các chế phẩm hữu dụng bao gồm cả các hỗn hợp lỏng và rắn. Các hỗn hợp lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Loại hỗn hợp lỏng chứa nước nói chung là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương và nhũ tương-huyền phù. Loại hỗn hợp lỏng không chứa nước nói chung là dạng cô đặc có thể nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

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

Các chế phẩm phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Các chế phẩm lỏng và rắn như vậy được bào chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước. Các thể tích phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thông thường hơn, nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Các chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Các chế phẩm lỏng và khô có thể được định lượng trực

tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được đưa lên thực vật hạt làm chất xử lý hạt trước khi gieo trồng để bảo vệ rễ đang phát triển và các bộ phận khác dưới mặt đất của thực vật và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thụ nội hấp.

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

	Phần trăm trọng lượng		
	Hoạt chất	Chất pha loãng	Chất hoạt động bề mặt
Hạt, viên nén và bột phân tán trong nước và tan trong nước	0,001-90	0-99,999	1-15
Huyền phù, nhũ tương, dung dịch dầu (kể cả chất cô đặc có thể nhũ hoá)	1-50	40-99	0-15
Bột mịn	1-25	70-99	0-5
Hạt và viên tròn	0,001-99	5-99,999	0-15
Hỗn hợp đậm đặc	90-99	0-10	0-2

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

Chất pha loãng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-đimetylalkanamit (ví dụ *N,N*-đimetylformamit), limonen, đimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyrrolidon (ví dụ *N*-metylpyrrolidinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, đipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen cacbonat, butylen cacbonat, parafin (Ví dụ dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, các hydrocacbon thơm, các chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, các keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như các este lactat alkylat hóa, các este đibazo và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà, như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol,

rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-ethylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, lauryl rượu, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, điaxeton rượu và rượu benzyl. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là C₆–C₂₂), như các dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), các chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các axit béo alkylat hóa (ví dụ, được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng chưng cất. Chất pha loãng lỏng thông thường được mô tả trong Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

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

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

peg alkyl (polyetylen glycol), các polyme ghé hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol của axit béo; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở silicon; và dẫn xuất của đường như các este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysacarit.

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

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

Cũng hữu dụng đối với các hỗn hợp này là các hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely và Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; và A. S. Davidson và B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley và Sons, New York, 1987.

Hỗn hợp theo sáng chế có thể còn chứa chế phẩm chất bổ trợ và các chất phụ gia, đã biết đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực làm chất trợ bào chế. Chất bổ

trợ và các chất phụ gia như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (các chất đệm), sự tạo bọt trong quá trình xử lý (các chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), sự lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong dụng cụ chứa (các chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (các chất chống đông), màu sắc (các chất phân tán tạo màu/thuốc nhuộm), sự rửa trôi (các chất tạo màng hoặc các chất dính), sự bay hơi (các chất làm chậm bay hơi), và các chế phẩm khác tương tự. Các chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat, các rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và các sáp. Ví dụ về chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm các chất được liệt kê trong *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và bắc Mỹ do McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. công bố; và công bố đơn PCT WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được kết hợp trong các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc có thể nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2,000 μm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới đây 3 μm . Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để tạo ra hạt phân tán trong nước. Các chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10 μm . Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên các chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và các trang tiếp theo, và WO 91/13546. Các viên tròn có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Các hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong

U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các cách bào chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks và T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Cũng xem U.S. 3,235,361, Cột 6, các dòng từ 16 đến Cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Cột 5, dòng 43 đến Cột 7, dòng 62 và Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến Cột 5, dòng 17 và Ví dụ 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley và Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

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

Ví dụ A

Dạng cô đặc đậm đặc

Hợp chất 7	98,5%
silic oxit dạng gel khí	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%.

Ví dụ B

Bột thấm ướt

Hợp chất 19	65,0%
Đodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri nhôm oxit silic	6,0%
montmorillonit (đã được nung)	23,0%.

Ví dụ C

Hạt

Hợp chất 30	10,0%
hạt attapulgit (chất có độ bay hơi thấp,	

0,71/0,30 mm; rây Mỹ số 25–50) 90,0%.

Ví dụ D

Viên ép đùn

Hợp chất 170	25,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%.

Ví dụ E

Chất cô đặc nhũ hoá được

Hợp chất 179	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
metyl este của axit béo C ₆ –C ₁₀	70,0%

Ví dụ F

Vi nhũ tương

Hợp chất 180	5,0%
polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat copolyme	30,0%
Alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
nước	20,0%

Ví dụ G

Xử lý hạt

Hợp chất 68	20,00%
polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat copolyme	5,00%
sáp axit montan	5,00%
Canxi ligninsulfonat	1,00%
copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
rượu stearyllic (POE 20)	2,00%
Polyorganosilan	0,20%
thuốc nhuộm màu đỏ	0,05%
nước	65,75%

Ví dụ H

Thanh phân bón

Hợp chất 382	2,5%
pyrrolidon-styren copolyme	4,8%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,3%
bột talc	0,8%
tinh bột ngô	5,0%

phân bón giải phóng chậm Nitrophoska® Permanent 15-9-15 (BASF)	36,0%
Caolanh	38,0%
nước	10,6%

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đối với phổ rộng của loài gây hại ký sinh. Các loài gây hại này bao gồm các loài không xương sống sống trong nhiều môi trường như, Ví dụ, cây lá, rễ, đất, cây thu hoạch hoặc các loại thực phẩm khác, các công trình xây dựng hoặc da động vật. Các loài gây hại này bao gồm, ví dụ, loài không xương sống ăn lá (bao gồm lá, thân, hoa và quả), hạt, gỗ, sợi dệt hoặc máu hoặc mô động vật và nhờ đó gây ra tổn thương hoặc hư hại cho, ví dụ, đang phát triển hoặc bảo quản cây nông nghiệp, cây lâm nghiệp, cây trong nhà kính, cây cảnh, cây trong vườn ươm, bảo quản các loại thực phẩm hoặc các sản phẩm sợi hoặc các công trình xây dựng và các công trình khác hoặc các bộ phận của chúng hoặc gây hại cho sức khỏe động vật hoặc sức khỏe cộng đồng. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ đánh giá được rằng không phải tất cả hợp chất là hữu hiệu như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả loài gây hại.

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

bông, đậu tương và cải dầu chống chịu thuốc diệt cỏ như ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® và CLEARFIELD®, cũng như cây trồng biểu hiện N-acetyltransferaza (GAT) có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ glyphosate, hoặc cây trồng chứa gen HRA có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ ức chế axetylactat syntaza (ALS). Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với tính trạng được tạo ra bởi kỹ thuật di truyền hoặc được biến đổi bằng cách đột biến, vì vậy làm tăng sự biểu hiện kiểu hình hoặc một cách hữu hiệu của tính trạng hoặc làm tăng tác dụng phòng trừ giun tròn ký sinh một cách hữu hiệu của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế. Cụ thể là, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với sự biểu hiện kiểu hình của các protein hoặc các sản phẩm tự nhiên khác gây độc cho giun tròn ký sinh để tạo ra tác dụng phòng trừ lớn hơn bổ trợ của loài gây hại này.

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

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

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc cả hai lớp Adenophorea và Secernentea của ngành giun tròn Phylum Nematoda, bao gồm các

loài có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế của bộ Enoplida, Dorylaimida, Rhabditida, Strongylida, Ascarida, Oxyurida, Spirurida, Tylenchida và Aphelenchida, như nhưng không chỉ giới hạn ở các loài gây hại trong nông nghiệp có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế như giun tròn gây sần rỗ thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây nang thuộc giống *Heterodera* và *Globodera*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn dạng thân thuộc giống *Rotylenchulus*, giun tròn tạo hang thuộc giống *Radopholus*, giun tròn chích thuộc giống *Belonolaimus*, giun tròn dạng xoắn ốc thuộc giống *Helicotylenchus* và *Scutellonema*, giun tròn giống cam quýt thuộc giống *Tylenchulus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus* và *Paratrichodorus*, giun tròn hình dao găm thuộc giống *Xiphinema*, giun tròn gây cần cỗi thuộc giống *Tylenchorhynchus*, giun tròn hình kim thuộc giống *Longidorus* và *Paralongidorus*, giun tròn chích thuộc giống *Hoplolaimus*, giun tròn hình vòng thuộc họ Criconematidae, giun tròn hình cuống thuộc giống *Ditylenchus* và *Anguina*, và giun tròn lá/cuống thuộc giống *Aphelenchoides* và *Rhadinaphelenchus*; và các loài ký sinh gây ảnh hưởng đến sức khỏe người và động vật (tức là, giun tròn có ảnh hưởng có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara canis* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis* ở chó, v.v.).

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

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

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc một số chất hoặc hoạt chất sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc tiết dục, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất hấp dẫn côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus hoặc nấm để tạo thành thuốc trừ sâu nhiều thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và lượng hữu hiệu của ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ

sung và có thể chứa thêm ít nhất một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn hoặc chất pha loãng lỏng. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế cùng với hợp chất theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức 1, để tạo thành hỗn hợp sơ chế, hoặc các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ hợp chất theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức 1, và hai chế phẩm được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Ví dụ về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể chế hoá với hợp chất theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acrinathrin, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxide, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamit, flucythrinate, flufenimer, flufenoxuron, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, metaflumizone, metaldehit, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, vi khuẩn gây chết cho côn trùng, virus gây chết cho côn trùng và nấm gây chết cho côn trùng.

Đáng lưu ý là thuốc trừ sâu như abamectin, acetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin,

cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, toàn bộ chủng của *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng của virus *Nucleopolydrosus*.

