



(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)



1-0025235

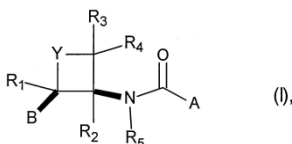
(51)⁷ C07D 213/81; A01N 43/04; C07C 233/66; C07C 233/67; C07D 213/82; C07D 407/12; C07D 239/30; C07D 241/24; C07D 305/08; C07D 405/10; C07D 405/12; C07D 405/14; A01N 35/08; C07D 239/28

(13) B

- (21) 1-2014-03148 (22) 06/03/2013
(86) PCT/EP2013/054461 06/03/2013 (87) WO 2013/143811 03/10/2013
(30) 12161190.9 26/03/2012 EP
(45) 25/08/2020 389 (43) 25/03/2015 324A
(73) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland
(72) O'SULLIVAN, Anthony Cornelius (GB); LOISELEUR, Olivier (FR); STAIGER, Roman (DE); LUKSCH, Torsten (DE); PITTERNA, Thomas (AT).
(74) Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)

(54) HỢP CHẤT XYCLOBUTYLCARBOXAMIT, QUY TRÌNH ĐIỀU CHẾ VÀ DƯỢC PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY

(57)



Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I), trong đó các phần tử thế là như được xác định theo điểm 1, thích hợp để dùng làm chất diệt giun tròn; quy trình điều chế và chế phẩm diệt loài gây hại/dược phẩm chứa hợp chất này. Ngoài ra, sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát thiệt hại và/hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/hoặc nấm, phương pháp bảo vệ vật liệu nhân giống thực vật khỏi thiệt hại và/hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/hoặc nấm và vật liệu nhân giống thực vật được bao.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các hợp chất xyclobutylcarboxamit, quy trình điều chế các hợp chất này và chế phẩm diệt loài gây hại/được phẩm chứa chúng. Ngoài ra, sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát thiệt hại và/hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/hoặc nấm, phương pháp bảo vệ vật liệu nhân giống thực vật khỏi thiệt hại và/ hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/ hoặc nấm và vật liệu nhân giống thực vật được bao.

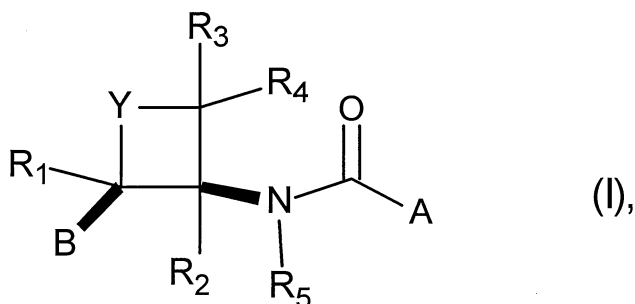
Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Xycloalkylcarboxamit được mô tả, ví dụ, trong WO 09/043784, WO06/122952, WO06/122955, WO05/103006, WO05/103004 và WO04/014842.

Xyclobutylcarboxamit mới đã được phát hiện khác biệt bởi vòng xyclobutyl được thể cis, mà thể hiện hoạt tính diệt giun tròn tốt.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, mục đích của sáng chế là đề cập đến các hợp chất có công thức I



trong đó

Y là O, C=O, hoặc CR₁₂R₁₃;

A là dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại, mỗi nguyên tử độc lập được chọn từ oxy, nitơ và lưu huỳnh, hoặc vòng phenyl, dị vòng thơm hoặc phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều R₆;

R6, độc lập với nhau là halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-haloalkylthio, C1-C4-alkoxy-C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkoxy-C1-C4-alkyl;

R1, R2, R3, R4, R12 và R13, độc lập với nhau là hydro, halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-alkoxy hoặc C1-C4-haloalkyl;

R5 là hydro, metoxy hoặc hydroxyl;

B là phenyl được thế bằng một hoặc nhiều R8;

R8, độc lập với nhau, là halogen, xyano hoặc nhóm $-L-R9$, trong đó mỗi L độc lập là liên kết, $-O-$, $-OC(O)-$, $-NR7-$, $-NR7CO-$, $-NR7S(O)_n-$, $-S(O)_n-$, $-S(O)_nNR7-$, $-COO-$ hoặc $CONR7-$;

n là 0, 1 hoặc 2;

R7 là hydro, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, benzyl hoặc phenyl, trong đó benzyl và phenyl không được thế hoặc được thế bằng halogen, xyano, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl;

R9, độc lập với nhau là C1-C6-alkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C3-C6-xycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C6-C14-bixycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkenyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkynyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, phenyl, không được thế hoặc được thế bằng R10, hoặc heteroaryl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10;

R10, độc lập với nhau là halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-alkylthio, C1-C4-haloalkylthio, C3-C6-alkenyloxy, hoặc C3-C6-alkynyloxy;

trong đó B và $A-CO-NR5$ là cis với nhau trên vòng bốn cạnh,

và các chất hồ biến/các chất đồng phân/các chất đồng phân đối ảnh của các hợp chất này.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các hợp chất có công thức (I) và, khi thích hợp, các chất hồ biến của chúng, trong mỗi trường hợp ở dạng tự do hoặc ở dạng muối, có thể có mặt ở dạng một trong các chất đồng phân có thể hoặc là hỗn hợp của chúng, ví dụ ở dạng các chất đồng phân tinh khiết, như thể đối quang và/hoặc các chất đồng phân không đối quang, hoặc là

hỗn hợp chất đồng phân, như hỗn hợp chất đồng phân đối ảnh, ví dụ raxemat, hỗn hợp chất đồng phân không đối quang hoặc hỗn hợp raxemat, phụ thuộc vào số lượng, cấu hình tuyệt đối và tương đối của các nguyên tử cacbon không đối xứng mà có trong phân tử và/hoặc phụ thuộc vào cấu hình của các liên kết đôi không thơm mà có trong phân tử; sáng chế đề cập đến các chất đồng phân tinh khiết và cả toàn bộ hỗn hợp chất đồng phân có thể và được hiểu là trong mỗi trường hợp theo nghĩa ở trên đây và dưới đây, ngay cả khi đặc điểm hóa học lập thể không được đề cập cụ thể trong mỗi trường hợp. Sáng chế theo đó bao gồm toàn bộ các chất đồng phân và các chất hỗn biến này và hỗn hợp của chúng ở tất cả các tỷ lệ cũng như các dạng đồng vị như các hợp chất đơtêrô hóa. Ví dụ, các hợp chất theo sáng chế có thể chứa một hoặc nhiều nguyên tử cacbon không đối xứng, ví dụ, ở nhóm $-CR^3R^4-$ hoặc Y trong $-CR^{12}CR^{13}-$ hoặc trên phân tử thể của nó, và các hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại là các chất đồng phân đối ảnh (hoặc là cặp chất đồng phân không đối quang) hoặc là hỗn hợp chúng.

