



(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)



1-0023856

(51)⁷

C07D 237/14; C07D 401/04; A01N
43/58

(13) **B**

(21) 1-2013-03111

(22) 04/04/2012

(86) PCT/EP2012/056162 04/04/2012

(87) WO2012/136703 11/10/2012

(30) 1106062.1 08/04/2011 GB

(45) 25/05/2020 386

(43) 25/03/2014 312A

(73) SYNGENTA LIMITED (GB)

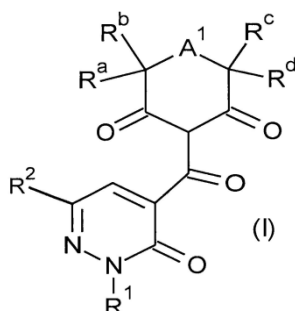
European Regional Centre, Priestley Road, Surrey Research Park, Guildford Surrey
GU2 7YH (GB)

(72) DALLIMORE, Jonathan Wesley Paul (GB)

(74) Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)

(54) HỢP CHẤT DIỆT CỎ, CHẾ PHẨM DIỆT CỎ VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT
CỎ ĐẠI

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất diệt cỏ có công thức (I):



hoặc muối nông dụng của hợp chất nêu trên trong đó R^1 , R^2 , A^1 , R^a , R^b , R^c và R^d như được xác định trong bản mô tả. Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất diệt cỏ này, và phương pháp kiểm soát cỏ dại, cụ thể là ở các cây trồng hữu ích.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

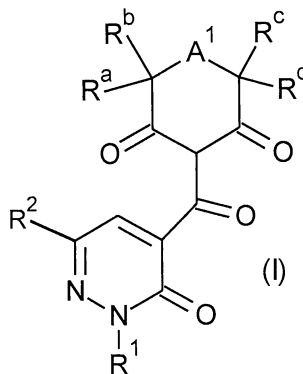
Sáng chế đề cập đến dẫn xuất pyridazinon diệt cỏ, quy trình điều chế chúng, chế phẩm chứa các hợp chất diệt cỏ này, và phương pháp kiểm soát cỏ dại, cụ thể là ở các cây trồng hữu ích, hoặc để ức chế tăng trưởng thực vật.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các dẫn xuất pyridin diệt cỏ được biết đến, ví dụ, từ EP1982978 và các dẫn xuất pyrimidon từ WO2011/031658. Đã phát hiện ra rằng các dẫn xuất pyridazinon biểu hiện tính diệt cỏ ưu việt.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, sáng chế đề xuất hợp chất diệt cỏ có công thức (I):



hoặc muối nông dụng của hợp chất nêu trên, trong đó:

R¹ được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃haloalkyl, C₄-C₆-xycloalkoxy được thế oxa-C₁-C₃-alkyl, C₄-C₆-xycloalkyl được thế oxa-C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃alkyl, C₄-C₆-xycloalkoxy được thế oxa-C₁-C₃haloalkyl, C₄-C₆-xycloalkyl được thế oxa-C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃haloalkyl, (C₁-C₃alkansulfonyl-C₁-C₃alkylamino)-C₁-C₃alkyl, (C₁-C₃alkansulfonyl-C₃-C₄xycloalkylamino)-C₁-C₃alkyl, C₁-C₆alkylcarbonyl-C₁-C₃alkyl, C₃-

C₆xycloalkyl-C₂-C₆alkenyl, C₂-C₆alkynyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, xyano-C₁-C₆-alkyl, arylcabconyl-C₁-C₃-alkyl (trong đó aryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃-alkoxy, C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃ haloalkyl), aryl-C₁-C₆alkyl, aryloxy-C₁-C₆alkyl (trong cả hai trường hợp đó aryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃-alkoxy, C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃ haloalkyl), và hệ một hoặc hai vòng có ba đến mười cạnh, có thể là thơm, bão hòa hoặc bão hòa một phần và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, oxy và lưu huỳnh, hệ vòng này được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₃alkyl, C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃alkenyl, C₁-C₃alkynyl, C₁-C₃ alkoxy, C₁-C₃ haloalkoxy, C₁-C₆alkyl-S(O)p-, C₁-C₆haloalkyl-S(O)p-, aryl, aryl-S(O)p, heteroaryl-S(O)p, aryloxy, heteroaryloxy, C₁-C₃ alkoxycabconyl, C₁-C₃ alkylamino-S(O)p-, C₁-C₃ alkylamino-S(O)p-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₃ dialkylamino-S(O)p-, C₁-C₃ dialkylamino-S(O)p-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₃ alkylaminocabconyl-, C₁-C₃ alkylaminocabconyl-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₃ dialkylaminocabconyl, C₁-C₃ dialkylaminocabconyl-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₃ alkylcabconylamino, C₁-C₃ alkyl-S(O)p-amino, xyano và nitro; các nhóm thế heteroaryl chứa một đến ba nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh, và trong đó thành phần aryl hoặc heteroaryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy, C₁-C₃ haloalkoxy, phenyl, xyano và nitro;

R² được chọn từ nhóm bao gồm hydro, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆alkyl, C₃-C₆xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆alkynyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₃haloalkoxy, C₁-C₆alkoxy-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₆alkyl-S(O)p- và C₁-C₆haloalkyl-S(O)p-;

p = 0, 1 hoặc 2;

A¹ được chọn từ nhóm bao gồm O, C(O) và (CR^eR^f); và

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e và R^f độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro và C₁-C₄alkyl trong đó R^a và R^c có thể cùng nhau tạo thành chuỗi C₁-C₃alkylen.

Mô tả chi tiết sáng chế

Halogen bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Điều này cũng tương ứng áp dụng cho halogen trong bối cảnh của các định nghĩa khác, chẳng hạn như haloalkyl hoặc halophenyl.

Nhóm haloalkyl có độ dài mạch từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, flometyl, diflometyl, triflometyl, clometyl, diclometyl, triclometyl, 2,2,2-trifloetyl, 2-floetyl, 2-cloetyl, pentafoetyl, 1,1-diflo-2,2,2-tricloetyl, 2,2,3,3-tetrafoetyl và 2,2,2-tricloetyl, heptafo-n-propyl và perfo-n-hexyl.

Các gốc alkylenyl thích hợp bao gồm, ví dụ CH_2 , CHCH_3 , $\text{C}(\text{CH}_3)_2$, CH_2CHCH_3 , $\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$.

Các gốc haloalkenyl thích hợp bao gồm các nhóm alkenyl được thế một hoặc nhiều lần bằng halogen, halogen là flo, clo, brom hoặc iot và đặc biệt là flo hoặc clo, ví dụ 2,2-diflo-1-metylvinyl, 3-flopropenyl, 3-clopropenyl, 3-brompropenyl, 2,3,3-triflopropenyl, 2,3,3-triclopropenyl và 4,4,4-triflobut-2-en-1-yl. Các gốc $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl ưu tiên được thế một, hai hoặc ba lần bằng halogen là các gốc có độ dài mạch từ 2 đến 5 nguyên tử cacbon. Các gốc haloalkylalkynyl thích hợp bao gồm, ví dụ, các nhóm alkylalkynyl được thế một hoặc nhiều lần bằng halogen, halogen là brom hoặc iot và, đặc biệt là, flo hoặc clo, ví dụ 3-flopropynyl, 5-clopent-2-yn-1-yl, 5-brompent-2-yn-1-yl, 3,3,3-triflopropynyl và 4,4,4-triflo-but-2-yn-1-yl. Các nhóm alkylalkynyl ưu tiên được thế một hoặc nhiều lần bằng halogen là các nhóm có độ dài mạch từ 3 đến 5 nguyên tử cacbon.

Các nhóm alkoxy tốt hơn là có độ dài mạch từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon. Alkoxy là, ví dụ, metoxy, etoxy, propoxy, isopropoxy, n-butoxy, isobutoxy, sec-butoxy hoặc tert-butoxy hoặc đồng phân pentyloxy hoặc hexyloxy, tốt hơn là metoxy và etoxy. Alkylcacbonyl tốt hơn là axetyl hoặc propionyl. Alkoxycacbonyl là, ví dụ, metoxycacbonyl, etoxycacbonyl, propoxycacbonyl, isopropoxycacbonyl, n-butoxycacbonyl, isobutoxycacbonyl, sec-butoxycacbonyl hoặc tert-butoxycacbonyl, tốt hơn là metoxycacbonyl, etoxycacbonyl hoặc tert-butoxycacbonyl.

Haloalkoxy là, ví dụ, flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxi, 1,1,2,2-tetrafloetoxi, 2-floetoxi, 2-cloetoxi, 2,2-difloetoxi hoặc 2,2,2-tricloetoxi, tốt hơn là diflometoxy, 2-cloetoxi hoặc triflometoxy.