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

Tốt hơn, nếu chế phẩm, trong đó hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác với hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, chế phẩm với ít nhất một phòng trừ hoạt chất loài gây hại không xương sống khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ được ưu tiên đặc biệt. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác nhau. Hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chất điều biến kênh natri như bifenthrin, xypermethrin, xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerat, fenvalerat, indoxacarb, metofluthrin, profluthrin, pyrethrin và tralomethrin; chất ức chế cholinesteaza như clorpyrifos, methomyl, oxamyl, thiodicarb và triazamat; neonicotinoit như axetamid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazin, thiacloprid và thiamethoxam; lacton vòng lớn có tác dụng trừ sâu như spinetoram,

spinosad, abamectin, avermectin và emamectin; GABA (axit γ -aminobutyric)-chất đối kháng kênh clorua cửa như avermectin hoặc chất phong bế như ethiprol và fipronil; các chất ức chế tổng hợp kitin như buprofezin, xyromazin, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron; chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non như diofenolan, fenoxycarb, methopren và pyriproxyfen; phối tử thụ thể octopamin như amitraz; chất ức chế lột xác và chất chủ vận ecdyson như Azadirachtin, metoxyfenozit và tebufenozit; phối tử thụ thể ryanodin như ryanodin, anthranilic diamit như clorantraniliprol, cyantraniliprol và flubendiamit; chất đồng đẳng nereistoxin như cartap; chất ức chế vận chuyển điện tử ti thể như clorfenapyr, hydrametylnon và pyridaben; chất ức chế sinh tổng hợp lipid như spiroadiclofen và spiromesifen; thuốc trừ sâu xyclodien như dieldrin hoặc endosulfan; pyrethroid; carbamat; ure trừ sâu; và chất sinh học kể cả virus nhân đa diện (NPV), thành viên của *Bacillus thuringiensis*, nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* và virus có khả năng trừ sâu khác trong tự nhiên hoặc biến đổi gen.

Ví dụ khác về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể chế hoá được với hợp chất theo sáng chế là: thuốc diệt nấm như acibenzolar, aldimorph, amisulbrom, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, binomial, biphenyl, bitertanol, blasticidin-S, hỗn hợp Bordeaux (đồng sulfat ba lần), boscalid/nicobifen, bromuconazol, bupirimat, buthiobat, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, chlozolilat, clotrimazol, đồng oxyclorea, các muối đồng như đồng sulfat và đồng hydroxit, cyazofamid, xyflunamid, cymoxanil, cyproconazol, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobin, dithianon, dodemorph, dodin, econazol, etaconazol, edifenphos, epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, ethridiazol, famoxadon, fenamidone, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferfurazoat, ferimzon, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopicolit, fluoxastrobin, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamid, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-nhôm, fuberidazol, furalaxyl, furametapyr, hexaconazol, hymexazol, guazatin, imazalil, imibenconazol, iminoctadin, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb, isoconazol, isoprothiolan, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, maneb, mapanipyrin, mefenoxam, mepronil, metalaxyl, metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin/fenominostrobin, mepanipyrin, metrafenone, miconazol, myclobutanil, neo-asozin (ferric metanarsonat), nuarimol, octhiline, ofurace,

orysastrobin, oxadixyl, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, paclobutrazol, penconazol, pencycuron, penthiopyrad, perfurazoat, axit phosphonic, phthalogenua, picobenzamit, picoxystrobin, polyoxin, probenazol, procloraz, procymidon, propamocarb, propamocarb-hydroclorua, propiconazol, propineb, proquinazid, prothioconazol, pyraclostrobin, pryazophos, pyrifenox, pyrimethanil, pyrifenox, pyrolnitrin, pyroquilon, quinconazol, quinoxifen, quintozen, silthiofam, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, lưu huỳnh, tebuconazol, techrazene, tecloftalam, tecnazen, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamit, thiophanat, thiophanat-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, tridemorph, trimophramit, tricyclazol, trifloxystrobin, triforine, triticonazol, uniconazol, validamycin, vinclozolin, zineb, ziram và zoxamit; thuốc diệt giun tròn như aldicarb, imicyafos, oxamyl và fenamiphos; thuốc sát trùng như streptomycin; thuốc diệt bọ ve như amitraz, chinomethionat, clobenzilat, cyhexatin, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximat, hexythiazox, propargit, pyridaben và tebufenpyrad.

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

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

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

Đối với các phương án, trong đó một hoặc nhiều các thành phần trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ trọng lượng của các thành phần trộn khác nhau này

(tổng số) với hợp chất có công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Đáng lưu ý là tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm một cách đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Điều hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ giun tròn ký sinh vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất có công thức 1.

Bảng A nêu các tổ hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác để minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế và gồm các phương án thực hiện bổ sung có khoảng tỷ lệ khối lượng với tỷ lệ dùng. Cột đầu tiên của Bảng A nêu chất phòng trừ loài gây hại không xương sống cụ thể (ví dụ, "Abamectin" ở dòng đầu tiên). Cột thứ hai của Bảng A nêu kiểu tác động (nếu đã biết) của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống. Cột thứ ba của Bảng A nêu phương án/ các phương án thực hiện về các khoảng tỷ lệ khối lượng mà chất phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể được dùng so với hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, (ví dụ, "50:1 đến 1:50" abamectin so với hợp chất có công thức 1 theo khối lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng A nêu cụ thể tổ hợp của hợp chất có công thức 1 với abamectin có thể được dùng nằm trong khoảng tỷ lệ khối lượng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của Bảng A được cấu trúc tương tự.

Bảng A

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Abamectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:50
Axetamiprid	Neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Amitraz	phối tử thụ thể octopamin	200:1 đến 1:100
Avermectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:50
Azadirachtin	chất chủ vận ecdyson	100:1 đến 1:120
Beta-xyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Bifenthrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Buprofezin	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:50
Cartap	chất đồng đẳng nereistoxin	100:1 đến 1:200
Clorantpriliprol	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Clorfenapyr	chất ức chế vận chuyển điện tử ti thể	300:1 đến 1:200
Clorpyrifos	chất ức chế cholinesteaza	500:1 đến 1:200
Clothianidin	Neonicotinoit	100:1 đến 1:400
Cyantraniliprol	Phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Xyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xyhalothrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xypermethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xyromazin	các chất ức chế tổng hợp kitin	400:1 đến 1:50
deltamethrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:400
dieldrin	xyclođien thuốc trừ sâu	200:1 đến 1:100
đinotefuran	Neonicotinoit	150:1 đến 1:200
điofenolan	chất ức chế lột xác	150:1 đến 1:200
Emamectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:10
Endosulfan	xyclođien thuốc trừ sâu	200:1 đến 1:100
Esfenvalerat	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:400
Ethiprol	chất phong bế kênh clorus điều biến GABA	200:1 đến 1:100
Fenothiocarb		150:1 đến 1:200
Fenoxycarb	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Fenvalerat	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Fipronil	chất phong bế kênh clorus điều biến GABA	150:1 đến 1:100
Flonicamid		200:1 đến 1:100
Flubendiamit	phối tử thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Flufenoxuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
Hexaflumuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	300:1 đến 1:50
Hydrametylnon	chất ức chế vận chuyển điện tử ti thể	150:1 đến 1:250
Imidacloprid	Neonicotinoit	1000:1 đến 1:1000
Indoxacarb	chất điều biến kênh natri	200:1 đến 1:50
Lambda-xyhalothrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:250
Lufenuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:250
Metaflumizon		200:1 đến 1:200
Methomyl	chất ức chế cholinesteaza	500:1 đến 1:100
Methopren	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Metoxyfenozit	chất chủ vận ecdyson	50:1 đến 1:50
Nitenpyram	Neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Nithiazin	Neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Novaluron	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:150
Oxamyl	chất ức chế cholinesteaza	200:1 đến 1:200
Pymetrozin		200:1 đến 1:100

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Pyrethrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Pyridaben	chất ức chế vận chuyển điện tử ti thể	200:1 đến 1:100
Pyridalyl		200:1 đến 1:100
Pyriproxyfen	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Ryanodin	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Spinetoram	lacton vòng lớn	150:1 đến 1:100
Spinosad	lacton vòng lớn	500:1 đến 1:10
Spirodiclofen	chất ức chế chất sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200
Spiromesifen	chất ức chế chất sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200
Tebufenozit	chất chủ vận ecdyson	500:1 đến 1:250
Thiacloprid	Neonicotinoit	100:1 đến 1:200
Thiamethoxam	Neonicotinoit	1250:1 đến 1:1000
Thiodicarb	chất ức chế cholinesteaza	500:1 đến 1:400
Thiosultap-natri		150:1 đến 1:100
Tralomethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Triazamat	chất ức chế cholinesteaza	250:1 đến 1:100
Triflumuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	chất sinh học	50:1 đến 1:10
<i>Bacillus thuringiensis</i> nội độc tố delta	chất sinh học	50:1 đến 1:10
NPV (ví dụ, Gemstar)	chất sinh học	50:1 đến 1:10

Đáng lưu ý là chế phẩm theo sáng chế, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm gồm chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được nêu trong Bảng A trên.

Tỷ lệ khối lượng hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung thường nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000, với một phương án nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, phương án khác nằm trong khoảng từ 250:1 đến 1:200 và phương án khác nữa nằm trong khoảng từ 100:1 và 1:50.

Bảng B1 đến B14 dưới đây đưa ra các phương án của chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong Bảng phụ lục A-I) và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung.

Bảng B1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-1	7	và	Abamectin	B1-36	7	và	Imidacloprid
B1-2	7	và	Acetamiprid	B1-37	7	và	Indoxacarb
B1-3	7	và	Amitraz	B1-38	7	và	Lambda-cyhalothrin
B1-4	7	và	Avermectin	B1-39	7	và	Lufenuron
B1-5	7	và	Azadirachtin	B1-40	7	và	Metaflumizone
B1-5a	7	và	Bensultap	B1-41	7	và	Methomyl
B1-6	7	và	Beta-cyfluthrin	B1-42	7	và	Methoprene
B1-7	7	và	Bifenthrin	B1-43	7	và	Metoxyfenozide
B1-8	7	và	Buprofezin	B1-44	7	và	Nitenpyram
B1-9	7	và	Cartap	B1-45	7	và	Nithiazine
B1-10	7	và	Chlorantraniliprole	B1-46	7	và	Novaluron
B1-11	7	và	Chlorfenapyr	B1-47	7	và	Oxamyl
B1-12	7	và	Chlorpyrifos	B1-48	7	và	Phosmet
B1-13	7	và	Clothianidin	B1-49	7	và	Pymetrozine
B1-14	7	và	Cyantraniliprole	B1-50	7	và	Pyrethrin
B1-15	7	và	Cyfluthrin	B1-51	7	và	Pyridaben
B1-16	7	và	Cyhalothrin	B1-52	7	và	Pyridalyl
B1-17	7	và	Cypermethrin	B1-53	7	và	Pyriproxyfen
B1-18	7	và	Cyromazine	B1-54	7	và	Ryanodine
B1-19	7	và	Deltamethrin	B1-55	7	và	Spinetoram
B1-20	7	và	Dieldrin	B1-56	7	và	Spinosad
B1-21	7	và	Dinotefuran	B1-57	7	và	Spirodiclofen
B1-22	7	và	Diofenolan	B1-58	7	và	Spiromesifen
B1-23	7	và	Enamectin	B1-59	7	và	Spirotetramat
B1-24	7	và	Endosulfan	B1-60	7	và	Tebufenozide
B1-25	7	và	Esfenvalerate	B1-61	7	và	Thiacloprid
B1-26	7	và	Ethiprole	B1-62	7	và	Thiamethoxam
B1-27	7	và	Fenothiocarb	B1-63	7	và	Thiodicarb
B1-28	7	và	Fenoxycarb	B1-64	7	và	Thiosultap-natri
B1-29	7	và	Fenvalerate	B1-65	7	và	Tolfenpyrad
B1-30	7	và	Fipronil	B1-66	7	và	Tralomethrin
B1-31	7	và	Flonicamid	B1-67	7	và	Triazamate
B1-32	7	và	Flubendiamit	B1-68	7	và	Triflumuron