Sáng chế còn bao gồm muối và N-oxit của mỗi hợp chất có công thức (I).

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng hiểu rằng do trong môi trường và trong các điều kiện sinh lý muối của các hợp chất hóa học cân bằng với dạng không muối tương đương của chúng, các muối này có cùng lợi ích sinh học với các dạng không muối.

Do đó, một lượng lớn các loại muối của các hợp chất theo sáng chế (và các hoạt chất được dùng kết hợp với các hoạt chất theo sáng chế) có thể hữu dụng để không chế các loài gây hại không xương sống và các ký sinh trùng ở động vật. Muối trong số muối dùng được trong nông nghiệp và/hoặc dung nạp được trong môi trường sinh lý bao gồm muối cộng axit với axit vô cơ hoặc hữu cơ như axit bromhydric, axit clohydric, axit nitric, axit phosphoric, axit sulfuric, axit axetic, axit butyric, axit fumaric, axit lactic, axit maleic, axit malonic, axit oxalic, axit propionic, axit salixylic, axit tartaric, axit 4-toluensulfonic hoặc axit valeric.

Thích hợp trong số muối dùng được trong nông nghiệp và/hoặc dung nạp được trong môi trường sinh lý còn có thể là muối của các cation không có tác động bất lợi đến hoạt động diệt loài gây hại và/hoặc hoạt động diệt vật ký sinh của các hợp chất có công thức (I). Do đó, cation đặc biệt thích hợp là ion của kim loại kiềm bao gồm natri, kali và lithi, của kim loại kiềm thổ bao gồm canxi và magie, và của kim loại chuyển tiếp bao gồm mangan, đồng, sắt, kẽm, coban, chì, bạc, niken, và cả amoni hoặc amoni

hữu cơ bao gồm monoalkylamoni, dialkylamoni, trialkylamoni, tetraalkylamoni, monoalkenylamoni, dialkenylamoni, trialkenylamoni, monoalkynylamoni, dialkynylamoni, monoalkanolamoni, dialkanolamoni, C5-C6-xycloalkylamoni, piperidini, morpholini, pyrrolidini, hoặc benzylamoni, hơn nữa ion phosphoni, ion sulfoni, tốt hơn là ion tri(C1-C4 -alkyl) sulfoni và sulfoxoni, tốt hơn là tri (C1-C4 -alkyl) sulfoxoni.

Nhóm alkyl (hoặc là một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như alkoxy-, alkylsulfanyl-, alkylsulfinyl-, alkylsulfonyl-, alkylcarbonyl- hoặc alkoxycarbonyl-) có thể ở dạng mạch thẳng hoặc mạch có nhánh và là, ví dụ, metyl, etyl, 1-propyl, prop-2-yl, 1-butyl, but-2-yl, hoặc 2-metyl-prop-2-yl. Nhóm alkyl (hoặc là một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như alkoxy-, alkylsulfanyl-, alkylsulfinyl-, alkylsulfonyl-, alkylcarbonyl- hoặc alkoxycarbonyl-), theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là C1-C3-alkyl, tốt hơn nữa là C1-C2-alkyl, đặc biệt là nhóm metyl. Trong trường hợp alkoxy, các ví dụ là metoxy, etoxy, propoxy, n-butoxy, isobutoxy và cả các nhóm đồng phân của chúng; tốt hơn là độc lập với các phương án khác, metoxy và etoxy, đặc biệt là metoxy.

Các nhóm alkenyl có thể ở dạng mạch thẳng hoặc mạch có nhánh, và có thể là, nếu thích hợp, có cấu hình (E)- hoặc (Z)-. Các ví dụ là vinyl và alyl. Nhóm alkenyl, theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là nhóm C2-C3 -alkenyl, tốt hơn nữa là nhóm vinyl hoặc alyl.

Các nhóm alkynyl có thể ở dạng mạch thẳng hoặc mạch có nhánh. Các ví dụ là etynyl và propargyl. Nhóm alkynyl, theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là nhóm C2-C3-alkynyl, tốt hơn nữa là nhóm propargyl.

Halogen là flo, clo, brom hoặc iot; halogen, theo mỗi phương án của sáng chế, là flo, clo, hoặc brom; đặc biệt là flo hoặc clo.

Nhóm haloalkyl (hoặc là một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như haloalkoxy-, haloalkylsulfanyl-, haloalkylsulfinyl- hoặc haloalkylsulfonyl-) là nhóm alkyl được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và là, ví dụ, flometyl, diflometyl, triflometyl, clodiflometyl và 2,2,2-triflo-etyl. Nhóm haloalkyl (hoặc là một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như haloalkoxy-, haloalkylsulfanyl-, haloalkylsulfinyl- hoặc haloalkylsulfonyl-), theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là triflometyl. Trong trường hợp haloalkoxy, các ví dụ là

flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 1,1,2,2-tetrafloetoxy, 2-floetoxy, 2-cloetoxy, 2,2-difloetoxy và 2,2,2-tricloetoxy; tốt hơn là diflometoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-cloetoxy và triflometoxy

Nhóm xycloalkyl là đơn vòng và là, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl. Nhóm C3-C6-xycloalkyl, theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là C3-C5-xycloalkyl, tốt hơn nữa là nhóm C3-C4-xycloalkyl, đặc biệt là nhóm C3-xycloalkyl. Khi gốc xycloalkyl đã biết được thế, gốc xycloalkyl tốt hơn là được thế bằng một đến bốn phần tử thế, tốt hơn nữa là bằng một đến ba phần tử thế, như một hoặc hai phần tử thế, đặc biệt là bằng một phần tử thế.