Các nhóm alkylthio tốt hơn là có độ dài mạch từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon.

Alkylthio là, ví dụ, metylthio, etylthio, propylthio, isopropylthio, n-butylthio, isobutylthio, sec-butylthio hoặc tert-butylthio, tốt hơn là metylthio hoặc etylthio. Alkylsulfinyl là, ví dụ, metylsulfinyl, etylsulfinyl, propylsulfinyl, isopropylsulfinyl, n-

butylsulfinyl, isobutylsulfinyl, sec-butylsulfinyl hoặc tert-butylsulfinyl, tốt hơn là metylsulfinyl hoặc etylsulfinyl.

Alkylsulfonyl là, ví dụ, metylsulfonyl, etylsulfonyl, propylsulfonyl, isopropylsulfonyl, n-butylsulfonyl, isobutylsulfonyl, sec-butylsulfonyl hoặc tert-butylsulfonyl, tốt hơn là metylsulfonyl hoặc etylsulfonyl.

Alkylamino là, ví dụ, metylamino, etylamino, n-propylamino, isopropylamino hoặc đồng phân butylamino. Dialkylamino là, ví dụ, dimethylamino, metyletylamino, diethylamino, n-propylmethylamino, dibutylamino hoặc diisopropylamino. Ưu tiên cho các nhóm alkylamino có độ dài mạch từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon.

Xycloalkylamino hoặc dixycloalkylamino là, ví dụ xyclohexylamino hoặc dixyclopropylamino.

Các nhóm alkoxyalkyl tốt hơn là có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon. Alkoxyalkyl là, ví dụ, metoxymetyl, metoxyetyl, etoxymetyl, etoxyetyl, n-propoxymetyl, n-propoxyetyl, isopropoxymetyl hoặc isopropoxyetyl.

Các nhóm alkylthioalkyl tốt hơn là có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon. Alkylthioalkyl là, ví dụ, methylthiometyl, methylthioetyl, ethylthiometyl, ethylthioetyl, n-propylthiometyl, n-propylthioetyl, isopropylthiometyl, isopropylthioetyl, butylthiometyl, butylthioetyl hoặc butylthiobutyl.

Hệ một hoặc hai vòng ba đến mười cạnh, có thể là thơm, bão hòa hoặc bão hòa một phần và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, oxy và lưu huỳnh, hệ vòng này được thể tùy ý bởi một hoặc nhiều nhóm thế được chọn độc lập từ nhóm bao gồm C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, C_1 - C_3 alkenyl, C_1 - C_3 alkynyl, C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_3 haloalkoxy, C_1 - C_6 alkyl-S(O)p-, C_1 - C_6 haloalkyl-S(O)p-, aryl, aryl-S(O)p, heteroaryl-S(O)p, aryloxy, heteroaryloxy, C_1 - C_3 alkoxycarbonyl, C_1 - C_3 alkylamino-S(O)p-, C_1 - C_3 alkylamino-S(O)p- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 dialkylamino-S(O)p-, C_1 - C_3 dialkylamino-S(O)p- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 alkylaminocarbonyl-, C_1 - C_3 alkylaminocarbonyl- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 dialkylaminocarbonyl, C_1 - C_3 dialkylaminocarbonyl- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 alkylcarbonylamino, C_1 - C_3 alkyl-S(O)p-amino, xyano và nitro. Do đó, hệ vòng như vậy bao gồm, ví dụ, xycloalkyl, phenyl, heteroxyclyl và heteroaryl. Các ví dụ về vòng “bão hòa một phần” bao gồm, ví dụ, 1,4 benzodioxin và 1,3 benzodioxol.

Các nhóm xycloalkyl tốt hơn là có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon trong vòng và có thể được thế bằng một hoặc nhiều nhóm metyl; chúng tốt hơn là không được thế, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl.

Aryl bao gồm benzyl, phenyl, chứa phenyl như một phần của nhóm thế như phenoxy, benzyl, benzyloxy, benzoyl, phenylthio, phenylalkyl, phenoxyalkyl hoặc tosyl, có thể dưới dạng được thế một hay nhiều lần, trong trường hợp này, các nhóm thế có thể, khi mong muốn, ở (các) vị trí ortho-, meta- và/hoặc para-.

Heteroxyclyl, ví dụ, bao gồm morpholinyl, tetrahydrofuryl.

Heteroaryl, bao gồm heteroaryl như một phần của nhóm thế như heteroaryloxy, có nghĩa là, ví dụ, heteroaryl năm hoặc sáu cạnh chứa một đến ba nguyên tử khác loại, độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh. Cần hiểu rằng thành phần heteroaryl có thể được thế tùy chọn một hoặc nhiều lần. Thuật ngữ heteroaryl vì vậy bao gồm, ví dụ, furanyl, thiophenyl, thiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, isothiazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrimidinyl và triazolyl.

Các hợp chất có công thức I có thể có các trung tâm bất đối xứng và có thể xuất hiện như một đồng phân đối ảnh đơn lẻ, cặp các đồng phân đối ảnh theo tỷ lệ bất kỳ hoặc, khi xuất hiện nhiều hơn một trung tâm bất đối xứng, có các đồng phân không đối quang theo tất cả các tỷ lệ có thể. Điển hình là, một trong các đồng phân đối ảnh làm tăng hoạt tính sinh học so với các khả năng khác.

Tương tự như vậy, khi có các alken được thế hai lần, chúng có thể có mặt ở dạng E hoặc Z hoặc hỗn hợp của cả hai theo tỷ lệ bất kỳ.

Hơn nữa, các hợp chất có công thức I có thể cân bằng với các dạng hồ biến hydroxyl khác. Cần hiểu rằng tất cả các dạng hồ biến (chất hồ biến đơn lẻ hoặc hỗn hợp của nó), các hỗn hợp triệt quang và các đồng phân đơn lẻ được bao gồm trong phạm vi của sáng chế.

Theo một phương án R^1 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_3 alkoxy C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 alkoxy C_2 - C_3 alkoxy C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 haloalkenyl và C_1 - C_3 alkoxy- C_1 - C_3 haloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên khác R^1 là aryl, tốt hơn là phenyl, hoặc heteroaryl 5 hoặc 6 cạnh chứa một đến ba nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh, và trong đó aryl hoặc heteroaryl có thể được

thể tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm halo, C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_3 haloalkoxy, C_1 - C_6 alkyl-S(O)p-, C_1 - C_6 haloalkyl-S(O)p-, xyano và nitro. Được ưu tiên đặc biệt là trong đó R^1 là aryl được thể tùy chọn, được chọn từ nhóm bao gồm phenyl, phenoxy, phenoxy- C_1 - C_6 alkyl, benzyl, thiophenyl, 1,4 benzodioxinyl, 1,3 benzodioxoleyl và pyridyl, ưu tiên nhất là phenyl hoặc pyridyl được thể tùy chọn.

Theo phương án được ưu tiên khác R^2 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 alkyl (tốt hơn là metyl), halogen (tốt hơn là clo), C_2 - C_6 alkoxy (tốt hơn là metoxy), C_1 - C_6 haloalkyl (tốt hơn là CF_3) và CN. Theo phương án được ưu tiên hơn R^2 là hydro của metyl.

Theo phương án khác A^1 là CR^eR^f và trong đó R^a , R^b , R^c , R^d , R^e và R^f là hydro. Theo phương án khác của sáng chế A^1 là CR^eR^f , trong đó R^b , R^d , R^e và R^f là hydro, R^a và R^c cùng nhau tạo thành chuỗi etylen.

Sáng chế cũng bao gồm các muối nông dụng do các hợp chất có công thức I có thể hình thành với các amin (ví dụ amoniac, dimetylamin và trietylamin), các bazơ kim loại kiềm và kim loại kiềm thổ hoặc các bazơ amoni bậc bốn. Trong số các hydroxit, oxit, alkoxit và hydro cacbonat và cacbonat kim loại kiềm và kim loại kiềm thổ được dùng làm chất tạo muối, quan trọng là các hydroxit, alkoxit, oxit và cacbonat của lithi, natri, kali, magie và canxi, nhưng đặc biệt là của natri, magie và canxi. Muối trimetylsulfoni tương ứng cũng có thể được sử dụng.

Bản thân các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, nhưng chúng thường được bào chế thành các chế phẩm diệt cỏ bằng cách dùng các tá dược điều chế như các chất mang, dung môi và chất hoạt động bề mặt (SFA). Vì vậy, sáng chế còn đề xuất chế phẩm diệt cỏ chứa hợp chất diệt cỏ theo điểm bất kỳ trong số các điểm yêu cầu bảo hộ và tá dược điều chế chấp nhận được cho nông nghiệp. Chế phẩm này có thể ở dạng dịch đặc được pha loãng trước khi sử dụng, mặc dù các chế phẩm sẵn sàng để sử dụng cũng có thể được tạo ra. Sự pha loãng cuối cùng thường được thực hiện bằng nước, nhưng có thể được thực hiện thay cho, hoặc ngoài nước, bằng, ví dụ phân bón dạng lỏng, vi chất dinh dưỡng, cơ thể sinh vật, dầu hoặc dung môi.