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-33	7	và	Flufenoxuron	B1-69	7	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-34	7	và	Hexaflumuron	B1-70	7	và	<i>Bacillus thuringiensis</i> nội độc tố delta
B1-35	7	và	Hydrametylnon	B1-71	7	và	NPV (ví dụ, Gemstar)

Bảng B2

Bảng B2 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 19. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B2 được định danh là B2-1 và là hỗn hợp của hợp chất 19 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B3

Bảng B3 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 30. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B3 được định danh là B3-1 và là hỗn hợp của hợp chất 30 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B4

Bảng B4 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 68. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B4 được định danh là B4-1 và là hỗn hợp của hợp chất 20 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B5

Bảng B5 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 170. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B5 được định danh là B5-1 và là hỗn hợp của hợp chất 170 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B6

Bảng B6 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 179. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B6 được định danh là B6-1 và là hỗn hợp của hợp chất 179 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B7

Bảng B7 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 180. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B7 được định danh là B7-1 và là hỗn hợp của hợp chất 180 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B8

Bảng B8 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 356. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B8 được định danh là B8-1 và là hỗn hợp của hợp chất 356 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B9

Bảng B9 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 357. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B9 được định danh là B9-1 và là hỗn hợp của hợp chất 357 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B10

Bảng B10 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 382. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B10 được định danh là B10-1 và là hỗn hợp của hợp chất 382 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B11

Bảng B11 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 413. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B11 được định danh là B11-1 và là hỗn hợp của hợp chất 413 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B12

Bảng B12 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 465. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B12 được định danh là B12-1 và là hỗn hợp của hợp chất 465 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B13

Bảng B13 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 474. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B13 được định danh là B13-1 và là hỗn hợp của hợp chất 474 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B14

Bảng B14 giống như Bảng B1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 394. Ví dụ, hỗn

hợp thứ nhất trong Bảng B14 được định danh là B14-1 và là hỗn hợp của hợp chất 394 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Các hỗn hợp cụ thể được liệt kê trong các Bảng từ B1 đến B14 kết hợp thông thường hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác với tỷ lệ cụ thể trong Bảng A.

Các Bảng từ C1 đến C14 được nêu dưới đây là các phương án của các chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (Hợp chất số) để chỉ hợp chất trong các Bảng A–D) và thuốc diệt nấm bổ sung.

Bảng C1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm
C1-1	7	và	Probenazole	C1-17	7	và	Difenoconazole
C1-2	7	và	Tiadinil	C1-18	7	và	Cyproconazole
C1-3	7	và	Isotianil	C1-19	7	và	Propiconazole
C1-4	7	và	Pyroquilon	C1-20	7	và	Fenoxanil
C1-5	7	và	Metominostrobin	C1-21	7	và	Ferimzone
C1-6	7	và	Flutolanil	C1-22	7	và	Fthalogenua
C1-7	7	và	Validamycin	C1-23	7	và	Kasugamycin
C1-8	7	và	Furametpyr	C1-24	7	và	Picoxystrobin
C1-9	7	và	Pencycuron	C1-25	7	và	Penthiopyrad
C1-10	7	và	Simeconazole	C1-26	7	và	Famoxadone
C1-11	7	và	Orysastrobin	C1-27	7	và	Cymoxanil
C1-12	7	và	Trifloxystrobin	C1-28	7	và	Proquinazid
C1-13	7	và	Isoprothiolane	C1-29	7	và	Flusilazole
C1-14	7	và	Azoxystrobin	C1-30	7	và	Mancozeb
C1-15	7	và	Tricyclazole	C1-31	7	và	đồng hydroxit
C1-16	7	và	Hexaconazole	C1-32	7	và	(a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-điflophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon

Bảng C2

Bảng C2 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 19. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C2 được định danh là C2-1 và là hỗn hợp của hợp chất 19 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C3

Bảng C3 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 30. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C3 được định danh là C3-1 và là hỗn hợp của hợp chất 30 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C4

Bảng C4 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 68. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C4 được định danh là C4-1 và là hỗn hợp của hợp chất 68 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C5

Bảng C5 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 170. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C5 được định danh là C5-1 và là hỗn hợp của hợp chất 170 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C6

Bảng C6 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 179. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C6 được định danh là C6-1 và là hỗn hợp của hợp chất 179 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C7

Bảng C7 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 180. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C7 được định danh là C7-1 và là hỗn hợp của hợp chất 180 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C8

Bảng C8 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 356. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C8 được định danh là C8-1 và là hỗn hợp của hợp chất 356 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C9

Bảng C9 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 357. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C9 được định danh là C9-1 và là hỗn hợp của hợp chất 357 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C10

Bảng C10 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 382. Ví dụ, hỗn hợp

thứ nhất trong Bảng C10 được định danh là C10-1 và là hỗn hợp của hợp chất 382 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C11

Bảng C11 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 413. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C11 được định danh là C11-1 và là hỗn hợp của hợp chất 413 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C12

Bảng C12 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 465. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C12 được định danh là C12-1 và là hỗn hợp của hợp chất 465 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C13

Bảng C13 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 474. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C13 được định danh là C13-1 và là hỗn hợp của hợp chất 474 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng C14

Bảng C14 giống như Bảng C1, chỉ khác là mỗi hợp chất tham chiếu 7 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay thế bằng hợp chất tham chiếu 394. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng C14 được định danh là C14-1 và là hỗn hợp của hợp chất 394 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

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

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

Để đạt được việc tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi giun tròn ký sinh, hợp chất hoặc chế phẩm thường được áp dụng

cho hạt của cây trước khi trồng, cho lá (ví dụ, lá, thân, hoa, quả) của cây trồng hoặc cho đất hoặc môi trường phát triển khác trước khi hoặc sau khi cây được trồng.

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

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

Một phương pháp xử lý hạt là phun hoặc rắc bụi lên hạt với hợp chất theo sáng chế (có nghĩa là dưới dạng hỗn hợp được chế hoá) trước khi gieo hạt. Chế phẩm được chế hoá để xử lý hạt thường chứa chất tạo màng hoặc chất bám dính.

Do đó, thông thường chế phẩm bao hạt theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và chất tạo màng hoặc chất bám dính. Hạt có thể được bao bằng cách phun chất cô đặc huyền phù dễ chảy trực tiếp vào trống quay chứa hạt và sau đó sấy khô hạt. Theo cách khác, các loại chế phẩm khác như bột thấm ướt được, dung dịch, nhũ tương hỗn dịch, chất cô đặc nhũ hoá được và nhũ tương trong nước có thể được phun lên hạt. Quy trình này đặc biệt hữu ích để tạo màng phủ lên hạt. Thiết bị phủ khác nhau và các quy trình có thể được người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này tìm ra một cách dễ dàng. Các quy trình thích hợp bao gồm các quy trình được nêu trong P. Kusters et al., *Giống Treatment: Progress và Prospects*, 1994 BCPC Mongraph số 57 và các tài liệu tham khảo được nêu trong đó.

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

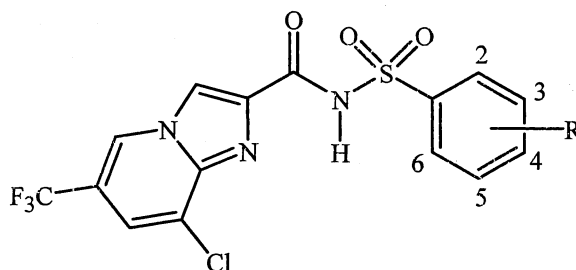
Để ứng dụng trong nông nghiệp, tỷ lệ dùng để thu được mức phòng trừ hiệu quả (tức là “lượng hữu hiệu sinh học”) sẽ phụ thuộc vào các yếu tố như loài giun tròn cần phòng trừ, vòng đời của giun tròn, giai đoạn sống, kích thước của nó, vị trí, thời gian trong năm, vụ mùa hoặc động vật chủ, phương thức cho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

Hợp chất theo sáng chế được điều chế bằng các phương pháp được mô tả trong bản mô tả này được nêu trong Bảng mục lục A-E. Đối với dữ liệu phổ khối, trị số được thông báo trong cột "AP⁺ (M+1)", là phân tử lượng của ion phân tử quan sát được được tạo thành bằng cách bổ sung H⁺ (phân tử lượng bằng 1) cho phân tử có độ giàu đồng vị lớn nhất (tức là, M); giá trị bằng số được nêu trong cột

“AP⁻ (M-1)”, là phân tử lượng của ion phân tử quan sát được được tạo thành bởi việc mất H⁺ (phân tử lượng bằng 1) khỏi phân tử có độ giàu đồng vị lớn nhất (tức là, M). Sự có mặt của ion phân tử chứa một hoặc nhiều đồng vị nguyên tử lớn hơn có độ giàu đồng vị thấp hơn (tức là, ³⁷Cl, ⁸¹Br) không được thông báo. Các pic M+1 và M-1 quan sát được bằng phổ khối sử dụng phép ion hoá hoá học ở áp suất khí quyển (AP⁺).

Các chữ viết tắt bổ sung sau được sử dụng trong các bảng mục lục như sau: Cmpd nghĩa là Hợp chất. Các biến thể “R” và “(R¹)_n” là một hoặc tổ hợp của các phân tử thể như được nêu trong Bảng phụ lục. Chữ viết tắt “Ex.” dùng để chỉ “Ví dụ” và tiếp theo là số chỉ Ví dụ tổng hợp trong đó hợp chất được điều chế.