Alkoxycarbonyl là, ví dụ, metoxycarbonyl, etoxycarbonyl, propoxycarbonyl, isopropoxycarbonyl, n-butoxycarbonyl, isobutoxycarbonyl, sec-butoxycarbonyl và tert-butoxycarbonyl; được ưu tiên là metoxycarbonyl, etoxycarbonyl và isopropoxycarbonyl.

Nhóm alkylsulfanyl là, ví dụ, metylsulfanyl, etylsulfanyl, propylsulfanyl, isopropylsulfanyl, n-butylsulfanyl, isobutylsulfanyl, sec-butylsulfanyl và tert-butylsulfanyl. Các ví dụ về haloalkylsulfanyl là phần tử thế halogen hóa clo- và/hoặc flo- của chúng, như diflometylsulfanyl, triflometylsulfanyl, clodiflometylsulfanyl và 2,2,2-triflo-etyl-sulfanyl.

Alkylsulfanyl là, ví dụ, metylsulfanyl, etylsulfanyl, propylsulfanyl, isopropylsulfanyl, n-butylsulfanyl, isobutylsulfanyl, sec-butylsulfanyl, và tert-butylsulfanyl. Các ví dụ về haloalkylsulfanyl là phần tử thế halogen hóa clo- và/hoặc flo- của chúng, như diflometylsulfanyl, triflometylsulfanyl, clodiflometylsulfanyl và 2,2,2-triflo-etyl-sulfanyl.

Nhóm alkylsulfonyl là, ví dụ, metylsulfonyl, etylsulfonyl, propylsulfonyl, isopropylsulfonyl, n-butylsulfonyl, isobutylsulfonyl, sec-butylsulfonyl và tert-butylsulfonyl. Các ví dụ về haloalkylsulfonyl là phần tử thế halogen hóa clo- và/hoặc flo- của chúng, như diflometylsulfonyl, triflometylsulfonyl, clodiflometylsulfonyl và 2,2,2-triflo-etyl-sulfonyl.

Alkoxyalkyl là, ví dụ, metoxymetyl, 2-metoxyletyl, etoxymetyl, 2-etoxyletyl, n-propoxymetyl, n-propoxy-2-etyl, isopropoxymetyl và 1-isopropoxyetyl. Nhóm alkoxyalkyl, theo mỗi phương án của sáng chế, tốt hơn là C1-C4-alkoxy-C1-C4-alkyl, tốt hơn nữa là C1-C2-alkoxy-metyl, như nhóm metoxymetyl và etoxymetyl.

Nhóm aryl (hoặc là một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như aryl-alkylen-) là hệ vòng thơm có thể là một, hai hoặc ba vòng. Ví dụ về các vòng này bao gồm phenyl, naphtyl, antraxenyl, indenyl hoặc phenantrenyl. Các nhóm aryl được ưu tiên là phenyl và naphtyl, phenyl được ưu tiên nhất.

Các ví dụ về xycloalkylcarbonyl là xyclopropylcarbonyl, xyclobutylcarbonyl, xyclopentylcarbonyl và xyclohexylcarbonyl; được ưu tiên là xyclopropylcarbonyl và xyclobutylcarbonyl.

Các ví dụ về xycloalkoxycarbonyl là xyclopropyloxycarbonyl, xyclobutyloxycarbonyl, xyclopentyloxycarbonyl và xyclohexyloxycarbonyl; được ưu tiên là xyclopropyloxycarbonyl và xyclobutyloxycarbonyl.

Thuật ngữ “heteroaryl” dùng để chỉ hệ vòng thơm chứa ít nhất một nguyên tử khác loại và chứa hoặc là vòng đơn hoặc hai vòng ngưng tụ. Tốt hơn là vòng đơn sẽ chứa đến 3 và hệ hai vòng chứa đến 5, nguyên tử khác loại, sẽ tốt hơn là được chọn từ nitơ, oxy và lưu huỳnh. Các ví dụ về nhóm này bao gồm furyl, thienyl, pyrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,3-triazolyl, 1,2,4-triazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,2,5-oxadiazolyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,2,5-thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, 1,2,3-triazinyl, 1,2,4-triazinyl, 1,3,5-triazinyl, benzofuryl, benzisofuryl, benzothienyl, benzisothienyl, indolyl, isoindolyl, indazolyl, benzothiazolyl, benzisothiazolyl, benzoxazolyl, benzisoxazolyl, benzimidazolyl, 2,1,3-benzoxadiazol, quinoliny, isoquinoliny, xinoliny, phthalazinyl, quinazoliny, quinoxaliny, naphthyridiny, benzotriazinyl, puriny, pteridiny và indoliziny.

Có thể các hợp chất có công thức I còn có các tâm hóa học lập thể, hoặc là ở cạnh cacbon R3 và R4, hoặc khi Y là CR12R13, hoặc ở một trong các phần tử thế. Các chất đồng phân khác sau đó cũng có thể. Sáng chế bao gồm toàn bộ các chất đồng phân này và hỗn hợp của chúng.

Các hợp chất có công thức I có thể ở dạng hỗn biến khác nhau. Sáng chế bao gồm toàn bộ dạng hỗn biến này và hỗn hợp của chúng.

Tốt hơn là A là dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh được thế tùy ý, chứa, tốt hơn là an oxy atom hoặc một hoặc hai nguyên tử nitơ, như furyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, và pyridazinyl, cụ thể là pyridyl, hoặc A tốt hơn là phenyl được thế tùy ý. Theo một

phương án của phương án bất kỳ về A, có 1 đến 3, tốt hơn là 1 hoặc 2 phần tử thể R6 trên A.

Tốt hơn nữa, A là dị vòng thơm 6 cạnh được thể tùy ý, chứa 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ (ví dụ pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, và pyridazinyl, cụ thể là pyridyl) hoặc A tốt hơn là phenyl được thể tùy ý.

Các phần tử thể được ưu tiên (R6), độc lập với nhau, và độc lập về loại vòng, được chọn từ C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl (cụ thể là di- và triflometyl), C1-C4-haloalkoxy, xyano và halogen, cụ thể là triflometyl, flo và clo.