Các chế phẩm diệt cỏ thường chứa từ 0,1 đến 99% tính theo khối lượng, đặc biệt là từ 0,1 đến 95% tính theo khối lượng, các hợp chất có công thức I và từ 1 đến 99,9% tính theo khối lượng của tá dược điều chế, tá dược này tốt hơn là chứa từ 0 đến 25% khối lượng của chất hoạt động bề mặt.

Các chế phẩm này có thể được chọn từ một số loại chế phẩm dạng bào chế, nhiều trong số đó được biết đến từ Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999. Chúng bao gồm các bột có thể tạo bụi (DP), bột tan được (SP), hạt tan được trong nước (SG), hạt phân tán được trong nước (WG), bột thấm ướt được (WP), hạt (GR) (giải phóng chậm hoặc nhanh), dịch đặc tan được (SL), chất lỏng trộn lẫn được với dầu (OL), chất lỏng dung tích siêu nhỏ (UL), dịch đặc nhũ hóa được (EC), dịch đặc phân tán được (DC), nhũ tương (cả hai loại dầu trong nước (EW) và nước trong dầu (EO)), vi nhũ tương (ME), dịch đặc huyền phù (SC), sol khí, huyền phù bao nang (CS) và chế phẩm xử lý hạt giống. Loại chế phẩm dạng bào chế được chọn trong trường hợp bất kỳ sẽ phụ thuộc vào mục đích cụ thể dự kiến và các tính chất vật lý, hóa học và sinh học của hợp chất có công thức (I).

Bột có thể tạo bụi (DP) có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất có công thức (I) với một hoặc nhiều chất pha loãng rắn (ví dụ đất sét tự nhiên, cao lanh, pyrophyllit, bentonit, nhôm, montmorillonit, đất nhiều tảo cát, đá phấn, đất diatomit, canxi phosphat, cacbonat canxi và magie, lưu huỳnh, vôi, bột mỳ, bột talc và các chất mang rắn hữu cơ và vô cơ khác) và nghiền cơ học hỗn hợp này thành bột mịn.

Bột tan được (SP) có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất có công thức (I) với một hoặc nhiều muối vô cơ hòa tan trong nước (chẳng hạn như natri bicacbonat, natri cacbonat hoặc magie sulphat) hoặc một hoặc nhiều chất rắn hữu cơ hòa tan trong nước (ví dụ polysacarit) và tùy chọn, một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất phân tán hoặc hỗn hợp các chất nêu trên để cải thiện độ phân tán/tan trong nước. Hỗn hợp này sau đó được nghiền thành bột mịn. Các chế phẩm tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo thành hạt tan được trong nước (SG).

Bột thấm ướt được (WP) có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất có công thức (I) với một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn, một hoặc nhiều chất thấm ướt và, tốt hơn là, một hoặc nhiều chất phân tán và tùy chọn, một hoặc nhiều chất tạo huyền phù để tạo thuận lợi cho sự phân tán trong chất lỏng. Hỗn hợp này sau đó

được nghiền thành bột mịn. Các chế phẩm tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo thành các hạt phân tán được trong nước (WG).

Hạt (GR) có thể được hình thành hoặc bằng cách tạo hạt hỗn hợp của hợp chất có công thức (I) và một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn dạng bột, hoặc từ hạt phối được tạo thành trước bằng cách hấp thụ hợp chất có công thức (I) (hoặc dung dịch của chúng, trong một chất thích hợp) vào một vật liệu hạt xốp (như đá bọt, đất sét atapulgite, đất tẩy màu, đất nhiều tảo cát, đất diatomit hoặc lõi ngô nghiền) hoặc bằng cách hấp phụ hợp chất có công thức (I) (hoặc dung dịch của chúng, trong một chất phù hợp) lên một vật liệu lõi cứng (như cát, silicat, khoáng cacbonat, sulphat hoặc phosphat) và sấy khô nếu cần. Chất thường được sử dụng để hỗ trợ hấp thụ hoặc hấp phụ bao gồm các dung môi (như dung môi dầu mỡ béo và thơm, rượu, ete, xeton và este) và các chất gắn kết (như polyvinyl axetat, rượu polyvinyl, dextrin, đường và dầu thực vật). Một hoặc nhiều chất phụ gia khác cũng có thể được đưa vào hạt (ví dụ chất nhũ hóa, chất thấm ướt hoặc chất phân tán).

Dịch đặc phân tán được (DC) có thể được điều chế bằng cách hòa tan hợp chất có công thức (I) trong nước hoặc dung môi hữu cơ, chẳng hạn như một xeton, rượu hoặc glycol ete. Các dung dịch này có thể chứa chất hoạt động bề mặt (ví dụ để cải thiện pha loãng trong nước hoặc ngăn chặn sự kết tinh trong bình phun).

Dịch đặc nhũ hóa được (EC) hoặc nhũ tương dầu trong nước (EW) có thể được điều chế bằng cách hòa tan hợp chất có công thức (I) trong dung môi hữu cơ (tùy chọn chứa một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất nhũ hóa hoặc hỗn hợp các chất nêu trên). Dung môi hữu cơ thích hợp để sử dụng trong các EC bao gồm hydrocacbon thơm (như các alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen, ví dụ điển hình như SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 và SOLVESSO 200; SOLVESSO là Nhãn hiệu đã đăng ký), các xeton (như cyclohexanon hoặc methylcyclohexanon) và rượu (như rượu benzyl, rượu furfuryl hay butanol), các N-alkylpyrrolidon (như N-methylpyrrolidon hoặc N-octylpyrrolidon), các dimethyl amit của axit béo (như C₈-C₁₀ dimethylamit của axit béo) và các hydrocacbon clo hóa. Sản phẩm EC có thể tự nhũ hóa khi thêm vào nước, tạo ra nhũ tương đủ ổn định để cho phép ứng dụng phun thông qua thiết bị phù hợp.

Điều chế EW bao gồm việc thu được hợp chất có công thức (I) hoặc là dưới dạng chất lỏng (nếu không phải là chất lỏng ở nhiệt độ phòng, có thể được nấu chảy ở nhiệt độ hợp lý, thường là dưới 70°C) hoặc trong dung dịch (bằng cách hòa tan nó

trong một dung môi thích hợp) và sau đó nhũ hóa chất lỏng hoặc dung dịch thu được vào nước chứa một hoặc nhiều SFA, trong điều kiện biến dạng trượt cao, để tạo ra một nhũ tương. Dung môi thích hợp để sử dụng trong EW bao gồm dầu thực vật, các hydrocarbon clo hóa (như clobenzen), các dung môi thơm (như alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen) và các dung môi hữu cơ thích hợp khác có độ tan thấp trong nước.

Vi nhũ tương (ME) có thể được bào chế bằng cách trộn nước với hỗn hợp của một hoặc nhiều dung môi với một hoặc nhiều SFA, để tạo ra một cách tự nhiên chế phẩm dạng bào chế lỏng đẳng hướng ổn định nhiệt động lực học. Hợp chất có công thức (I) có mặt ban đầu hoặc là trong nước hoặc là trong hỗn hợp dung môi/SFA. Các dung môi thích hợp để sử dụng trong ME bao gồm dung môi đã được mô tả ở trên để dùng trong các EC hoặc EW. Một ME có thể là hệ dầu trong nước hoặc nước trong dầu (mà hệ hiện tại có thể được xác định bằng phép đo độ dẫn điện) và có thể phù hợp để pha trộn các chất diệt loài gây hại tan trong nước và tan trong dầu trong cùng một chế phẩm dạng bào chế. ME là phù hợp để pha loãng vào nước, hoặc giữ nguyên như một vi nhũ tương hoặc tạo thành một nhũ tương dầu trong nước thông thường.

Dịch đặc huyền phù (SC) có thể bao gồm huyền phù nước hoặc không nước của các hạt rắn không tan phân tán mịn của hợp chất có công thức (I). Các SC có thể được điều chế bằng việc nghiền bi hoặc hạt hợp chất rắn có công thức (I) trong một môi trường thích hợp, tùy chọn với một hay nhiều chất phân tán, để tạo ra huyền phù hạt mịn của hợp chất. Một hoặc nhiều chất thấm ướt có thể được bao gồm trong chế phẩm và có thể có chất tạo huyền phù nhằm giảm tốc độ lắng đọng các hạt. Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể được nghiền khô và cho vào nước, chứa các chất được mô tả ở trên, để tạo ra sản phẩm cuối cùng mong muốn.