Bảng phụ lục A



Cmpd	R **	m.p. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
1	2-metoxý, 5-clo	248-250		
2	2-metoxý, 5-metyl	250		
3	2-metoxý, 5-xyano	250		
4	2-điflometyl, 5-flo	231-232		
5	2-metoxý, 5-triflometyl	250		
6	2-điflometyl, 5-metoxý	196-197		
7 (Ex. 1)	2-clo, 5-metoxý	211-212		
8	2-điflometoxý, 5-metyl	216-217		
9	2-điflometyl, 5-clo	229-230		
10	2-clo, 5-xyano	250		
11	2-metyl, 5-bromo	216-217		
12	2-metyl, 5- CO ₂ CH ₃	206-207		
13	2-metyl, 5-isopropyl	226-227		
14	2-metoxý, 5-CO ₂ CH ₃	>250		
15	2-metyl, 5-S(O) ₂ CH ₃	248-249		
16	2-SCH ₂ CH ₃ , 5-clo	229-230		
17	2-nitro, 5-clo	>250		

<u>Cmpd</u>	<u>R</u> **	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> (M+1)	<u>AP-</u> (M-1)
18	2-SCH ₃ , 5-clo	>250		
19	2-clo, 5-C(O)CH ₃	244-245		
20	2-triflometyl, 5-clo	219-220		
21	2-SCH ₃ , 5-metoxo	236-237		
22	2-clo, 5-OCH ₂ Ph	>250		
23	2-clo-5-S(O) ₂ CH ₃	241-242		
24	2,4-diclo, 5-CO ₂ CH ₃	164-165		
25	2-clo, 4-xyano	224-225		
26	2-iodo	243-244		
27	2-iodo, 4-triflometyl	229-230		
28	2-clo, 5-CO ₂ CH ₃	245-246		
29	2,4,6-triflo	222-223		
30 (Ex. 2)	2,5-dimetyl, 4-xyano	228-229		
31	2-diflometyl	193-194		
32	2-metyl, 3-clo	196-197		
33	4-CO ₂ CH ₃	243-244		
34	2-NHC(O)CH ₃	242-243		
35	2-SCH ₃ , 3-clo	200-201		
36	2-metyl, 6-diflometoxy	237-238		
37	2-diflometoxy, 4-metyl	182-183		
38	2-metyl, 4-diflometoxy	197-198		
39	3-clo, 4-nitro	198-199		
40	3-nitro, 4-clo	196-197		
41	2-clo, 6-CH ₂ OCH ₃	207-208		
42	4-S(O) ₂ CH ₃	>250		
43	2-(2-pyridinyl)	>250		
44	2-phenyl	251-252		
45	3-nitro, 4-metoxo	245-246		
46	2-metoxo, 3-propyl	168-169		
47	2-OC(CH ₃) ₃	208-209		
48	2-CO ₂ CH ₃ , 4-metyl	>250		
49	2-CH ₂ CO ₂ CH ₃	162-163		
50	2-(2-(1,3,4-oxadiazinyl))	>250		
51	2-(1-(1,3,4-triazinyl))	>250		
52	2-(5-isoxazolyl)	>250		
53	2-(2-oxazolyl)	>250		
54	2-(4-isoxazolyl)	231-232		
55	2-(1-imidazolyl)	157-158		
56	2-(1-pyrazolyl)	>250		

<u>Cmpd</u>	<u>R</u> **	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> (M+1)	<u>AP-</u> (M-1)
57	2-xyano, 3-clo	215-216		
58	2-nitro, 3-metyl	241-242		
59	2-nitro, 5-metyl	249-250		
60	2-(CH(CH ₃)OCH ₃)	224-225		
61	2-etoxy, 3-metyl	157-158		
62	2-metoxy, 3-clo	191-192		
63	2,5-dimetyl, 4-clo	213-214		
64	2-flo, 6-CH ₂ OCH ₃	182-183		
65	2-isopropyl, 4-xyano, 5-metyl	216-217		
66	2,5-dimetyl, 4-bromo	224-225		
67	2,5-dimetyl, 4-isopropyl	193-194		
68	2-nitro, 5-metoxy	233-234		
69	3-metyl, 4-xyano	231-232		
70	2,5-diisopropyl, 4-xyano	209-210		
71	2,5-dietyl, 4-xyano	237-238		
72	2,5-dipropyl, 4-xyano	181-182		
73	2,5-dietyl, 4-flo	187-188		
74	2,5-diisopropyl, 4-nitro	198-199		
75	2,5-diisopropyl, 4-metoxy	141-142		
76	2,6-dimetyl	>250		
77	3-isopropyl, 4-metoxy	182-183		
78	2,5-diisopropyl, 4-metyl	185-186		
79	2-xyano, 3-flo	227-228		
80	2-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂ , 3-metoxy	157-158		
81	2-etyl	190-191		
82	3-clo, 4-metoxy	204-205		
83	2,3-dimetyl, 5-nitro	>250		
85	2-isopropyl	190-191		
86	2-metyl	193-194		
87	2-iodo	149-150		
88	2-S(O)CH ₃ , 5-metoxy	147-149		
89	2-flo, 4,5-dimetoxy	159-160		
90	2-metyl, 4,5-dimetoxy	196-197		
91	2,3,4,5-tetrametyl	>250		
92	2,3,4,6-tetrametyl	220-221		
93	2,4,5-trimetyl	208-209		
94	-		404	402
95	4-metoxy			432
96	4-metyl		418	416

<u>Cmpd</u>	<u>R **</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
97	4-clo		438	436
98	3-clo		438	436
99	4-xyano			427
100	3,5-diclo		472	470
101	2,5-diclo			470
102	2-metyl, 4-flo	245-250		
103	2-metyl, 5-flo		436	434
104	2-triflometyl		472	470
105	2-bromo		482	
106	3,4-diclo		472	470
107	2,4-diclo		472	470
108	2-flo	*		
109	2-metyl		418	416
110	2,3,4-triclo			504
111	2-metyl, 5-clo		452	450
112	2-clo, 5-nitro		483	
113	2,4,5-triclo			504
114	2,3-diclo		472	470
115	2-metoxo		434	432
116	2-metyl, 5-nitro		463	461
117	2,6-diflo		440	438
118	2-xyclopropyl		444	442
119	2-triflometoxy		488	486
120	2,4,6-trimetyl			444
121	2-xyano		429	427
122	2-CO ₂ CH ₃		462	460
123	2-nitro		449	
124	2-S(O) ₂ CH ₃		482	480
125	OCH ₂ C≡CH		458	456
126	2-triflometoxy, 4-bromo		566	564
127	2,5-dimetoxo		464	462
128	2-SCH ₂ CH ₂ CH ₃			476
129	2,3,4,5,6-pentaflor		494	492
130	2-clo, 4-metyl		452	450
131	2,4-diflo		440	438
132	2,5-diflo		440	438
133	2-flo, 5-clo		456	454
134	3-flo		422	420
135	3,5-diflo		440	438

<u>Cmpd</u>	<u>R</u> **	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
136	2-flo, 4-clo		456	454
137	2-flo, 5-metyl	204-205		
138	2-clo, 4-triflometyl		506	504
139	2,5-dimetyl		432	430
140	3-metoxo	*		
141	3-nitro		449	447
142	2-(1-metyltetrazolyl)		486	484
143	2-flo, 5-triflometyl		490	488
144	3-xyano		429	427
145	3-triflometyl		472	470
146	3-bromo		482	480
147	2,6-diclo, 4-triflometyl		542	540
148	3-amino			417
149	2-bromo, 4-flo		502	500
150	2-bromo, 4-triflometyl		550	
151	2-metyl, 5-diflometoxy	225-226		
319	2-bromo, 5-triflometyl	*		
329	2-metyl, 5-triflometyl	257-258		
330	2,4-diclo, 5-metyl	234-235		
331	2-metyl, 4-bromo, 5-metoxo	228-229		
332	2-metyl, 4-xyano, 5-metoxo	160-162		
333	2-metyl, 4,5-diclo	160-161		
334	2-axetyl	222-223		
335	4-nitro	>250		
336	2-iodo, 4-metoxo	204-205		
337	2-triflometoxy, 5-clo	212-213		
338	2-dimetylamino, 5-nitro	220-221		
339	3,5-dicarbometoxy	231-232		
340	3,5-di(triflometyl)	>250		
341	2,5-dibromo, 4-isopropyl	143-144		
342	2-metyl, 4-bromo	207-208		
343	2-metyl, 5-metoxo	206-207		
344	2,5-diflo, 4-bromo	208-209		
345	2-nitro, 4-isopropyl, 5-bromo	210-211		
346	2,6-dibromo, 4-metyl	198-199		
347	2-metyl, 4-clo	209-210		
348	3-dimetylamino	126-127		
349	4-flo	242-243		
350	4-(CF ₂ CF ₂ H)	194-195		

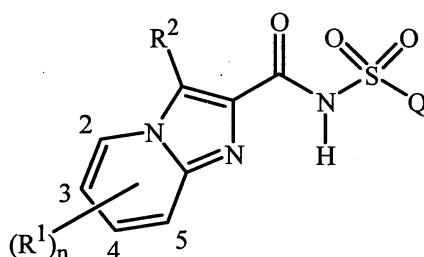
<u>Cmpd</u>	<u>R</u> **	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
351	2-iodo, 3-nitro	246-247		
352	2-flo, 3-clo	239-240		
353	2-bromo, 3-metyl	206-207		
354	2,5-dicarbometoxy	234-235		
355	2,5-dietyl, 4-bromo	184-185		
356	2-clo, 5-metyl	>250		
357	2-bromo, 5-metyl	251-252		
358	2-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-metylthio	225-226		
359	2-clo, 5-etoxy	255-256		
360	2,5-diclo, 4-nitro	225-226		
361	2,5-dimetyl, 4-metoxy	233-234		
362	2-C(CH ₃) ₃	175-176		
363	2-(CH=NOCH ₃)	200-201		
364	2,5-dimetyl, 4-iodo	219-220		
365	2,5-dimetyl, 4-(C≡CSi(CH ₃) ₃)	201-202		
366	2,5-dimetyl, 4-(C≡CH)	171-172		
367	2-clo, 5-isopropoxy	217-218		
368	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	219-220		
369	2,5-di(C(O)N(CH ₃) ₂)	198-199		
370	2,5-di(SO ₂ N(CH ₃) ₂)	171-172		
371	2-clo, 5-OCH ₂ CF ₃	>250		
372	2,4-diclo, 5-OCH ₂ C≡CH	202-203		
373	2-clo, 5-amino	195-196		
374	2-clo, 5-hydroxy	139-140		
375	2-clo, 5-NHC(O)CH ₃	206-207		
376	2-clo, 5-OCH ₂ CH=CH ₂	251-252		
377	2-clo, 5-OCH ₂ C≡CH	217-218		
378	2-clo, 5-NHC(O)OCH ₃	255-256		
379	2-clo, 5-bromo	>250		
380	2-clo, 5-(C≡CSi(CH ₃) ₃)	>250		
381	2-clo, 5-(C≡CH)	238-240		
382 (Ex. 3)	2-clo, 5-etyl	214-215		
383	2-clo, 5-dimetylamino	>250		
384	2-metyl, 5-dimetylamino	>250		
385	2-clo, 4-bromo, 5-metoxy	224-225		
386	2-clo, 4-xyano, 5-metoxy	>250		
387	2-clo, 4-bromo, 5-metyl	210-211		
388	2-clo, 4-xyano, 5-metyl	229-230		
389	2-clo, 5-metylthio	255-256		

<u>Cmpd</u>	<u>R</u> **	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> (M+1)	<u>AP-</u> (M-1)
390	3-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃	167-168		
391	NHC(O)NHCH ₃	188-189		
392	2-clo, 5-OC(O)CH ₃	178-179		
393	3-NHC(O)(4-flophenyl)	201-202		
394	2-metyl, 5-axetyl	222-223		
395	2-bromo, 5-propyl	213-214		
396	2-propyl, 5-bromo	244-245		
397	2-bromo, 5-isopropyl	204-205		
398	2-isopropyl, 5-bromo	129-130		
399	2-etyl, 5-clo	219-220		
480	2-clo, 5-triflometoxy	217-218		

* Xem Bảng phụ lục E về dữ liệu ¹H NMR.