Tốt nhất, nếu A, độc lập với các phương án khác, là pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, hoặc phenyl, có thể không được thể hoặc được thể bằng một hoặc hai phần tử thể R6, có thể được chọn độc lập từ clo, flo, triflometyl, metyl, bromo, và xyano.

Điểm hoặc các điểm gắn được ưu tiên của các phần tử thể này là ortho với điểm gắn của A với C(O)NR5.

Các ví dụ được ưu tiên về A, độc lập với các phương án khác, là 2,6-diflophenyl (A1); 3-clo-2-pyrazinyl (A2); 3-triflometyl-2-pyridyl (A3); 2-triflometyl-3-pyridyl (A5); 2-triflometyl-phenyl (A6); 2-clo-3-pyridyl (A7); 3-metyl-2-pyridyl (A11); 2-metyl-3-pyridyl (A22); 3-metyl-2-pyrazinyl (A24); 3-bromo-2-pyrazinyl (A25); 3-triflometyl-2-pyrazinyl (A26); và 2-xyanophenyl (A29).

A được đặc biệt ưu tiên độc lập với các phương án khác, được chọn từ 3-clo-2-pyrazinyl (A2); 3-triflometyl-2-pyridyl (A3); 2-triflometyl-3-pyridyl (A5); 2-triflometyl-phenyl (A6); 2-clo-3-pyridyl (A7); 3-metyl-2-pyrazinyl (A24); 3-bromo-2-pyrazinyl (A25); và 3-triflometyl-2-pyrazinyl (A26).

A được đặc biệt ưu tiên, độc lập với các phương án khác, được chọn từ 3-clo-2-pyrazinyl (A2); 3-triflometyl-2-pyridyl (A3); 2-triflometyl-3-pyridyl (A5); 2-triflometyl-phenyl (A6); 2-clo-3-pyridyl (A7); và 3-triflometyl-2-pyrazinyl (A26); advantageously 3-clo-2-pyrazinyl (A2); 2-triflometyl-3-pyridyl (A5); 2-triflometyl-phenyl (A6); và 3-triflometyl-2-pyrazinyl (A26).

Tốt hơn, nếu Y là O hoặc CR12R13, trong đó R12 và R13 độc lập với nhau là hydro, halogen, xyano, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl. Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, R12 và R13 đều là hydro.

Tốt hơn, nếu R1, R2, R3 và R4 độc lập với nhau là hydro, halogen, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl. Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, mỗi R1, R2, R3 và R4 là hydro.

Theo một phương án, khi Y là CR₁₂R₁₃, năm hoặc sáu trong số R1, R2, R3, R4, R₁₂ và R₁₃ là hydro. Theo phương án ưu tiên, Y là CR₁₂R₁₃, thì mỗi R1, R3, R4, R₁₂ và R₁₃ là hydro, và R2 hoặc là xyano hoặc là C1-C4-alkoxy, như metoxy.

Theo một phương án, khi Y là O, mỗi trong số R1, R2, R3 và R4 là hydro.

Tốt hơn, nếu R5 là hydro.

B là phenyl được thế bằng phần tử thế (R8). Trong một ví dụ, có 1 đến 3 phần tử thế R8 trên B. Tốt hơn là phần tử thế R8, độc lập với nhau, được chọn từ halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-alkylthio, C1-C4-haloalkylthio, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, C1-C4-haloalkyl-C3-C6-xycloalkyl, phenyl, phenoxy, xyclopentyloxy, alyl, propargyl, alyloxy, propargyloxy, C1-C4-alkylsulfoxit, C1-C4-haloalkylsulfoxit, C1-C4-alkylsulfonyl, C1-C4-haloalkylsulfonyl, C1-C4-alkylsulfonylamino, propargylsulfonylamino, xyclopropylsulfonamino, xyclobutylsulfonamino, xyclopentylsulfonamino, phenylsulfonamino, pyridylsulfonamino, pyridyl, imidazolyl, pyridyloxy, phenylcarbonyl, phenoxy carbonyl, phenylcarbonyloxy, pyridylcarbonyl, pyridyloxycarbonyl, pyridylcarbonyloxy, C1-C4-alkoxycarbonyl, C1-C4-alkylcarbonyloxy, xyclopentyloxycarbonyl, alyloxycarbonyl, propargyloxycarbonyl, alylcarbonyloxy, propargylcarbonyloxy, C1-C4-alkylamino, xyclopentylamino, phenylaminosulfonyl, C1-C4-alkylaminosulfonyl, xyclopentylaminosulfonyl, pyridylaminosulfonyl, alylaminosulfonyl, propargylaminosulfonyl, phenylamino, pyridylamino, alylamino, propargylamino, phenylaminocarbonyl, pyridylaminocarbonyl, xyclopentylaminocarbonyl, phenylcarbonylamino, pyridylcarbonylamino, alylcarbonylamino và propargylcarbonylamino, trong đó các phần tử thế này, độc lập với nhau, có thể được thế, hoặc, khi được phép, có thể còn được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế (R10). Phần tử thế R10, độc lập với nhau được chọn từ, tốt hơn là được chọn từ C1-C4-alkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkylthio và halogen.

Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, B là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ halogen, xyano, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-

haloalkoxy, và C3-C6-xycloalkyl. Theo một phương án ưu tiên, phần tử thế độc lập được chọn từ bromo, clo, flo, triflometyl, diflometoxy, triflometoxy và xyclopropyl.

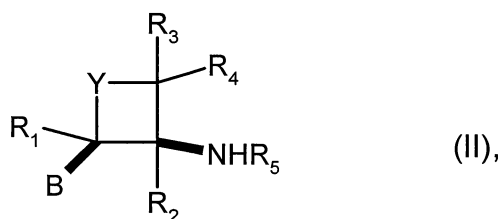
Trong nhóm các hợp chất có công thức I được ưu tiên, B là phenyl, được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ halogen, xyclopropyl, C1-C4-haloalkylxyclopropyl, C1-C4-haloalkyl và C1-C4-haloalkoxy, A là phenyl, furyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl hoặc pyridazinyl, trong đó vòng, độc lập với nhau, không được thế hoặc được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn, từ C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, xyano và halogen, Y là O hoặc CH₂, và R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là hydro. Trong nhóm các hợp chất có công thức I này, B đặc biệt là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, clo, bromo, triflometyl và triflometoxy. Trong nhóm các hợp chất có công thức I này, A đặc biệt là phenyl, pyridyl, pyrazinyl hoặc pyrimidinyl, trong đó vòng, độc lập với nhau, không được thế hoặc được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, metyl và triflometyl.