Các chế phẩm dạng bào chế sol khí chứa hợp chất có công thức (I) và chất đẩy thích hợp (ví dụ *n*-butan). Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được hòa tan hoặc phân tán trong môi trường thích hợp (ví dụ nước hoặc chất lỏng có thể trộn với nước, chẳng hạn như *n*-propanol) để tạo ra các chế phẩm dùng trong các bơm phun bằng tay, không áp lực.

Huyền phù bao nang (CS) có thể được bào chế một cách tương tự như quy trình bào chế các chế phẩm dạng bào chế EW nhưng có giai đoạn trùng hợp thêm nhằm thu được sự phân tán trong nước của các giọt dầu, trong đó mỗi giọt dầu được bao bởi một lớp vỏ polyme và chứa hợp chất có công thức (I) và, tùy chọn, chất mang hoặc chất

pha loãng cho nó. Vỏ polyme có thể được tạo ra hoặc bởi phản ứng đa trùng ngưng tiếp giáp hoặc bởi quá trình giọt tụ. Các chế phẩm này có thể tạo ra giải phóng có kiểm soát hợp chất có công thức (I) và có thể được sử dụng để xử lý hạt giống. Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được bào chế trong nền polyme phân hủy sinh học để tạo ra giải phóng chậm, có kiểm soát của hợp chất.

Chế phẩm này có thể bao gồm một hoặc nhiều chất phụ gia để cải thiện tính năng sinh học của chế phẩm, ví dụ cải thiện tính thấm ướt, giữ lại hoặc phân phối trên bề mặt; kháng mưa trên bề mặt được xử lý; hoặc sự hấp thu hoặc tính linh động của hợp chất có công thức (I). Các chất phụ gia như vậy bao gồm các chất hoạt động bề mặt (các SFA), phụ gia phun trên cơ sở dầu, ví dụ một số dầu khoáng hoặc dầu thực vật tự nhiên (như dầu đậu tương và dầu hạt cải), và hỗn hợp của các chất này với các tá dược nâng cao về mặt sinh học khác (những thành phần có thể hỗ trợ hoặc thay đổi tác động của hợp chất có công thức (I)).

Chất thấm ướt, chất phân tán và chất nhũ hóa có thể là các SFA thuộc loại cation, anion, lưỡng tính hoặc không ion.

Các SFA loại cation thích hợp bao gồm các hợp chất amoni bậc bốn (ví dụ xetyltrimetyl amoni bromua), các imidazolin và các muối amin.

Các SFA loại anion thích hợp bao gồm muối kim loại kiềm của axit béo, muối của các monoeste béo của axit sulfuric (ví dụ natri lauryl sulphat), muối của các hợp chất thơm sulfonat hóa (ví dụ natri dodexylbenzensulphonat, canxi dodexylbenzensulphonat, butylnaphtalen sulphonat và hỗn hợp của natri di-*isopropyl*- và tri-*isopropyl*-naphtalen sulphonat), sulphat ete, sulphat ete rượu (ví dụ natri laureth-3-sulphat), carboxylat ete (ví dụ natri laureth-3-carboxylat), phosphat este (sản phẩm từ phản ứng giữa một hoặc nhiều rượu béo và axit phosphoric (các mono-este trội hơn) hoặc phospho pentoxit (các di-este trội hơn), ví dụ phản ứng giữa rượu lauryl và axit tetraphosphoric, ngoài ra các sản phẩm này có thể được etoxylat hóa), các sulphasuxinamat, parafin hoặc olefin sulfonat, taurat và lignosulphonat.

Các SFA loại lưỡng tính thích hợp bao gồm các betain, propionat và glyxinat.

Các SFA loại không ion thích hợp bao gồm các sản phẩm ngưng tụ của các alkylen oxit, như etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc các hỗn hợp của chúng, với các rượu béo (như rượu oleyl hoặc rượu xetyl) hoặc với các alkylphenol (như

octylphenol, nonylphenol hoặc octylcresol); các este một phần dẫn xuất từ các axit béo mạch dài hoặc các hexitol anhydrit; các sản phẩm ngưng tụ của các este một phần nêu trên với etylen oxit; các polyme khối (bao gồm etylen oxit và propylen oxit); các alkanolamit; các este đơn giản (ví dụ các este polyetylen glycol của axit béo); các amin oxit (ví dụ lauryl dimetyl amin oxit); và các lecithin.

Các chất tạo huyền phù thích hợp bao gồm các keo ưa nước (như các polysacarit, polyvinylpyrrolidon hoặc natri carboxymetylxenluloza) và các sét trương (như bentonit hoặc atapulgít).

Các chế phẩm đang nói đến có thể chứa thêm ít nhất một loại chất diệt loài gây hại thêm vào. Ví dụ, các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng kết hợp với chất diệt cỏ hoặc chất điều chỉnh tăng trưởng thực vật khác. Theo một phương án được ưu tiên chất diệt loài gây hại thêm vào là chất diệt cỏ và/hoặc chất an toàn diệt cỏ. Ví dụ của các hỗn hợp đó là (trong đó 'I' đại diện cho hợp chất có công thức I). I + axetoclo, I + axiflofen, I + axiflofen-natri, I + aclonifen, I + acrolein, I + alaclo, I + alloxymid, I + ametryn, I + amicarbazone, I + amidosulfuron, I + aminopyralit, I + amitrol, I + anilofos, I + asulam, I + atrazin, I + azafenidin, I + azimsulfuron, I + BCPC, I + beflubutamid, I + benazolin, I + bencarbazone, I + benfluralin, I + benfuresat, I + bensulfuron, I + bensulfuron-metyl, I + bensulit, I + bentazon, I + benzofendizon, I + benzobixyclon, I + benzofenap, I + bixyclopyron, I + bifenox, I + bilanafos, I + bispyribac, I + bispyribac-natri, I + borax, I + bromacil, I + brombutit, I + bromxynil, I + butaclo, I + butamifos, I + butralin, I + butroxydim, I + butylat, I + cacodylic axit, I + canxi clorat, I + cafenstrol, I + carbetamid, I + carfentrazone, I + carfentrazone-etyl, I + cloflurenol, I + cloflurenol-metyl, I + cloidazon, I + cloimuron, I + cloimuron-etyl, I + axit cloaxetic, I + clotoluron, I + clopropham, I + closulfuron, I + clothal, I + clothal-dimetyl, I + xinidon-etyl, I + xinmetylin, I + xinosulfuron, I + xisanilit, I + clethodim, I + clodinafop, I + clodinafop-propargyl, I + clomazon, I + clomeprop, I + clopyralit, I + cloransulam, I + cloransulam-metyl, I + xyanazin, I + xycloat, I + xyclosulfamuron, I + xycloxydim, I + xyhalofop, I + xyhalofop-butyl, I + 2,4-D, I + daimuron, I + dalapon, I + dazomet, I + 2,4-DB, I + I + desmedipham, I + dicamba, I + diclobenil, I + dicloprop, I + dicloprop-P, I + diclofop, I + diclofop-metyl, I + diclosulam, I + difenzoquat, I + difenzoquat metilsulfat, I + diflufenican, I + diflufenzopyr, I + dimefuron, I + dimepiperat, I + dimethaclo, I + dimethametryn, I + dimethenamid, I +