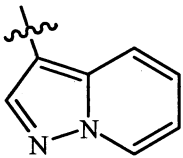
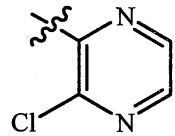
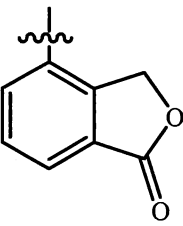
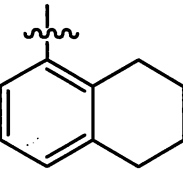
** “-” để chỉ R là H (tức là vòng phenyl không được thế)

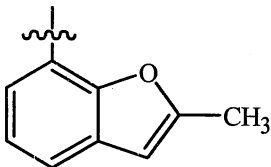
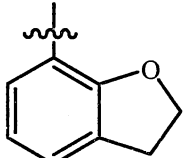
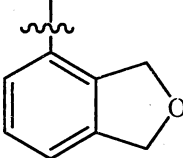
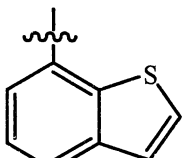
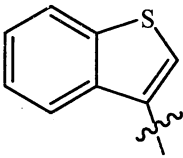
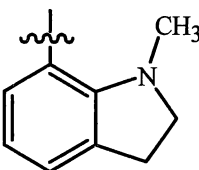
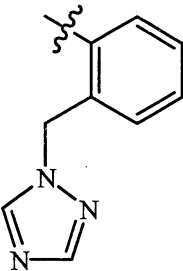
Bảng phụ lục B

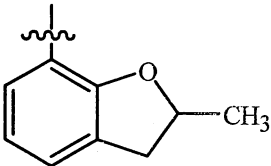
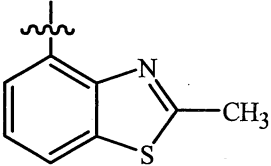


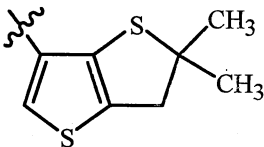
R² là H

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> (M+1)	<u>AP-</u> (M-1)
152	3-CF ₃ , 5-Cl	3-clo-2-pyridinyl	196-197		
153	3-CF ₃ , 5-Cl	6-clo-2-pyridinyl	236-237		
154	3-CF ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-pyridinyl	192-193		
155	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CF ₃ -6-OCH ₃ -2-pyridinyl	211-212		
156	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CO ₂ CH ₃ -6-CF ₃ -2-pyridinyl	212-213		
157	3-CF ₃ , 5-Cl	3-OCH ₂ CF ₃ -6-CF ₃ -2-pyridinyl	244-245		
158	3-CF ₃ , 5-Cl	3-iodo-6-clo-2-pyridinyl	241-242		
159	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CF ₃ -2-pyridinyl	176-177		
160	3-CF ₃ , 5-Cl	6-CF ₃ -2-pyridinyl	236-237		
161	3-CF ₃ , 5-Cl	3-C(O)N(CH ₃) ₂ -6-CF ₃ -2-pyridinyl	152-153		
162	3-CF ₃ , 5-Cl	4-clo-3-pyridinyl	196-197		
163	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-3-pyridinyl	194-195		
164	3-CF ₃ , 5-Cl	2-SCH ₂ CH ₃ -3-pyridinyl	255-256		

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
165	3-CF ₃ , 5-Cl	2-OCH ₂ CH ₃ -3-pyridinyl	192-193		
166	3-CF ₃ , 5-Cl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	229-230		
167	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-thiazolyl	208-209		
168	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-thienyl	216-217		
169	3-CF ₃ , 5-Cl		252-253		
170	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-3-clo-4-pyrazolyl	202-203		
171	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-clo-3-pyrazolyl	>250		
172	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-5-clo-4-pyrazolyl	>250		
173	3-CF ₃ , 5-Cl		190-191		
174	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-5-etyl-4-pyrazolyl	212-214		
175	3-CF ₃ , 5-Cl	1,3,5-trimetyl-4-pyrazolyl	>250		
176	3-CF ₃ , 5-Cl	2,4-dimetyl-5-thiazolyl	202-203		
177	3-CF ₃ , 5-Cl	2-xyano-3-thienyl	251-252		
178	3-CF ₃ , 5-Cl	2-metyl-1,3,4-thiadiazol-5-yl	204-205		
179	3-CF ₃ , 5-Cl	3-metyl-2-thienyl	218-219		
180	3-CF ₃ , 5-Cl	4-metyl-2-thienyl	195-196		
181	3-CF ₃ , 5-Cl	1-etyl-5-pyrazolyl	169		
182	3-CF ₃ , 5-Cl	1,5-dimetyl-4-pyrazolyl	242-243		
183	3-CF ₃ , 5-Cl	4-metyl-2-pyridinyl	212-213		
184	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-5-pyrazolyl	176-177		
185	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-pyrazolyl	240-241		
186	3-CF ₃ , 5-Cl	2-furanyl	216-217		
187	3-CF ₃ , 5-Cl		>250		
188	3-CF ₃ , 5-Cl		210-211		

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
189	3-CF ₃ , 5-Cl		223-224		
190	3-CF ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-thienyl	233-234		
191	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-SCH ₃ -5-pyrazolyl	178-179		
192	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-2SCH ₃ -3-pyrollyl	226-227		
193	3-CF ₃ , 5-Cl		233-235		
194	3-CF ₃ , 5-Cl		238-240		
195	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(2-thienyl)phenyl	243-244		
196	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-5-SO ₂ CH ₃ -4-pyrazolyl	>250		
197	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(3-metyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl)	252-253		
198	3-CF ₃ , 5-Cl	2-xyano-3-benzothiazolyl	205-206		
199	3-CF ₃ , 5-Cl		243-244		
200	3-CF ₃ , 5-Cl		222-223		
201	3-CF ₃ , 5-Cl		206-207		
202	3-CF ₃ , 5-Cl		236-237		
203	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(3-metyl-5-isoxazolyl)phenyl	234-235		

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
204	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(1-metyl-4-pyrazolyl)phenyl	211-212		
205	3-CF ₃ , 5-Cl	1-benzyl-4-imidazolyl	>250		
206	3-CF ₃ , 5-Cl	1-benzyl-4-pyrazolyl	226-227		
208	3-CF ₃ , 5-Cl	2-metyl-4-CO ₂ CH ₃ -5-oxazolyl	171-172		
209	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-CO ₂ CH ₂ CH ₃ -3-pyrazolyl	>250		
210	3-CF ₃ , 5-Cl	1,3-dimetyl-5-CO ₂ CH ₃ -4-pyrazolyl	232-233		
211	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CO ₂ CH(CH ₃) ₂ -2-furanyl	173-174		
212	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-CON(CH ₃) ₂ -5-pyrazolyl	254-255		
213	3-CF ₃ , 5-Cl	1-xyano-3-naphtalenyl	226-227		
214	3-CF ₃ , 5-Cl	1-xyano-4-naphtalenyl	203-204		
215	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-5-CON(CH ₃) ₂ -4-pyrollyl	178-179		
216	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-3-(5-oxazolyl)-4-pyrazolyl	252-253		
217	3-CF ₃ , 5-Cl	3-metyl-2-benzothieryl	229-230		
218	3-CF ₃ , 5-Cl		>250		
219	3-CF ₃ , 5-Cl	3-SO ₂ CH ₃ -2-furanyl	243-244		
220	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(1,2,4-triazol-1-yl)-3-pyridinyl	>250		
221	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CON(CH ₃) ₂ -2-thienyl	219-220		
222	3-CF ₃ , 5-Cl		246-247		
223	3-CF ₃ , 5-Cl	1-phenyl-2-imidazolyl	211-212		
224	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CON(CH ₃) ₂ -3-furanyl	200-201		
225	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CO ₂ CH ₃ -1,2,5-thiadiazol-4-yl	195-196		
226	3-CF ₃ , 5-Cl	4-CO ₂ CH ₃ -5-thiazolyl	220-221		
227	3-CF ₃ , 5-Cl	2-metyl-1-naphtalenyl	219-220		
228	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CO ₂ CH ₃ -3-thienyl	224-225		
229	3-Cl	Phenyl			334
230	3-Cl	4-metylphenyl		350	348
231	3-Cl	4-clophenyl			368
232	3-Cl	4-metoxypheyl		366	364
233	3-Cl	4-xyanophenyl			359
234	3-Cl	3-clophenyl			368
237	3-Cl	3,5-diclophenyl			402
238	3-Cl	2,5-diclophenyl	230-232		
239	3-Cl	2-metyl-4-flophenyl	265-270		