Trong nhóm các hợp chất có công thức I được ưu tiên khác, B là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, clo, triflometyl, xyclopropyl, triflometylxyclopropyl, diflometoxy hoặc triflometoxy, A là phenyl, pyridyl hoặc pyrazinyl, trong đó vòng, độc lập với nhau, không được thế hoặc được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ clo, bromo, flo, metyl, xyano, và triflometyl, Y là O hoặc CH₂, và R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là hydro. Tốt hơn nữa là trong nhóm các hợp chất có công thức I này, B đặc biệt là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, clo, diflometoxy hoặc triflometoxy, A đặc biệt là phenyl, pyrazinyl hoặc pyridyl, trong đó vòng, độc lập với nhau, được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ clo, flo, metyl và triflometyl.

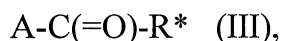
Trong nhóm hợp chất có công thức I được đặc biệt ưu tiên, B là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn, từ halogen, C1-C4-haloalkyl, và C1-C4-haloalkoxy; A là phenyl, pyridyl hoặc pyrazinyl, trong đó vòng, độc lập với nhau, là được thế đơn bởi halogen hoặc C1-C4-haloalkyl; Y là O hoặc CH₂; và R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là hydro. Tốt hơn nữa là trong nhóm các hợp chất có công thức I này, B đặc biệt là phenyl được thế bằng từ 1 đến 2 phần tử thế, độc lập được chọn, từ flo, clo, triflurometyl, diflometoxy và triflometoxy; A đặc biệt là phenyl, pyrazinyl hoặc pyridyl, trong đó vòng được thế đơn bằng phần tử thế từ clo, flo hoặc triflometyl.

Theo một phương án được ưu tiên đặc biệt, hợp chất có công thức I là khi Y là CH₂; B là phenyl được thế bằng halogen một lần hoặc hai lần; mỗi R₁ đến R₅ là hydro và A được chọn từ phenyl, pyrazinyl hoặc pyridyl, mỗi trong số đó được thế một lần hoặc thế đôi, độc lập với nhau, bằng phần tử thế độc lập được chọn từ halogen và C₁-C₄-haloalkyl, tốt hơn là A được thế một lần.

Các hợp chất có công thức I có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức II



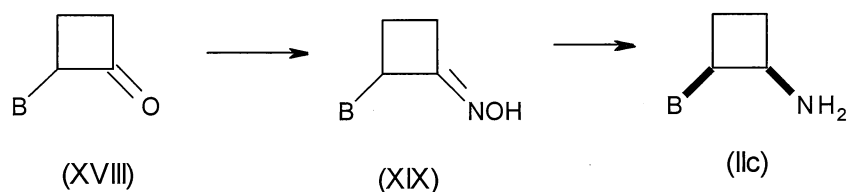
trong đó B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là như được xác định theo công thức I; phản ứng với chất axyl hoá có công thức III



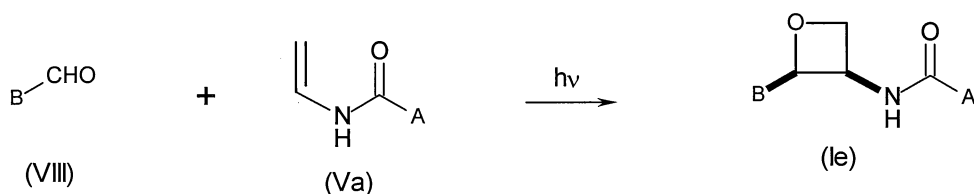
trong đó A là như được xác định theo công thức I, và R* là halogen, hydroxy hoặc C₁₋₆ alkoxy, tốt hơn là clo, với sự có mặt của bazơ, như trietylamin, bazơ Hunig, natri bicacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, pyridin hoặc quinolin, nhưng tốt hơn là trietylamin, và thông thường trong dung môi, như diethylene, TBME, THF, diclometan, cloform, DMF hoặc NMP, trong khoảng từ 10 phút đến 48 giờ, tốt hơn là 12 đến 24 giờ, và từ 0° C đến hồi lưu, tốt hơn là 20 đến 25 °C.

Khi R* là hydroxyl, chất liên hợp, như benzotriazol-1-yloxytris(dimetylamino) phosphonihexaflophosphat, clorua của axit bis-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphinic (BOP-Cl), N,N'-dixyclohexylcarbodiimide (DCC) hoặc 1,1'-carbonyl-diimidazol (CDI), có thể được sử dụng.

Các hợp chất có công thức IIc trong đó B là như được xác định theo công thức I, Y là CH₂ và R₁, R₂, R₃ và R₄ là H có thể được điều chế từ keton XVIII. Điều này có thể được thực hiện bằng phản ứng chuyển oxim XIX và phản ứng khử. D. E. Nichols và cộng sự (J. Med. Chem 1984, 27, 1108-11) mô tả các phương pháp cho phản ứng khử này. Một số phương pháp có thể thu được các chất đồng phân trans dưới dạng sản phẩm phụ.



Các hợp chất có công thức 1e có thể được điều chế bằng sự thêm vòng 2+2 của aldehyt có công thức (VIII) và enamit có công thức (Va). Điều này có thể được thực hiện với sự hỗ trợ của bức xạ UV như được mô tả bởi Bach và cộng sự (Journal of Organic Chemistry (1999), 64(4), 1265-1273). Chúng có thể được đi kèm với các chất đồng phân trans của chúng



Để điều chế tất cả các hợp chất khác có công thức I chức hoá theo định nghĩa của A, B, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅ và R₁₂ và R₁₃ có số lượng lớn các phương pháp chuẩn đã biết, như phản ứng alkyl hoá, halogen hoá, axyl hoá, amit hoá, oxim hoá, oxy hoá khử. Việc lựa chọn các phương pháp điều chế thích hợp là phụ thuộc vào các đặc tính (tính phản ứng) của phần tử thế trong các hợp chất trung gian.