dimethenamit-P, I + dimethipin, I + dimetylarsinic axit, I + dinitramin, I + dinoterb, I + diphenamit, I + dipropetryn, I + diquat, I + diquat dibromit, I + dithiopyr, I + diuron, I + endothal, I + EPTC, I + esprocarb, I + etalfluralin, I + etametsulfuron, I + etametsulfuron-metyl, I + etephon, I + etofumesat, I + etoxyfen, I + etoxysulfuron, I + etobenzanit, I + fenoxaprop-P, I + fenoxaprop-P-etyl, I + fentrazamit, I + sáť (II) sulfat, I + flamprop-M, I + flazasulfuron, I + florasulam, I + fluazifop, I + fluazifop-butyl, I + fluazifop-P, I + fluazifop-P-butyl, I + fluazolat, I + flucarbazon, I + flucarbazon-natri, I + fluxetosulfuron, I + flucloalin, I + flufenaxet, I + flufenpyr, I + flufenpyr-etyl, I + flumetralin, I + flumetsulam, I + flumiclorac, I + flumiclorac-pentyl, I + flumioxazin, I + flumipropin, I + fluometuron, I + floglycofen, I + floglycofen-etyl, I + fluoxaprop, I + flupoxam, I + flupropacil, I + flupropanat, I + flupyrsulfuron, I + flupyrsulfuron-metyl-natri, I + flurenol, I + fluridon, I + flurocloidon, I + fluroxypyr, I + flurtamon, I + fluthiaxet, I + fluthiaxet-metyl, I + fomesafen, I + foramsulfuron, I + fosamin, I + glufosinat, I + glufosinat-amoni, I + glyphosat, I + halosulfuron, I + halosulfuron-metyl, I + haloxyfop, I + haloxyfop-P, I + hexazinon, I + imazametabenz, I + imazametabenz-metyl, I + imazamox, I + imazapic, I + imazapyr, I + imazaquin, I + imazetapyr, I + imazosulfuron, I + indanofan, I + indaziflam, I + iodometan, I + iodosulfuron, I + iodosulfuron-metyl-natri, I + ioxynil, I + isoproturon, I + isouron, I + isoxaben, I + isoxaclotol, I + isoxaflutol, I + isoxapyrifop, I + karbutilat, I + lactofen, I + lenaxil, I + linuron, I + mecoprop, I + mecoprop-P, I + mefenaxet, I + mefluidit, I + mesosulfuron, I + mesosulfuron-metyl, I + mesotrion, I + metam, I + metamifop, I + metamitron, I + metazaclo, I + metabenzthiazuron, I + metazol, I + metylarsonic axit, I + metyldymron, I + metyl isothioxyanat, I + metolaclo, I + S-metolaclo, I + metosulam, I + metoxuron, I + metribuzin, I + metsulfuron, I + metsulfuron-metyl, I + molinat, I + monolinuron, I + naproanilit, I + napropamit, I + naptalam, I + neburon, I + nicosulfuron, I + n-metyl glyphosat, I + nonanoic axit, I + norflurazon, I + oleic axit (cák axit béo), I + orbencarb, I + orthosulfamuron, I + oryzalin, I + oxadiargyl, I + oxadiazon, I + oxasulfuron, I + oxaziclomefon, I + oxyfluorfen, I + paraquat, I + paraquat diclorua, I + pebulat, I + pendimetalin, I + penoxsulam, I + pentaclophenol, I + pentanoclo, I + pentoxazon, I + petoxamit, I + phenmedipham, I + picloram, I + picolinafen, I + pinoxaden, I + piperophos, I + pretilaclo, I + primisulfuron, I + primisulfuron-metyl, I + prodiamin, I + profoxydim, I + prohexadion-canxi, I +

prometon, I + prometryn, I + propaclo, I + propanil, I + propaquizafop, I + propazin, I + propham, I + propisoclo, I + propoxycarbazon, I + propoxycarbazon-natri, I + propyzamit, I + prosulfocarb, I + prosulfuron, I + pyraclonil, I + pyraflufen, I + pyraflufen-ethyl, I + pyrasulfotol, I + pyrazolynat, I + pyrazosulfuron, I + pyrazosulfuron-ethyl, I + pyrazoxyfen, I + pyribenzoxim, I + pyributicarb, I + pyridafol, I + pyridat, I + pyriftalid, I + pyriminobac, I + pyriminobac-metyl, I + pyrimisulfan, I + pyriothiobac, I + pyriothiobac-natri, I + pyroxasulfon, I + pyroxsulam, I + quinclorac, I + quinmerac, I + quinoclamín, I + quizalofop, I + quizalofop-P, I + rimsulfuron, I + saflufenacil, I + setoxydim, I + siduron, I + simazin, I + simetryn, I + natri clorat, I + sulcotrion, I + sulfentrazon, I + sulfometuron, I + sulfometuron-metyl, I + sulfosat, I + sulfosulfuron, I + sulfuric axit, I + tebuthiuron, I + tefuryltrion, I + tembotrion, I + tepraloxym, I + terbaxil, I + terbumeton, I + terbuthylazin, I + terbutryn, I + thenylclo, I + thiazopyr, I + thifensulfuron, I + thiencarbazon, I + thifensulfuron-metyl, I + thiobencarb, I + topramezon, I + tralkoxydim, I + tri-alat, I + triasulfuron, I + triaziflam, I + tribenuron, I + tribenuron-metyl, I + triclopyr, I + trietazin, I + trifloxysulfuron, I + trifloxysulfuron-natri, I + trifluralin, I + triflusulfuron, I + triflusulfuron-metyl, I + trihydroxytriazin, I + trinexapac-ethyl, I + tritosulfuron, I + etyl este của axit [3-[2-clo-4-flo-5-(1-metyl-6-triflometyl-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-3-yl)phenoxy]-2-pyridyloxy]axetic (CAS RN 353292-31-6). Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được kết hợp với các hợp chất diệt cỏ được bộc lộ trong WO06/024820 và/ hoặc WO07/096576.

Các đối tác pha trộn của hợp chất có công thức I cũng có thể ở dạng este hoặc muối, như đã đề cập, ví dụ trong The Pesticide Manual, Fourteenth Edition, British Crop Protection Council, 2006.

Hợp chất có công thức I cũng có thể được sử dụng trong hỗn hợp với các hóa chất nông nghiệp khác như chất diệt nấm, diệt giun tròn hoặc diệt loài gây hại, các ví dụ về các chất này được đưa ra trong The Pesticide Manual.

Tỷ lệ pha trộn của hợp chất có công thức I với đối tác pha trộn tốt hơn là từ 1:100 đến 1000:1.

Các hỗn hợp có thể được sử dụng thuận lợi trong các chế phẩm dạng bào chế nêu trên (trong đó "thành phần hoạt tính" để chỉ hỗn hợp tương ứng của hợp chất có công thức I với đối tác pha trộn).

Các hợp chất có công thức I theo sáng chế cũng có thể được sử dụng kết hợp với một hoặc nhiều chất an toàn. Tương tự như vậy, hỗn hợp của hợp chất có công thức I theo sáng chế với một hoặc nhiều chất diệt cỏ khác cũng có thể được sử dụng kết hợp với một hoặc nhiều chất an toàn. Các chất an toàn có thể là AD 67 (MON 4660), benoxacor, cloquintoxet-mexyl, xyprosulfamid (CAS RN 221667-31-8), diclomit, fencloazole-etyl, fenclorim, fluxofenim, furilazol và đồng phân R tương ứng, isoxadifen-etyl, mefenpyr-dietyl, oxabetrinil, N-isopropyl-4-(2-metoxycarbonylsulfamoyl)-benzamid (CAS RN 221668-34-4). Các chất có thể khác bao gồm các hợp chất an toàn được bộc lộ trong, ví dụ, EP0365484 như N-(2-metoxycarbonyl)-4-[(methylaminocarbonyl)amino]benzenesulfonamid. Được ưu tiên đặc biệt là các hỗn hợp của hợp chất có công thức I với xyprosulfamid, isoxadifen-etyl, cloquintoxet-mexyl và/hoặc N-(2-metoxycarbonyl)-4-[(methylaminocarbonyl)amino]benzenesulfonamid. Các chất an toàn này thể hiện kết quả đặc biệt tốt trong ngô và/hoặc các loại ngũ cốc như lúa mì và lúa mạch khi các tỷ lệ cao hơn (ví dụ >50g/ha) của hợp chất có công thức (I) được sử dụng.

Các chất an toàn của hợp chất có công thức I cũng có thể ở dạng este hoặc muối, như được đề cập, ví dụ trong The Pesticide Manual, 14th Edition (BCPC), 2006. Tài liệu tham khảo cho cloquintocet-mexyl cũng áp dụng cho muối lithi, natri, kali, canxi, magie, nhôm, sắt, amoni, amoni bậc bốn, sulfoni hoặc phospho của nó như được bộc lộ trong WO 02/34048, và các tài liệu tham khảo cho fencloazole-etyl cũng áp dụng cho fencloazole, vv.

Tốt hơn là tỷ lệ pha trộn của hợp chất có công thức I với chất an toàn là từ 100:1 đến 1:10, đặc biệt là từ 20:1 đến 1:1.

Các hỗn hợp này có thể được sử dụng thuận lợi trong các chế phẩm dạng bào chế nêu trên (trong đó "thành phần hoạt tính" để chỉ hỗn hợp tương ứng của hợp chất có công thức I với chất an toàn).

Sáng chế còn đề xuất phương pháp kiểm soát cỏ dại tại địa điểm có các loại cây trồng và cỏ dại, trong đó phương pháp này bao gồm việc áp dụng cho địa điểm này lượng có thể kiểm soát cỏ dại của chế phẩm theo sáng chế. 'Kiểm soát' có nghĩa là giết chết, làm giảm hoặc làm chậm tăng trưởng hoặc ngăn ngừa hoặc giảm nảy mầm. Nói chung các cây được kiểm soát là các cây không mong muốn (cỏ dại). 'Địa điểm' có nghĩa là khu vực mà trong đó các cây đang mọc lên hoặc sẽ mọc lên.