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+ (M+1)</u>	<u>AP- (M-1)</u>
240	3-Cl	2-metyl-5-flophenyl			366
241	3-CF ₃ , 5-Cl	2-pyridinyl			403
242	3-Cl, 5-Cl	2-clophenyl	404	402	
243	3-Cl, 5-Cl	2,5-diclophenyl	438	436	
244	3-CF ₃ , 5-Cl	3-metyl-2-pyridinyl	419	417	
245	3-CF ₃ , 5-Cl	2-thienyl	410	408	
246	3-Cl, 5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	472	470	
247	3-Cl, 5-Cl	2-clo-6-metylphenyl	418	416	
248	3-CF ₃	2-clophenyl	404	402	
249	3-Cl	2-clophenyl			368
250	5-CF ₃	2-clophenyl	404	402	
251	3-CF ₃ , 5-Cl	1,3-dimetyl-4-pyrazolyl	*		
252	3-Br, 5-Br	2-clophenyl	492	490	
253	3-I	2-clophenyl	462	460	
254	5-CN	2-clophenyl			359
255	3-CF ₃ , 5-Cl	3-clo-2-thienyl			442
256	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-diclo-3-thienyl	478	476	
257	3-Br	2-clophenyl	414	412	
258	3-CF ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-thienyl	490	488	
259	-	2-clophenyl	336	334	
260	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CON(CH ₃) ₂ -3-thienyl			479
261	3-CF ₃ , 5-Cl		496	494	
262	3-CF ₃ , 5-Cl	5-imadazolyl	394	392	
263	3-CF ₃ , 5-Cl	4,5-diclo-2-thienyl			476
264	3-CF ₃ , 5-Cl	5-bromo-6-clo-3-pyridinyl			515
265	3-CF ₃ , 5-Cl	4,5-dibromo-2-thienyl			564
266	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metoxypheyl	380	378	
267	3-CH ₃ , 5-Cl	2,5-dimetylphenyl	378	376	
268	3-CF ₃ , 5-Cl	4-bromo-3-thienyl	488		
269	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clophenyl	384	382	
270	3-CH ₃ , 5-Cl	2-thienyl	356	354	
271	3-CH ₃ , 5-Cl	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	369	367	
272	3-CF ₃ , 5-Cl	3-thienyl	410	408	
273	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	452		
274	3-CF ₃ , 5-Cl	5-clo-1,3-dimetyl-4-pyrazolyl	456	454	
275	3-CF ₃ , 5-Cl	1-metyl-4-imidazolyl	408	406	

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> (M+1)	<u>AP-</u> (M-1)
276	3-CF ₃	3,5-dimethyl-4-isoxazolyl		389	387
277	3-Br, 5-Br	3,5-dimethyl-4-isoxazolyl		477	475
278	3-Br, 5-Br	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	*		
279	3-Br, 5-Br	2,5-dimethylphenyl	*		
280	3-Br, 5-Br	2-thienyl	*		
281	3-Br, 5-Br	3-metoxyphenyl	*		
282	3-CN	2-flophenyl		345	343
283	3-CN	2-thienyl			331
284	3-CN	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	*		
285	3-CN	2,5-dimethylphenyl			353
286	3-CN	2-clophenyl			359
287	3-CF ₃ , 5-CF ₃	2-flophenyl		456	454
288	3-CF ₃ , 5-CF ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl		540	
289	3-C(O)NH ₂	2-flophenyl	*		
290	5-Cl	2-thienyl			340
291	3-CF ₃	2-thienyl		328	
292	3-CF ₃	2,5-dimethylphenyl		398	396
293	5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl		438	
294	5-Cl	2-clophenyl		370	368
295	5-Cl	2-flophenyl		354	352
296	5-Cl	2,5-dimethylphenyl		364	362
297	3-CF ₃	2,5-dibromophenyl		560	
298	3-CF ₃	2-flophenyl		388	386
299	3-CF ₃	2-methylphenyl		384	382
300	3-CF ₃	2-clo-4-(triflometyl)phenyl		472	470
301	3-CF ₃	2-clo-4-flophenyl			420
302	2-CF ₃	2,5-dimethylphenyl		398	396
303	2-CF ₃	2-clophenyl		404	402
304	2-CF ₃	2-thienyl		376	324
305	2-CF ₃	3-metoxyphenyl		400	398
306	2-CF ₃	2-flophenyl		388	386
307	4-CF ₃	2,5-dimethylphenyl		398	396
308	4-CF ₃	2-clophenyl		404	402
309	4-CF ₃	2-thienyl		376	374
310	4-CF ₃	3-metoxyphenyl		400	398
311	4-CF ₃	2-flophenyl		388	386
312	2-CF ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl		472	470
313	4-CF ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl		472	470
314	3-CF ₃ , 5-Br	2-clo-5-(triflometyl)phenyl		550	548

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
315	3-CF ₃ , 5-Br	2-bromo-5-(triflometyl)phenyl	*		
316	3-CF ₃ , 5-Br	2-flophenyl		466	465
400	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-diclo-4-bromo-3-thienyl	245-246		
401	3-CF ₃ , 5-Br	2-clophenyl	188-193		
403	3-CF ₃ , 5-Br	2,5-dimetylphenyl	>250		
404	3-CF ₃ , 5-Br	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	224-225		
405	3-CF ₃ , 5-Br	4-xyano-2,5-dimetylphenyl	193-194		
406	3-CF ₃ , 5-F	2,5-dimetylphenyl	181-182		
407	3-CF ₃ , 5-F	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	186-187		
408	3-CF ₃ , 5-F	4-clo-2,5-dimetylphenyl	185-186		
409	3-CF ₃ , 5-F	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	176-177		
410	3-CF ₃ , 5-Br	4-clo-2,5-dimetylphenyl	190-191		
411	3-CF ₃ , 5-Br	4,5-dimetoxy-2-metylphenyl	110-111		
412	3-CF ₃ , 5-F	4,5-dimetoxy-2-metylphenyl	100-101		
413 (Ex.6)	3-CF ₃ , 5-Br	2-clo-5-metoxyphenyl	191-192		
414	3-CF ₃ , 5-F	2-clo-5-metoxyphenyl	193-194		
415	3-CF ₃ , 5-F	4-xyano-2,5-dimetylphenyl	206-207		
416	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	2,5-dimetylphenyl	195-196		
417	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	189-190		
418	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	4-clo-2,5-dimetylphenyl	194-195		
419	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	196-197		
420	3-CF ₃	5-axetyl-2-clophenyl	217-218		
421	3-CF ₃	4,5-dimetoxy-2-metylphenyl	164-165		
422	-	2-clo-5-metoxyphenyl	>250		
423	-	4-xyano-2,5-dimetylphenyl	>250		
424	3-CF ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	>250		
425	-	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	239-240		
426	3-CF ₃ , 5-Cl	6-clo-5-(triflometyl)-2-pyridinyl	236-237		
427	3-CF ₃	4-xyano-5-metoxy-2-metylphenyl	227-228		
432	-	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	>250		
433	3-CF ₃ , 5-Cl	3-metyl-6-metyl-amino-2-pyridinyl	>250		
434	3-CF ₃ , 5-Cl	3-clo-6-metyl-amino-2-pyridinyl	190-191		
435	3-CF ₃ , 5-Cl	3-xyano-4,6-dimetyl-2-pyridinyl	195-196		
436	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-diclo-6-dimetyl-amino-2-pyridinyl	238-239		
437	3-CF ₃ , 5-Cl	3-iodo-6-metyl-amino-2-pyridinyl	156-157		
438	-	2-bromo-5-(triflometyl)phenyl	>250		
439	3-CF ₃	5-metoxy-2-metylphenyl	179-180		
440	3-CF ₃	2-axetyl-amino-4-metyl-5-thiazolyl	248-249		
445	3-CF ₃ , 5-CN	2,5-dimetylphenyl	202-203		

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
446	3-CF ₃ , 5-Cl	6-dimethylamino-3-iodo-2-pyridinyl	179-180		
447	3-CF ₃ , 5-C(O)NH ₂	4-xyano-2,5-dimethylphenyl	>250		
448	3-CF ₃ , 5-CN	2-xyano-5-(triflometyl)phenyl	*		
449	3-CF ₃	2-clo-5-etoxyphenyl	224-225		
451	3-CF ₃ , 5-SCH ₂ CH ₃	2-clo-5-metoxypheyl	195-196		
455	3-CF ₃ , 5-Cl	5-(2-metoxypheyl)-2-thienyl	167-168		
456	3-CF ₃ , 5-Cl	2-axetyl-3-thienyl	178-179		
457	3-CF ₃ , 5-Cl	4-nitro-2-thienyl	192-193		
458	3-CF ₃ , 5-CH ₃	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	184-185		
459	3-CF ₃ , 5-CH ₃	2,5-dimethylphenyl	235-236		
460	3-CF ₃	2-clo-5-metylphenyl	219-220		
461	3-CF ₃	5-metyl-2-nitrophenyl	>250		
462	3-CF ₃	2-clo-5-etylphenyl	217-218		
463	3-CF ₃	5-C(CH ₃) ₃ -2-nitrophenyl	202-203		
464	3-CF ₃ , 5-Cl	5-metyl-4-isoxazolyl	170-171		
465 (Ex.4)	3-CF ₃ , 5-Cl	1-etyl-3-metyl-4-imidazolyl	189-190		
466	3-CF ₃	1-etyl-3-metyl-4-imidazolyl	148-149		
467	3-CF ₃	5-bromo-2-clophenyl	>250		
468	3-CF ₃	2-bromo-5-(triflometyl)phenyl	>250		
469	3-CF ₃	5-metoxo-2-nitrophenyl	228-229		
470	3-CF ₃	5-axetyl-2-metylphenyl	206-207		
471	3-CF ₃	2-bromo-5-propylphenyl	189-190		
474 (Ex.5)	3-CF ₃ , 5-Cl	3-clo-1-etyl-4-imidazolyl	184-185		
475	3-CF ₃ , 5-Cl	3-clo-1-isopropyl-4-imidazolyl	221-222		
476	3-CF ₃ , 5-Cl	1-isopropyl-3-metyl-4-imidazolyl	163-164		

* Xem Bảng phụ lục E về dữ liệu ¹H NMR.

R² là Br

<u>Cmpd</u>	<u>(R¹)_n</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>	<u>AP-</u> <u>(M-1)</u>
317	3-CF ₃ , 5-Cl	2-flophenyl	*		
318	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl			582
402	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-dimethylphenyl	189-190		
441	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-metoxypheyl	202-203		
442	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	194-195		
443	3-CF ₃ , 5-Cl	4-xyano-5-metoxo-2-metylphenyl	232-233		
444	3-CF ₃ , 5-Cl	4-xyano-2,5-dimethylphenyl	108-109		

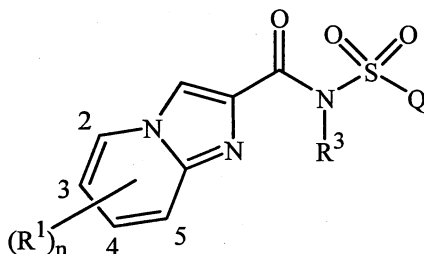
* Xem Bảng phụ lục E về dữ liệu ¹H NMR.