Các phản ứng này có thể thường được thực hiện trong dung môi.

Các phản ứng này có thể thường được thực hiện ở các nhiệt độ khác nhau.

Các phản ứng này có thể thường được thực hiện dưới khí quyển trơ.

Các chất phản ứng có thể được phản ứng với sự có mặt của bazơ. Các ví dụ về bazơ thích hợp là hydroxit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, hydrit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, amit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, alkoxit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, axetat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, cacbonat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, dialkylamit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ hoặc alkylsilylamit của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ, alkylamin, alkylendiamin, xycloalkylamin bão hoà hoặc không bão hoà không N-alkyl hoá hoặc không, dị vòng bazơ, amoni hydroxit và carboxyclic amin. Các ví dụ được đề cập là natri hydroxit, natri hydrit, natri amit, natri metoxit, natri

axetat, natri cacbonat, kali tert-butoxit, kali hydroxit, kali cacbonat, kali hydrit, liti diisopropylamit, kali bis(trimetylsilyl)amit, canxi hydrit, trietylamin, diisopropyletylamin, trietylendiamin, xyclohexylamin, N-xyclohexyl-N,N-dimetylamin, N,N-dietylanilin, pyridin, 4-(N,N-dimetylamino)pyridin, quinuclidin, N-metylmorpholin, benzyltrimetylamoni hydroxit và 1,8-diazabixyclo[5.4.0]undec-7-ene (DBU).

Các chất phản ứng có thể được phản ứng với nhau như vậy, tức là không cần thêm dung môi hoặc chất pha loãng. Tuy nhiên, trong hầu hết các trường hợp, thuận lợi khi thêm dung môi hoặc chất pha loãng trơ hoặc hỗn hợp của chúng. Nếu phản ứng được thực hiện với sự có mặt của bazơ, bazơ được sử dụng quá mức, như trietylamin, pyridin, N-metylmorpholin hoặc N,N-dietylanilin, có thể còn đóng vai trò như dung môi hoặc chất pha loãng.

Phản ứng được thực hiện một cách thuận lợi ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ xấp xỉ -80°C đến xấp xỉ $+140^{\circ}\text{C}$, tốt hơn là từ xấp xỉ -30°C đến xấp xỉ $+100^{\circ}\text{C}$, trong nhiều trường hợp trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến xấp xỉ $+80^{\circ}\text{C}$.

Hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển hóa theo cách đã biết trước thành hợp chất khác có công thức (I) bằng cách thay thế một hoặc nhiều phần tử thế của hợp chất khởi đầu có công thức (I) theo cách thông thường bằng (các) phần tử thế khác theo sáng chế.

Phụ thuộc vào việc lựa chọn các điều kiện phản ứng và vật liệu khởi đầu thích hợp trong mỗi trường hợp, có thể, ví dụ, chỉ trong một bước phản ứng để thay thế một phần tử thế bằng phần tử thế khác theo sáng chế, hoặc nhiều phần tử thế có thể được thay thế bằng phần tử thế khác theo sáng chế trong cùng bước phản ứng.

Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế theo cách đã biết trước. Do đó, ví dụ, muối cộng axit của các hợp chất có công thức (I) thu được bằng cách xử lý bằng axit thích hợp hoặc chất phản ứng trao đổi ion thích hợp và muối với bazơ thu được bằng cách xử lý bằng bazơ thích hợp hoặc với chất phản ứng trao đổi ion thích hợp. Muối được chọn phụ thuộc vào khả năng dung nạp của nó để sử dụng cho hợp chất, như khả năng dung nạp trong nông nghiệp hoặc môi trường sinh lý.

Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển hóa bằng cách thông thường thành các hợp chất I tự do, muối cộng axit, ví dụ, bằng xử lý với hợp chất bazơ

thích hợp hoặc với chất phản ứng trao đổi ion thích hợp và muối với bazơ, ví dụ, bằng xử lý với axit thích hợp hoặc với chất phản ứng trao đổi ion thích hợp.

Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển hóa theo cách đã biết thành các muối khác của các hợp chất có công thức (I), muối cộng axit, ví dụ, thành muối cộng axit khác, ví dụ bằng cách xử lý muối của axit vô cơ như hydroclorua với muối kim loại thích hợp như muối natri, bari hoặc bạc, của axit, ví dụ với bạc axetat, trong dung môi thích hợp trong đó muối vô cơ mà tạo thành, ví dụ bạc clorua, là không tan và do đó kết tủa từ hỗn hợp phản ứng.

Phụ thuộc vào quy trình hoặc các điều kiện phản ứng, các hợp chất có công thức (I), mà có đặc tính tạo muối có thể thu được ở dạng tự do hoặc ở dạng muối.

Hỗn hợp chất đồng phân không đối quang hoặc hỗn hợp raxemat của các hợp chất có công thức (I), ở dạng tự do hoặc ở dạng muối, có thể thu được phụ thuộc vào mà vật liệu khởi đầu và quy trình được chọn có thể được tách ra theo cách đã biết thành chất đồng phân không đối ảnh tinh khiết hoặc raxemat trên cơ sở sự khác biệt hoá lý của các thành phần, ví dụ bằng kết tinh đoạn, chưng cất và/hoặc sắc ký.

Hỗn hợp chất đồng phân đối ảnh, như raxemat, mà có thể thu được theo cách tương tự có thể được phân giải thành thể đối quang quang học bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng kết tinh lại từ dung môi hoạt tính quang học, bằng sắc ký trên chất hấp phụ không đối xứng, ví dụ sắc ký lỏng hiệu năng cao (HPLC) trên axetyl xenluloza, với sự giúp đỡ của vi sinh vật thích hợp, bằng cách chia tách với các enzym bất động, cụ thể, thông qua hình hành các hợp chất gộp, ví dụ sử dụng ete không đối xứng đỉnh, khi chỉ một chất đồng phân đối ảnh là phức hợp, hoặc bằng cách chuyển hóa thành muối đồng phân không đối ảnh, ví dụ bằng phản ứng raxemat thành phẩm bazơ với axit hoạt tính tùy ý, như axit carboxylic, ví dụ axit camphoric, tartaric hoặc malic, hoặc axit sulfonic, ví dụ axit camphorsulfonic, và tách hỗn hợp chất đồng phân không đối ảnh mà có thể thu được bằng cách này, ví dụ bằng kết tinh đoạn trên cơ sở khả năng tan khác nhau của chúng, để thu được các chất đồng phân không đối quang, từ đó chất đồng phân đối ảnh mong muốn có thể tự do nhờ hoạt động của các tác nhân thích hợp, ví dụ các tác nhân bazơ.