Tỷ lệ sử dụng các hợp chất có công thức I có thể thay đổi trong giới hạn rộng và phụ thuộc vào bản chất của đất, phương pháp sử dụng (trước hoặc sau khi nảy mầm; xử lý hạt giống; sử dụng cho các rãnh gieo hạt; áp dụng cho đất không canh tác, vv), cây trồng, (các) cỏ dại được kiểm soát, điều kiện khí hậu hiện tại, và các yếu tố khác, chi phối bởi phương pháp sử dụng, thời gian sử dụng và cây trồng nhắm đến. Các hợp chất có công thức I theo sáng chế thường được sử dụng ở tỷ lệ từ 10 đến 2000 g/ha, đặc biệt là từ 50 đến 1000 g/ha.

Việc sử dụng này thường được thực hiện bằng cách phun chế phẩm, điển hình là bằng máy kéo gắn bình phun cho khu vực rộng, nhưng các phương pháp khác như tạo bụi (cho bột), nhỏ giọt hoặc ngâm cũng có thể được sử dụng.

Các thực vật hữu ích trong đó chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng bao gồm các loại cây trồng như ngũ cốc, ví dụ lúa mạch và lúa mì, bông, cải dầu, hướng dương, ngô, gạo, đậu tương, củ cải đường, mía và cỏ. Ngô được đặc biệt ưu tiên.

Cây trồng cũng có thể bao gồm các cây, chẳng hạn như cây ăn quả, cây cọ, cây dừa hoặc các cây quả hạch khác. Ngoài ra, cây trồng cũng bao gồm các cây leo như nho, bụi cây ăn quả, cây ăn quả và rau.

Cây trồng cần được hiểu là cũng bao gồm cả những loại cây trồng đã được truyền khả năng dung nạp được chất diệt cỏ hoặc các loại chất diệt cỏ (ví dụ các chất ức chế ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCase- và HPPD-) bằng các phương pháp gây giống hoặc kỹ thuật di truyền thông thường. Ví dụ về cây trồng đã được truyền khả năng dung nạp được các imidazolinon, như imazamox, bằng các phương pháp gây giống thông thường là cải dầu mùa hè Clearfield® (cải hạt dầu). Ví dụ về các loại cây trồng đã được truyền khả năng dung nạp được chất diệt cỏ bằng các phương pháp kỹ thuật di truyền bao gồm, ví dụ các giống ngô chịu glyphosat và glufosinat có trên thị trường dưới tên thương mại RoundupReady® và LibertyLink®.

Theo phương án được ưu tiên, cây trồng được truyền khả năng dung nạp được các chất ức chế HPPD thông qua kỹ thuật di truyền. Phương pháp truyền cho cây trồng khả năng dung nạp được các chất ức chế HPPD đã được biết, ví dụ từ WO0246387. Vì vậy, theo một phương án còn được ưu tiên hơn nữa, cây trồng chuyển gen liên quan đến polynucleotit chứa trình tự ADN mã hóa enzym HPPD kháng chất ức chế HPPD có nguồn gốc từ vi khuẩn, cụ thể hơn là từ *Pseudomonas fluorescens* hoặc *Shewanella colwelliana*, hoặc từ thực vật, cụ thể hơn là có nguồn gốc từ thực vật một lá mầm, cụ

thể hơn nữa là từ lúa mạch, ngô, lúa mì, gạo, các loài *Brachiaria*, *Chenchrus*, *Lolium*, *Festuca*, *Setaria*, *Eleusine*, *Sorghum* hoặc *Avena*.

Cây trồng cũng được hiểu là những cây đã được truyền khả năng chống sâu bệnh bằng các phương pháp kỹ thuật di truyền, ví dụ ngô Bt (kháng sâu đục thân ngô châu Âu), bông Bt (chống một tia hột bông) và củ khoai tây Bt (chống bọ cánh cứng Colorado). Ví dụ về ngô Bt là ngô lai Bt 176 của NK® (Syngenta Seeds). Độc tố Bt là protein được hình thành một cách tự nhiên bởi vi khuẩn đất *Bacillus thuringiensis*. Ví dụ về các độc tố, hoặc các thực vật chuyển gen có khả năng tổng hợp các độc tố như vậy, được mô tả trong EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 và EP-A-427 529. Ví dụ về các thực vật chuyển gen chứa một hoặc nhiều gen mã hóa tính kháng côn trùng và biểu hiện một hoặc nhiều độc tố là KnockOut® (ngô), Yield Gard® (ngô), NuCOTIN33B® (bông), Bollgard® (bông), NewLeaf® (khoai tây), NatureGard® và Protexcta®. Các cây trồng hoặc nguyên liệu hạt của nó có thể có cả hai tính kháng chất diệt cỏ và, đồng thời, kháng côn trùng ăn hại (các sự kiện chuyển gen “chồng”). Ví dụ, hạt giống có thể có khả năng biểu hiện protein Cry3 diệt côn trùng trong khi đồng thời dung nạp được glyphosat.

Cây trồng cũng được hiểu là bao gồm những cây thu được bằng phương pháp gây giống thông thường hoặc kỹ thuật di truyền và có cái gọi là tính trạng đầu ra (ví dụ cải thiện sự ổn định lưu trữ, giá trị dinh dưỡng cao hơn và cải thiện hương vị).

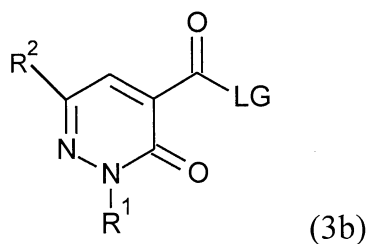
Thực vật hữu ích khác bao gồm cỏ thảm, ví dụ trong sân golf, thảm cỏ, công viên, lề đường, hoặc mảng cỏ trồng cho mục đích thương mại và cây cảnh như cây hoa hay cây bụi.

Các chế phẩm này có thể được sử dụng để kiểm soát các loại cây không mong muốn (gọi chung là “cỏ dại”). Cỏ dại được kiểm soát có thể là cả hai loài một lá mầm, ví dụ *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* và *Sorghum*, và loài hai lá mầm, ví dụ *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* và *Xanthium*. Cỏ dại cũng có thể bao gồm các cây có thể được coi là cây trồng nhưng phát triển bên ngoài diện tích trồng (‘phát tán’), hoặc phát triển từ hạt giống còn sót lại từ vụ trồng trước của loại cây trồng khác (‘mọc

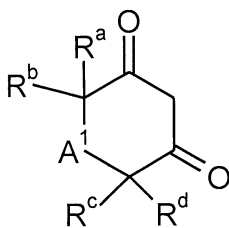
tự nhiên'). Các cây mọc tự nhiên hoặc phát tán này có thể dung nạp được một số chất diệt cỏ khác.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế bằng cách sử dụng phương pháp sau đây.

Quy trình điều chế các hợp chất theo sáng chế được phác họa trong sơ đồ sau. Quy trình điều chế các hợp chất có công thức (I) được tiến hành tương tự với các quy trình đã biết (ví dụ các quy trình được mô tả trong WO97/46530, EP0353187 và US 6,498,125) và bao gồm việc cho hợp chất có công thức sau:



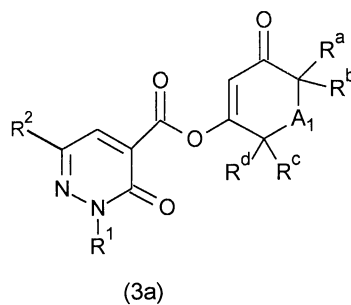
trong đó các định nghĩa về R^1 và R^2 là như đối với công thức (I) và LG là nhóm rời chuyển phù hợp, ví dụ nguyên tử halogen, chẳng hạn như clo, hoặc nhóm alkoxy hoặc aryloxy, chẳng hạn như 4-nitrophenoxy, trong dung môi hữu cơ trơ, chẳng hạn như diclometan hoặc axetonitril, trong sự có mặt của bazơ, chẳng hạn như triethylamin, phản ứng với các hợp chất



trong đó

A^1 và R^a , R^b , R^c , R^d là như được định nghĩa ở trên;

để thu được các este (3a) sau :



mà chúng có thể được sắp xếp lại bằng cách sử dụng các chất xúc tác, chẳng hạn như 4- dimethylaminopyridin, hoặc axeton xyanohydrin, hoặc muối xyanua kim loại, chẳng hạn như natri xyanua, trong sự có mặt của một bazơ thích hợp, chẳng hạn như triethylamin, để thu được các hợp chất có công thức (I), như thể hiện trong Sơ đồ 1. Thuận lợi là có một tác nhân loại nước, chẳng hạn như rây phân tử, có mặt trong môi trường phản ứng để đảm bảo nước bất kỳ có mặt ban đầu trong dung môi hoặc kết hợp với các thành phần khác của hỗn hợp phản ứng bị ngăn cản không cho gây ra thủy phân không mong muốn của các hợp chất trung gian.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế không hạn chế sau đây được đề cập. Chữ viết tắt được sử dụng trong các ví dụ sau đây là như sau: s = đơn, d = cặp đôi, t = cặp ba, m = đa, bs = tín hiệu rộng, bm = đa rộng, dd = cặp đôi kép, dt = cặp ba kép, td = cặp đôi kép ba và dq = cặp bốn kép.