R ² là <u>CH₃</u>			
<u>Cmpd</u>	(R ¹) _n	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>
428	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-dimethylphenyl	191-192
429	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	229-230
430	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-dimetyl-4-isoxazolyl	176-177
431 (Ex.7)	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-metoxypheyl	222-223
472	3-CF ₃	2-clo-5-metoxypheyl	222-223
473	3-CF ₃	2-bromo-5-propylphenyl	204-205

R ² là <u>CN</u>			
<u>Cmpd</u>	(R ¹) _n	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>
450	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-dimetylphenyl	>250

R ² là <u>CH₂CH₃</u>			
<u>Cmpd</u>	(R ¹) _n	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>
452	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-dimetylphenyl	202-203
453	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-(triflometyl)phenyl	188-189
454	3-CF ₃ , 5-Cl	2-clo-5-metoxypheyl	161-162

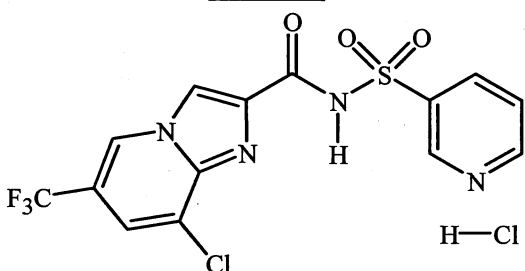
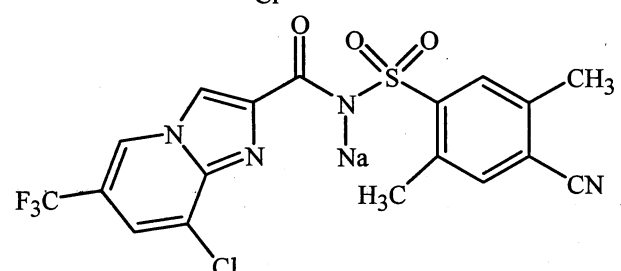
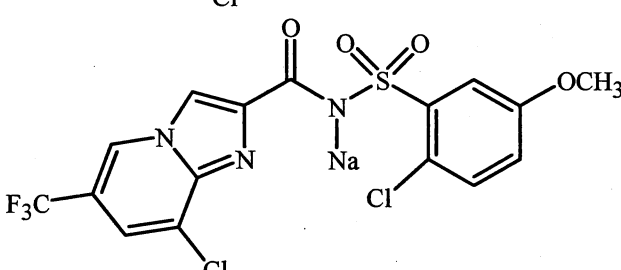
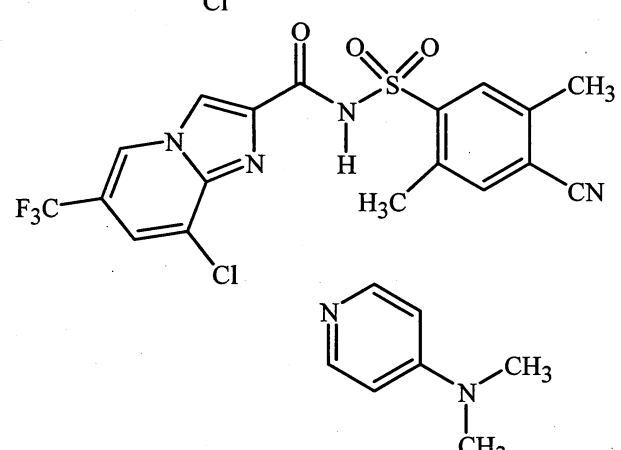
Bảng phụ lục C



<u>Cmpd</u>	(R ¹) _n	<u>R³</u>	<u>Q</u>	<u>m.p. (°C)</u>
320	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₃	4-metylphenyl	*
321	3-Cl	CH ₃	4-metylphenyl	*
322	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₃	2-clophenyl	*
323	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CH ₃	2-clophenyl	*
324	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CF ₃	2-clophenyl	*
325	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ ClCH	2-clophenyl	*
326	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	2-clophenyl	*

* Xem Bảng phụ lục E về dữ liệu ¹H NMR.

Bảng phụ lục D

<u>Cmpd</u>	<u>Cấu trúc</u>	<u>m.p. (°C)</u>
328		*
477		>250
478		>250
479		185-186

* Xem Bảng phụ lục E về dữ liệu ^1H NMR.

Bảng phụ lục E

<u>Hợp chất</u>	<u>Dữ liệu ^1H NMR a</u>
<u>số</u>	
322	δ (axeton- d_6) 9,15 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 3,98 (s, 3H).

- 323 δ (axeton- d_6) 9,15 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 4,73 (q, 2H), 1,56 (t, 3H).
- 324 δ (axeton- d_6) 9,17 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,8-7,65 (m, 3H), 6,0 (br s, 2H).
- 325 δ (axeton- d_6) 9,18 (s, 1H), 8,66 (s, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 5,71 (s, 2H), 2,83 (s, 1H).
- 326 δ (axeton- d_6) 9,14 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 6,2 (m, 1H), 5,46 (s, 2H), 5,4 (d, 1H), 5,2 (d, 1H).
- 108 δ (axeton- d_6) 11,25 (br s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,15 (t, 1H), 7,8 (m, 2H), 7,5 (t, 1H), 7,4 (dd, 1H).
- 140 δ (dmso- d_6) 9,29 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,64-7,48 (m, 3H), 7,29 (d, 1H), 3,88-3,78 (m, 3H).
- 319 δ (dmso- d_6) 9,33 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,96 (s, 2H).
- 278 δ (dmso- d_6) 9,03 (d, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,37 (d, 1H), 8,09 (dd, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,92 (d, 1H).
- 279 δ (dmso- d_6) 9,01 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,47-7,35 (m, 1H), 7,28 (d, 1H), 2,57 (s, 3H), 2,37 (s, 3H).
- 280 δ (dmso- d_6) 9,04-9,01 (m, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,05 (dd, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,22 (dd, 1H).
- 281 δ (dmso- d_6) 8,98 (d, 1H), 8,58 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,67-7,48 (m, 3H), 7,27 (s, 1H), 3,83 (s, 3H).
- 284 δ (dmso- d_6) 9,47 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,99 (br s, 1H), 7,83 (br s, 3H).
- 289 δ (dmso- d_6) 9,23 (br s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,22 (br s, 2H), 7,93 (br s, 2H), 7,66 (br s, 3H), 7,33 (br s, 2H).
- 297 δ (dmso- d_6) 9,34 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,81 (d, 2H).
- 317 δ (dmso- d_6) 8,63 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,51-7,42 (m, 1H), 7,24 (m, 1H), 7,17 (d, 1H).
- 328 δ (dmso- d_6) 9,29 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,45-8,34 (m, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,70 (dd, 1H).
- 251 δ 8,46 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 3,86 (s, 3H), 2,48 (s, 3H).
- 315 δ (dmso- d_6) 9,35 (d, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,39 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,97 (s, 1H).

- 448 δ (dmso- d_6) 9,57 (br s, 1H), 8,73 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,96 (s, 1H).
- 320 δ 8,48 (m, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,07 (m, 2H), 7,48 (m, 1H), 7,37 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,45 (s, 3H).
- 321 δ 8,16 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,99 (m, 2H), 7,57 (m, 2H), 7,34 (m, 2H), 7,23 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 2,43 (s, 3H).

^a Dữ liệu ¹H NMR được tính theo ppm tính từ tetrametylsilan. Dung dịch CDCl₃ trừ khi có quy định khác; “axeton- d_6 ” là CD₃C(=O)CD₃; “dmso- d_6 ” là CD₃S(=O)CD₃. Sự liên hợp được chỉ định bằng (s)-vạch đơn, (d)-vạch đôi, (t)-vạch ba, (m)-đa vạch, (dd)-cặp vạch đôi, (br s)-vạch đơn rộng.

Ví dụ sinh học theo sáng chế

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

Thử nghiệm A

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

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

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

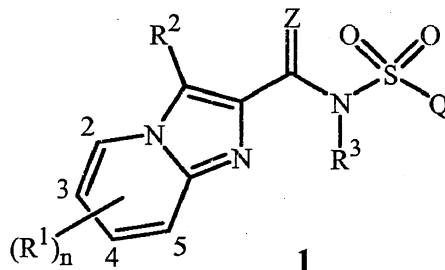
Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở nồng độ 250 ppm, các hợp chất sau bộc lộ tác dụng bảo vệ thực vật tốt (mức phá hại rễ giảm 50% hoặc lớn hơn so với

các mẫu kiểm chứng được xử lý bằng dung môi) và không có độc tố thực vật đáng kể: 4, 5, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 17, 19, 24, 25, 28, 29, 30, 32, 34, 38, 57, 59, 63, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 75, 83, 89, 90, 93, 101, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 116, 117, 120, 126, 130, 131, 132, 133, 134, 136, 137, 139, 140, 143, 145, 149, 152, 157, 159, 162, 163, 167, 169, 170, 171, 172, 174, 175, 176, 179, 180, 181, 184, 186, 188, 193, 206, 241, 244, 245, 248, 251, 252, 253, 257, 258, 259, 272, 274, 279, 285, 292, 294, 297, 298, 299, 301, 313, 314, 315, 317, 318, 319, 323, 329, 331, 332, 333, 334, 340, 341, 342, 344, 345, 347, 348, 355, 359, 360, 361, 364, 365, 366, 367, 371, 372, 373, 375, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 393, 394, 395, 396, 397, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 409, 410, 411, 412, 413, 414, 415, 417, 418, 419, 420, 421, 422, 424, 425, 426, 427, 429, 430, 436, 439, 441, 442, 443, 444, 445, 449, 450, 451, 458, 459, 460, 461, 462, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 474, 475, 476, 477, 478 và 479.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở nồng độ 50 ppm, các hợp chất sau bộc lộ tác dụng bảo vệ tốt (mức phá hại rễ giảm 50% hoặc lớn hơn so với các mẫu kiểm chứng được xử lý bằng dung môi) và không có độc tố thực vật đáng kể: 2, 4, 7, 9, 10, 11, 13, 19, 30, 59, 63, 66, 67, 68, 69, 71, 73, 86, 90, 94, 101, 103, 105, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 116, 117, 130, 132, 133, 137, 139, 140, 143, 149, 151, 157, 162, 163, 167, 170, 175, 176, 179, 180, 241, 245, 248, 251, 252, 258, 259, 268, 272, 274, 279, 292, 297, 298, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 329, 331, 332, 337, 341, 342, 343, 348, 356, 357, 359, 366, 367, 371, 372, 373, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 386, 388, 394, 395, 396, 397, 401, 402, 403, 405, 406, 407, 408, 410, 411, 413, 414, 415, 416, 419, 420, 424, 427, 428, 429, 430, 431, 436, 439, 441, 442, 443, 444, 445, 449, 451, 458, 459, 460, 462, 465, 466, 467, 469, 470, 471, 474, 475, 477, 478 và 479.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó,