Các chất đồng phân không đối quang hoặc các chất đồng phân đối ảnh tinh khiết có thể thu được theo sáng chế không chỉ bằng cách tách hỗn hợp chất đồng phân thích hợp, mà còn bằng các phương pháp thông thường đã biết của tổng hợp chọn lọc đồng

phân không đối ảnh hoặc chọn lọc đồng phân đối ảnh, ví dụ bằng cách thực hiện quy trình theo sáng chế với vật liệu khởi đầu của hoá học lập thể thích hợp.

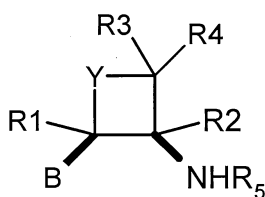
N-oxit có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức (I) phản ứng với chất oxy hoá thích hợp, ví dụ sản phẩm cộng H_2O_2 / ure với sự có mặt của anhydrit axit, ví dụ anhydrit axit trifloaxetic. Oxy hoá này được biết từ tài liệu, ví dụ từ J. Med. Chem., 32 (12), 2561-73, 1989 hoặc WO 00/15615 hoặc C. White, Science, tập 318, tr.783, 2007.

Có thể thuận lợi để phân lập hoặc tổng hợp trong môi trường hợp chất đồng phân có hiệu quả sinh học hơn, ví dụ chất đồng phân đối ảnh hoặc chất đồng phân không đối quang, hoặc hỗn hợp chất đồng phân, ví dụ hỗn hợp chất đồng phân đối ảnh hoặc hỗn hợp chất đồng phân không đối quang, nếu các thành phần riêng có hoạt tính sinh học khác nhau.

Các hợp chất có công thức (I) và, khi thích hợp, các chất hỗ biến của chúng, trong môi trường hợp ở dạng tự do hoặc ở dạng muối, có thể, nếu thích hợp, cũng thu được ở dạng của hydrat và/hoặc bao gồm dung môi khác, ví dụ chúng có thể được sử dụng để kết tinh các hợp chất có mặt ở dạng rắn.

Sáng chế còn đề cập đến các hợp chất trung gian có công thức (II), và (XIXa), có thể được sử dụng để điều chế các hợp chất có công thức (I).

Theo đó, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (II)



(II)

trong đó

Y là O, C=O, hoặc CR₁₂R₁₃;

R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ và R₁₃, độc lập với nhau, là hydro, halogen, xyano, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl,

R₅ là hydro, metoxy hoặc hydroxyl,

B là phenyl được thế bằng một hoặc nhiều R₈,

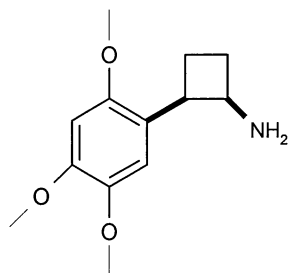
R₈ độc lập với nhau, là halogen, xyano hoặc nhóm -L-R₉, trong đó mỗi L độc lập với nhau là liên kết, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- hoặc CONR₇-,

n là 0, 1 hoặc 2,

R7 là hydro, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, benzyl hoặc phenyl, khi benzyl và phenyl không được thế hoặc được thế bằng halogen, xyano, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl,

R9, độc lập với nhau, là C1-C6-alkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C3-C6-xycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C6-C14-bixycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkenyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkynyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, phenyl, không được thế hoặc được thế bằng R10, hoặc heteroaryl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10,

R10, độc lập với nhau, là halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-alkylthio, C1-C4-haloalkylthio, C3-C6-alkenyloxy, hoặc C3-C6-alkynyloxy, với điều kiện B và A-CO-NR5 là cis với nhau trên vòng bốn cạnh, trong đó hợp chất có công thức



bị loại trừ.

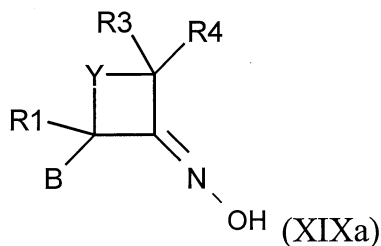
Theo một phương án ưu tiên, phần tử thế có công thức (I) được ưu tiên bất kỳ liên quan đến mỗi B, Y, R1, R2, R3, R4, và R5 cũng là phần tử thế được ưu tiên, độc lập với công thức (I), đối với công thức (II) trong phạm vi B, Y, R1, R2, R3, R4, và R5 tương ứng.

Đặc biệt là Y là CH₂, mỗi R1 đến R5 là hydro và B là phenyl, được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ halogen, xyclopropyl, C1-C4-haloalkylxyclopropyl, C1-C4-haloalkyl và C1-C4-haloalkoxy.

Theo phương án cụ thể, Y là CH₂, mỗi R1 đến R5 là hydro và B là phenyl được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, clo, triflometyl, xyclopropyl, triflometylxyclopropyl và triflometoxy.

Theo phương án được ưu tiên đặc biệt, Y là CH₂, mỗi R₁ đến R₅ là hydro và B là phenyl được thế bằng halogen một lần hoặc hai lần.