Ví dụ 1. Điều chế 2-(3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydropyridazin-4-carbonyl)-xyclohexan-1,3-dion (Hợp chất 1.1)

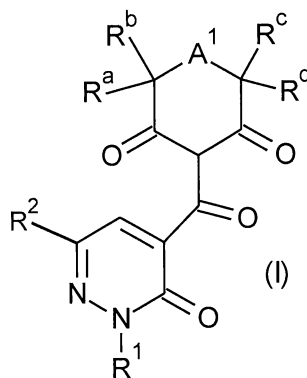
Axit 3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydropyridazin-4-carboxylic (0,52 g, 2,42mmol) được khuấy trong diclorometan khan (13mL) và thêm 1 giọt dimetylformamit khan. Oxalyl clorua (0,25mL, 2,90mmol) được thêm từng giọt vào huyền phù để cho dung dịch màu nâu. Sau 1,5 giờ phản ứng được cô trong chân không. Hòa tan cặn thu được trong diclometan (20mL). Thêm vào dung dịch màu nâu triethylamin khan (1mL), sau đó là xyclohexandion (0,33g, 2,90mmol), tạo ra dung dịch màu đỏ hung. Thêm tiếp 0,33mL triethylamin khan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 2 giờ (phản ứng được giám sát bởi LCMS), sau đó thêm axeton xyanohydrin (1 giọt) và triethylamin khan (0,67mL) và hỗn hợp phản ứng được khuấy qua đêm. LCMS cho thấy sản phẩm mong muốn đã được tạo thành. Hỗn hợp phản ứng được cô trong chân

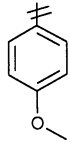
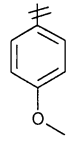
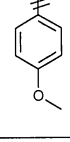
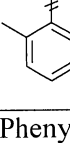
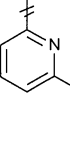
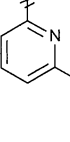
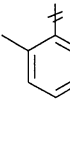
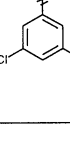
không. Cặn thu được được tinh chế bằng sắc ký cột (SiO_2 , Toluene/Triethylamin/Dioxan/EtOH/Nước 100:40:20:20:5 theo thể tích), và sau đó được tinh chế thêm bằng sắc ký cột (SiO_2 , hexan/etyl axetat/ axit axetic 2:1:0,02 đến 0:100:2) thu được hợp chất theo tiêu đề là dầu màu da cam (25mg, hiệu suất 3%). ^1H NMR (CDCl_3) 2,04 (m, 2H), 2,61 (br s, 4H), 7,18 (d, 1H) 7,46 (m, 2 H), 7,59 (m, 3 H) 7,96 (d, 1H) ppm.

Ví dụ 2. Điều chế 2-(6-metyl-3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydropyridazin-4-cacbonyl)-xyclohexan-1,3-dion (Hợp chất 1.2).

Axit 6-metyl-3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydropyridazin-4-carboxylic (0,56g, 2,42mmol) được khuấy trong diclorometan khan (13mL) và 1 giọt dimetylformamit được thêm vào. Oxalyl clorua (0,25mL, 2,90mmol) được thêm từng giọt vào dung dịch màu vàng. Sau 1,5 giờ phản ứng được cô trong chân không. Cặn thu được được hòa tan trong diclometan (20mL). Thêm vào dung dịch màu nâu triethylamin khan (1mL), sau đó là xyclohexandion (0,33g, 2,90mmol), tạo ra dung dịch màu đỏ hung. Thêm tiếp 0,33mL triethylamin khan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 2 giờ (phản ứng được giám sát bằng LCMS), sau đó thêm axeton xyanohydrin (1 giọt) và triethylamin khan (0,67mL) và phản ứng được khuấy qua đêm. LCMS cho thấy sản phẩm mong muốn đã được tạo thành. Hỗn hợp phản ứng được cô trong chân không. Cặn thu được được tinh chế bằng cách dùng sắc ký cột (SiO_2 , Toluene/Triethylamin/Dioxan/EtOH/Nước 100:40:20:20:5 theo thể tích) thu được hợp chất theo tiêu đề là dầu màu da cam (382mg, 49%). ^1H NMR (CDCl_3) 2,05 (quin, 2H), 2,41 (m, 3H), 2,47 (br s, 2H), 2,73 (br s, 2H), 7,10 (s, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,57 (m, 2H), 16,15 (br s, 1H) ppm.

Bảng 1 – Ví dụ về các hợp chất diệt cỏ theo sáng chế.



Hợp chất	A ¹	R ^a	R ^c	R ^b	R ^d	R ¹	R ²	NMR ¹ H NMR (CDCl ₃)
1.1	CH ₂	H	H	H	H	Phenyl	H	2,04 (m, 2H), 2,61 (br s, 4H), 7,18 (d, 1H) 7,46 (m, 2 H), 7,59 (m, 3 H) 7,96 (d, 1H) ppm.
1.2	CH ₂	H	H	H	H	Phenyl	CH ₃	2,05 (quin, 2H), 2,41 (m, 3H), 2,47 (bs, 2H), 2,73 (br s, 2H), 7,10 (s, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,57 (m, 2H), 16,15 (br s, 1H) ppm.
1.3	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7,45-7,48(2H,d), 7,03(1H,s), 6,93-6,95(2H,d), 3,82(3H,s), 2,47-2,56(4H,m), 2,38(3H,s), 1,94-2,13 (2H,m)
1.4	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	16,17(1H,s), 7,47-7,50(2H,m), 7,07(1H,s), 6,94-6,96(2H,d), 3,83(3H,s), 3,08-3,10(1H,br t), 2,92-2,95(1H,br t), 2,39(3H,s), 2,17-2,24(6H,m)
1.5	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	16,08 (1H,s), 7,47-7,49 (2H,d), 7,10(1H,s), 6,94-6,96 (2H,d), 3,83 (3H,s), 2,72-2,78 (1H,br m), 2,44-2,58 (2H,bm), 2,40 (3H,s), 2,13-2,37(2H,br m), 1,09-1,11(3H,d)
1.6	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	UPLCMS, 5 min, t = 2,34 min, m/z = 353 [M+H] ⁺
1.7	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H	Phenyl	CH ₃	7,39-7,55 (5H, m), 7,29-7,31 (1H, s), 2,93-3,05 (2H, br s), 2,38-2,42 (3H, s), 2,16-2,23 (3H, m), 1,80-1,90 (2H, br m), 1,74-1,80 (1H, m)
1.8	C=O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Phenyl	CH ₃	7,39-7,53 (6H, m), 2,42-2,44 (3H, s), 1,38-1,45 (12H, s),
1.9	CHCH ₃	H	H	H	H	Phenyl	CH ₃	7,38-7,55 (5H, m), 7,29-7,32 (1H, s), 2,25-2,68 (8H, br m), 1,07-1,12 (3H, d)
1.10	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7,88 (1H, t), 7,61 (1H, d), 7,32 (1H, d), 7,13 (1H, s), 3,04 (2H, br s), 2,69 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,23 (1H, d), 2,16 (2H, br s), 1,90 (2H, bs), 1,73 (1H, dt).
1.11	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7,95 (1H, t), 7,70 (1H, d), 7,37 (1H, d), 7,14 (1H, s), 2,73 (3H, s), 2,68 - 2,57 (4H, m), 2,43 (3H, s), 2,06 (2H, cặp năm).
1.12	C=O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		CH ₃	16,47 (1H, s), 7,20-7,35 (5H, m), 2,43 (3H, s), 2,21 (3H, s), 1,52 (3H, s), 1,37 (3H, s),
1.13	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7,54 (2H,s), 7,38 (1H,s), 7,25 (1H,s), 3,06-3,14 (2H br,m), 2,23 (3H,s), 2,11-2,24 (4H,m), 1,98 (1H,m), 1,85 (1H,m)