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ

nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm phenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ và R^{14} ;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R^4 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần

tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{4a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^5 độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C_1 - C_6 alkyl;

mỗi R^6 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{6a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, $C(O)R^{13}$ hoặc $C(O)OR^{13}$;

mỗi R^7 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{7a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^8 độc lập là H , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{8a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^9 độc lập là H , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4

haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{11a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl;

mỗi R^{12} độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{13} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{14} độc lập là C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl,

C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{15} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi m độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4;

với điều kiện khi n bằng 2 và một R^1 là CF_3 ở vị trí 3 trong công thức 1 và R^1 kia là Cl ở vị trí 5 trong công thức 1, và R^2 và R^3 là H, thì Q không phải là 2-clophenyl, 2-clo-6-metylphenyl, 2,6-diclophenyl, 2-clo-4-flophenyl, 2,5-bis(2,2,2-trifloetoxy)phenyl, 2,4,6-triclophenyl, 2-clo-5-(triflometyl)-phenyl hoặc 3,5-đimetyl-4-isoxazolyl.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

Z là O; và

Q là phenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

3. Hợp chất theo điểm 2, trong đó:

Q là phenyl, pyridyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, furanyl hoặc thienyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

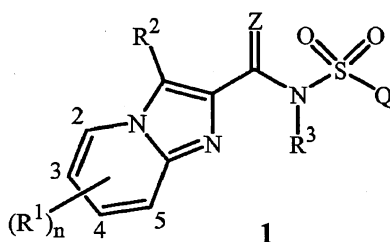
4. Hợp chất theo điểm 2 hoặc 3, trong đó:

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, OR^4 , C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

R^2 là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl;

R^3 là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ hoặc $S(O)_mR^9$; hoặc C_1 - C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 hoặc⁴; và n bằng 1 hoặc 2.

5. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này được chọn từ nhóm bao gồm:
 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metoxypheyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(4-xyano-2,5-đimetylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
N-[(5-axetyl-2-clophenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(3-metyl-2-thienyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(4-metyl-2-thienyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(3-clo-1-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(5-metoxi-2-nitrophenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit;
 8-clo-*N*-[(2-clo-5-etylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(1-etyl-3-metyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-bromo-*N*-[(2-clo-5-metoxypheyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
N-[(2-bromo-5-metylphenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(2-clo-5-metylphenyl)sulfonyl]-6-(triflometyl)-imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit,
 8-clo-*N*-[(3-clo-1-etyl-1*H*-pyrazol-4-yl)sulfonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit, và
N-[(5-axetyl-2-metylphenyl)sulfonyl]-8-clo-6-(triflometyl)imidazo[1,2-*a*]pyridin-2-carboxamit.
6. Chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó,



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^3 là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$,

$S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm phenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ và R^{14} ;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R^4 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{4a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^5 độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C_1-C_6 alkyl;

mỗi R^6 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{6a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, $C(O)R^{13}$ hoặc $C(O)OR^{13}$;

mỗi R^7 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{7a} độc lập là C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^8 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$,

$C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{8a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^9 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{11}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6

alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{11a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl;

mỗi R^{12} độc lập là H, $NR^{8a}R^{6a}$, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{13} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{14} độc lập là C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{15} độc lập là C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc

phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi m độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

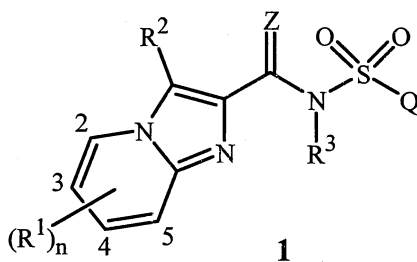
n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4;

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

7. Chế phẩm theo điểm 6, trong đó chế phẩm còn chứa ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acrinathrin, amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenbutatin oxide, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, xà phòng diệt côn trùng, isofenphos, lufenuron, malathion, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbutate, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxifen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tolfenpyrad,

tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, tất cả các chủng *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn ký sinh và gây bệnh cho côn trùng, tất cả các chủng virus Nucleo polyhydrosis, virus ký sinh và gây bệnh cho côn trùng và nấm ký sinh và gây bệnh cho côn trùng.

8. Chế phẩm theo điểm 7, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bifenthrin, buprofezin, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flufenoxuron, fluvalinate, formetanate, hexaflumuron, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, triazamate, triflumuron, tất cả các chủng *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng virus *Nucleo polyhydrosis*.
9. Phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh không phải là phương pháp điều trị bệnh, bao gồm bước cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó,



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$,

$\text{OS(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^7$, $\text{N(R}^{10})\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{R}^9$ hoặc $\text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$; hoặc $\text{C}_3\text{-C}_7$ xycloalkyl, $\text{C}_4\text{-C}_8$ xycloalkylalkyl, $\text{C}_6\text{-C}_{14}$ xycloalkylxycloalkyl hoặc $\text{C}_5\text{-C}_7$ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ haloalkyl, OR^{4a} và $\text{S(O)}_m\text{R}^{9a}$; hoặc $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$ và $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ alkynyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ haloalkyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ haloalkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkoxyalkyl, C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$, $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, OC(O)R^{7a} và $\text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $\text{Si(R}^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ haloalkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkynyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ haloalkynyl, C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$, $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, OC(O)R^7 , OC(O)OR^8 , $\text{OC(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{OS(O)}_2\text{R}^9$, $\text{OS(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^7$, $\text{N(R}^{10})\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{R}^9$ hoặc $\text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$; hoặc $\text{C}_3\text{-C}_7$ xycloalkyl, $\text{C}_4\text{-C}_8$ xycloalkylalkyl $\text{C}_6\text{-C}_{14}$ xycloalkylxycloalkyl hoặc $\text{C}_5\text{-C}_7$ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ haloalkyl, OR^{4a} và $\text{S(O)}_m\text{R}^{9a}$; hoặc $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$ và $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ alkynyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ haloalkyl, $\text{C}_2\text{-C}_4$ haloalkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkoxyalkyl, C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$, $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, OC(O)R^{7a} và $\text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^{7a}$;

R^3 là H, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ haloalkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkynyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ haloalkynyl, C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$ hoặc $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$; hoặc $\text{C}_3\text{-C}_7$ xycloalkyl, $\text{C}_4\text{-C}_8$ xycloalkylalkyl hoặc $\text{C}_5\text{-C}_7$ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ haloalkyl, OR^{4a} và $\text{S(O)}_m\text{R}^{9a}$; hoặc $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^9$ và

$S(O)NR^{11}R^{12}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm phenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh hoặc an hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ và R^{14} ;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R^4 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{4a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^5 độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập

được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C_1 - C_6 alkyl;

mỗi R^6 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{6a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, $C(O)R^{13}$ hoặc $C(O)OR^{13}$;

mỗi R^7 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{7a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^8 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{8a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^9 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{11a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl;

mỗi R^{12} độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi

nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆ alkoxyalkyl, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R¹³ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl, C₆-C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a};

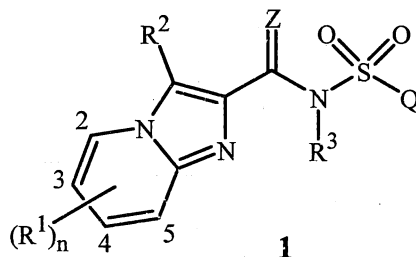
mỗi R¹⁴ độc lập là C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl, C₆-C₁₄ xycloalkylxycloalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ và S(O)₂NR¹¹R¹²; hoặc phenyl, naphthalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi R¹⁵ độc lập là C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ alkynyl hoặc C₂-C₆ haloalkynyl; hoặc C₃-C₇ xycloalkyl, C₄-C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₅-C₇ xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, OR^{4a} và S(O)_mR^{9a}; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₆ alkoxyalkyl, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} và N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

mỗi m độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4.

10. Phương pháp theo điểm 9, trong đó môi trường là thực vật.
11. Phương pháp theo điểm 9, trong đó môi trường là hạt.
12. Phương pháp theo điểm 11, trong đó hạt được phủ bằng hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, được pha chế dưới dạng chế phẩm chứa chất tạo màng hoặc chất kết dính.
13. Hạt đã được xử lý, trong đó hạt này chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó,



trong đó:

Z là O hoặc S;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 là H, halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ hoặc $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được

thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphtalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^3 là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl được thế bằng 1 hoặc 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm phenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q là phenyl, naphtalenyl, vòng dị thơm có từ 5 đến 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ và R^{14} ;

mỗi X độc lập là O hoặc S;

mỗi R^4 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{4a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_6 haloalkyl;

mỗi R^5 độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{5a} độc lập là H hoặc C_1 - C_6 alkyl;

mỗi R^6 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{6a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, $C(O)R^{13}$ hoặc $C(O)OR^{13}$;

mỗi R^7 độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 alkynyl hoặc C_2 - C_6 haloalkynyl; hoặc C_3 - C_7 xycloalkyl, C_4 - C_8 xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5 - C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4

haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{7a} độc lập là C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^8 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{8a} độc lập là C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^9 độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{9a} độc lập là C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_6 haloalkyl;

mỗi R^{10} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

mỗi R^{10a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl;

mỗi R^{11} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl,

C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ hoặc $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{11a} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl;

mỗi R^{12} độc lập là H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkynyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ hoặc $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 alkoxyalkyl, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{13} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$;

mỗi R^{14} độc lập là C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl, C_6-C_{14} xycloalkylxycloalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ và $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; hoặc phenyl, naphthalenyl hoặc vòng dị thơm có từ 5 đến 6

cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi R^{15} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 alkynyl hoặc C_2-C_6 haloalkynyl; hoặc C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_5-C_7 xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, OR^{4a} và $S(O)_mR^{9a}$; hoặc phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_6 alkoxyalkyl, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ và $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

mỗi m độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

n bằng 0, 1, 2, 3 hoặc 4;

với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% khối lượng hạt trước khi xử lý.