Hợp chất	A ¹	R ^a	R ^c	R ^b	R ^d	R ¹	R ²	NMR ¹ H NMR (CDCl ₃)
1.14	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	16,02 (1H,s), 7,25-7,32 (4H,m), 7,13(1H,s), 3,08 (1H br,t), 2,82(1H br,t), 2,4(3H,s), 2,21(3H,s), 1,97-2,18 (6H,m)
1.15	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7,7(1H,s), 7,67(2H,s), 7,38(1H,s), 2,87 (1H,m), 2,58 (4H,m), 2,21(3H,s), 2,09-2,18 (2H,m)
1.16	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	16,02 (1H,s), 7,25-7,32 (4H,m), 7,17(1H,s), 2,71(2H,m), 2,45 (2H,m), 2,41 (3H,s), 2,21 (3H,s), 1,98-2,06 (2H,m)
1.17	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	16,0 (s, 1H), 7,6 (m, 2H), 7,3 (m, 1H), 7,0 (s, 1H), 2,8 (m, 1H), 2,6 (m, 2H), 2,1 (m, 1H), 1,1 (d, 3H)
1.18	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	7,3 (2H, m), 7,0 (3H, m), 3,8 (3H, s), 2,5 (2H, m), 2,4 (1H, m), 2,3 (3H, s), 2,1 (2H, m), 1,2 (3H, d)
1.19	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7,4 (1H, s), 7,1 (2H, s), 7,38 (2H, s), 3,8 (3H, s), 3,0 (2H, m), 2,4 (3H, s), 2,21(2H, s), 2,07-2,15 (2H, m)
1.20	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7,4 (1H, s), 7,1 (2H, s), 7,38 (2H, s), 5,5 (1H, s), 3,8 (3H, s), 3,0 (2H, m), 2,0 (3H, m), 2,21 (6H, s), 2,07-2,15 (3H, m)

Các ví dụ sinh học

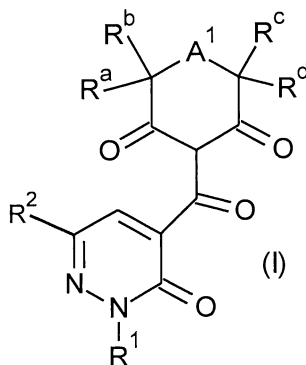
Hạt giống của một loạt các loài thử nghiệm được gieo vào đất tiêu chuẩn trong chậu (*Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Abutilon theophrasti* (ABUTH) và *Amaranthus retroflexus* (AMARE)). Sau khi trồng một ngày (trước khi nảy mầm) hoặc sau khi trồng 8 ngày (sau khi nảy mầm) trong các điều kiện được kiểm soát trong nhà kính (ở 24/16°C, ngày/đêm; chiếu sáng 14 giờ, độ ẩm 65%), các cây được phun dung dịch phun nước thu được từ chế phẩm dạng bào chế chứa hoạt chất kỹ thuật trong dung dịch axeton/nước (50:50) chứa 0,5% Tween 20 (polyoxyetelen sorbitan monolaurat, CAS RN 9005-64-5). Các hợp chất được sử dụng ở 1000 g/giờ. Các cây thử nghiệm sau đó được trồng trong nhà kính trong các điều kiện được kiểm soát trong nhà kính (ở 24/16°C, ngày/đêm; chiếu sáng 14 giờ, độ ẩm 65%) và tưới nước hai lần mỗi ngày.

Sau 13 ngày đối với trước và sau khi nảy mầm, thử nghiệm được đánh giá về tỷ lệ phần trăm thiệt hại do chất diệt cỏ gây ra cho cây. Các hoạt tính sinh học được thể hiện trong bảng dưới đây trong thang điểm năm (5 = 80-100% thiệt hại; 4 = 60-79% thiệt hại; 3 = 40-59% thiệt hại; 2 = 20-39% thiệt hại; 1 = 0 -19% thiệt hại).

Hợp chất	Sử dụng SAU					Sử dụng TRƯỚC				
	ABUTH	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	ABUTH	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG
1.1	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.2	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.7	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.8	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.9	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất diệt cỏ có công thức (I):



hoặc muối nông dụng của hợp chất nêu trên, trong đó:

R^1 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_3 alkoxy- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 alkoxy- C_1 - C_3 alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 alkoxy- C_1 - C_3 -haloalkyl, C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -haloalkyl, C_4 - C_6 -xycloalkoxy được thể oxa- C_1 - C_3 -alkyl, C_4 - C_6 -xycloalkyl được thể oxa- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_4 - C_6 -xycloalkoxy được thể oxa- C_1 - C_3 -haloalkyl, C_4 - C_6 -xycloalkyl được thể oxa- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -haloalkyl, $(C_1$ - C_3 alkansulfonyl- C_1 - C_3 alkylamino)- C_1 - C_3 alkyl, $(C_1$ - C_3 alkansulfonyl- C_3 - C_4 xycloalkylamino)- C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_6 alkylcarbonyl- C_1 - C_3 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl- C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, xyano- C_1 - C_6 -alkyl, arylcarbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, trong đó aryl có thể được thể tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thể từ nhóm bao gồm halo, C_1 - C_3 -alkoxy, C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, aryl- C_1 - C_6 alkyl, aryloxy- C_1 - C_6 alkyl, trong đó cả hai trường hợp, aryl có thể được thể tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thể từ nhóm bao gồm halo, C_1 - C_3 -alkoxy, C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, và hệ một hoặc hai vòng ba đến mười cạnh, có thể là thơm, bão hòa hoặc bão hòa một phần và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, oxy và lưu huỳnh, hệ vòng này được thể tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thể được chọn từ nhóm bao gồm C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, C_1 - C_3 alkenyl, C_1 - C_3 alkynyl, C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_3 haloalkoxy, C_1 - C_6 alkyl-S(O)p-, C_1 - C_6 haloalkyl-S(O)p-, aryl, aryl-S(O)p, heteroaryl-S(O)p, aryloxy,

heteroaryloxy, C₁-C₃ alkoxycarbonyl, C₁-C₃ alkylamino-S(O)p-, C₁-C₃ alkylamino-S(O)p-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃ dialkylamino-S(O)p-, C₁-C₃ dialkylamino-S(O)p-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃ alkylaminocarbonyl-, C₁-C₃ alkylaminocarbonyl-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃ dialkylaminocarbonyl, C₁-C₃ dialkylaminocarbonyl-C₁-C₃alkyl, C₁-C₃ alkylcarbonylamino, C₁-C₃ alkyl-S(O)p-amino, xyano và nitro; các nhóm thế heteroaryl chứa một đến ba nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh, và trong đó thành phần aryl hoặc heteroaryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy, C₁-C₃ haloalkoxy, phenyl, xyano và nitro;

R² được chọn từ nhóm bao gồm hydro, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆alkyl, C₃-C₆xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆alkynyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₃haloalkoxy, C₁-C₆alkoxy-C₁-C₃ alkyl, C₁-C₆alkyl-S(O)p- và C₁-C₆haloalkyl-S(O)p-;

p = 0, 1 hoặc 2;

A¹ được chọn từ nhóm bao gồm O, C(O) và (CR^eR^f); và

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e và R^f độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro và C₁-C₄alkyl trong đó R^a và R^c có thể cùng nhau tạo thành chuỗi C₁-C₃alkylen.

2. Hợp chất diệt cỏ theo điểm 1, trong đó R¹ được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₃alkoxyC₁-C₃alkyl, C₁-C₃alkoxy C₂-C₃alkoxyC₁-C₃alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₂-C₆haloalkenyl C₁-C₃alkoxy-C₁-C₃haloalkyl, aryl, heteroaryl 5 hoặc 6 cạnh, heteroaryl-C₁-C₃alkyl 5 hoặc 6 cạnh và heteroxyclyl-C₁-C₃alkyl, heteroaryl hoặc heteroxyclyl chứa một đến ba nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh, và trong đó thành phần aryl, heteroxyclyl hoặc heteroaryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy, xyano và nitro.

3. Hợp chất diệt cỏ theo điểm 1, trong đó R¹ được chọn từ nhóm bao gồm aryl, heteroaryl 5 hoặc 6 cạnh và heteroaryl-C₁-C₃alkyl 5 hoặc 6 cạnh, heteroaryl chứa một đến ba nguyên tử khác loại độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh, và trong đó thành phần aryl hoặc heteroaryl có thể được thế tùy chọn bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm halo, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy, xyano và nitro.

4. Hợp chất diệt cỏ theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^2 là hydro hoặc metyl.
5. Chế phẩm diệt cỏ chứa hợp chất diệt cỏ theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên và tá dược điều chế nông dụng.
6. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 5, trong đó chế phẩm này còn chứa ít nhất một chất diệt loài gây hại bổ sung.
7. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 6, trong đó chất diệt loài gây hại bổ sung này là chất diệt cỏ hoặc chất an toàn diệt cỏ.
8. Phương pháp kiểm soát cỏ dại ở địa điểm sinh sống bao gồm việc dùng cho địa điểm này lượng kiểm soát cỏ dại của chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 7.