Sáng chế còn đề xuất hợp chất có công thức (XIXa)



trong đó

Y là O, C=O, hoặc CR₁₂R₁₃;

R₁, R₃, và R₄ độc lập với nhau, là hydro, halogen, xyano, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl,

B là phenyl được thế bằng một hoặc nhiều R₈,

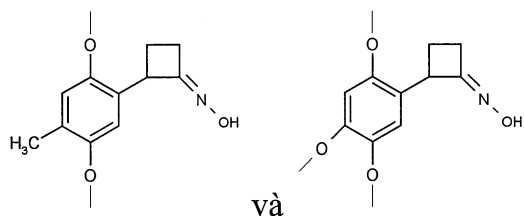
R₈, độc lập với nhau, là halogen, xyano hoặc nhóm -L-R₉, khi mỗi L độc lập với nhau là liên kết, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- hoặc CONR₇-,

n là 0, 1 hoặc 2,

R₇ là hydro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, benzyl hoặc phenyl, khi benzyl và phenyl không được thế hoặc được thế bằng halogen, xyano, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl,

R₉, độc lập với nhau, là C₁-C₆-alkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀, C₃-C₆-xycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀, C₆-C₁₄-bixycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀, C₂-C₆-alkenyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀, C₂-C₆-alkynyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀, phenyl, không được thế hoặc được thế bằng R₁₀, hoặc heteroaryl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R₁₀,

R₁₀, độc lập với nhau, là halogen, xyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-haloalkylthio, C₃-C₆-alkenyloxy, hoặc C₃-C₆-alkynyloxy, với điều kiện B và A-CO-NR₅ là cis với nhau trên vòng bốn cạnh; khi các hợp chất có công thức



bị loại trừ.

Theo một phương án ưu tiên, phân tử thể có công thức (I) được ưu tiên bất kỳ liên quan đến mỗi trong số B, Y, R₁, R₃, và R₄, cũng là phân tử thể được ưu tiên, độc lập với công thức (I), đối với công thức (XIXa) trong phạm vi B, Y, R₁, R₃, và R₄ tương ứng.

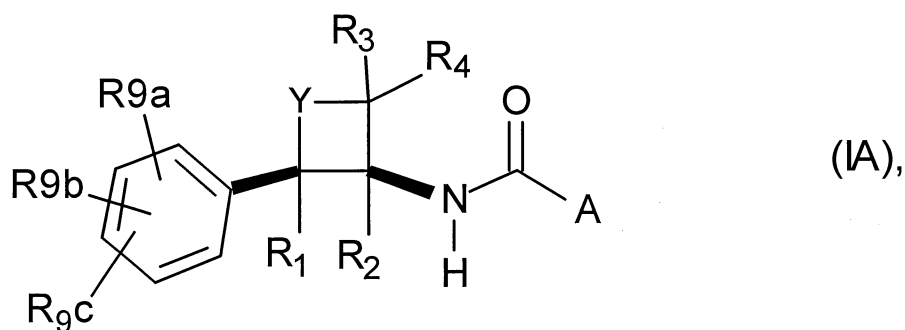
Đặc biệt là Y là CH₂, mỗi R₁, R₃ và R₄ là hydro và B là phenyl, được thể bằng từ 1 đến 3 phân tử thể, độc lập được chọn từ halogen, xyclopropyl, C1-C4-haloalkylxyclopropyl, C1-C4-haloalkyl và C1-C4-haloalkoxy.

Theo phương án cụ thể, Y là CH₂, mỗi R₁, R₃ và R₄ là hydro và B là phenyl được thể bằng từ 1 đến 3 phân tử thể, độc lập được chọn từ flo, clo, triflometyl, xyclopropyl, triflometyl xyclopropyl và triflometoxy.

Theo phương án được ưu tiên đặc biệt, Y là CH₂, mỗi R₁, R₃ và R₄ là hydro và B là phenyl được thể bằng halogen một lần hoặc hai lần.

Các bảng từ 1 đến 33: Các hợp chất có công thức IA

Sáng chế còn được minh họa bằng cách đề xuất các hợp chất có công thức (IA) riêng rẽ được liệt kê dưới đây trong các bảng từ 1 đến 33.



Mỗi trong số các bảng từ 1 đến 33, mà sau bảng Y dưới đây, đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} là phân tử thể được xác định trong bảng Y và A là phân tử thể được xác định trong bảng 1 đến 33 liên quan. Do đó, bảng 1 chỉ rõ 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó đối với mỗi dòng của bảng Y, phân tử thể A là như được xác định trong bảng 1; tương tự, bảng 2 chỉ rõ 163 hợp chất

có công thức (IA) trong đó đối với mỗi dòng của bảng Y, phần tử thế A là như được xác định trong bảng 2; và tương tự đối với các bảng 3 đến 33.

Bảng Y

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.001	CH ₂	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.002	CH ₂	Me	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.003	CH ₂	nPr	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.004	CH ₂	F	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.005	CH ₂	CN	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.006	CH ₂	CF ₃	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.007	CH ₂	H	Me	H	H	4-Cl	H	H
Y.008	CH ₂	H	nPr	H	H	4-Cl	H	H
Y.009	CH ₂	H	F	H	H	4-Cl	H	H
Y.010	CH ₂	H	CN	H	H	4-Cl	H	H
Y.011	CH ₂	H	CF ₃	H	H	4-Cl	H	H
Y.012	CH ₂	H	Me	Me	H	4-Cl	H	H
Y.013	CH ₂	H	nPr	nPr	H	4-Cl	H	H
Y.014	CH ₂	H	F	F	H	4-Cl	H	H
Y.015	CH ₂	H	CN	CN	H	4-Cl	H	H
Y.016	CH ₂	H	CF ₃	CF ₃	H	4-Cl	H	H
Y.017	CH ₂	H	H	H	Me	4-Cl	H	H
Y.018	CH ₂	H	H	H	nPr	4-Cl	H	H
Y.019	CH ₂	H	H	H	F	4-Cl	H	H
Y.020	CH ₂	H	H	H	CN	4-Cl	H	H
Y.021	CH ₂	H	H	H	CF ₃	4-Cl	H	H
Y.022	CHMe	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.023	CHnPr	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.024	CHF	H	H	H	H	4-Cl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.025	CHCN	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.026	CHCF ₃	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.027	CMe ₂	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.028	O	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.029	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	H	H
Y.030	CH ₂	H	H	H	H	4-OBn	H	H
Y.031	CH ₂	H	H	H	H	4-F	H	H
Y.032	CH ₂	H	H	H	H	4-OCHF ₂	H	H
Y.033	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-Br	H
Y.034	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-Cl	H
Y.035	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-Cl	H
Y.036	CH ₂	H	H	H	H	4-CF ₃	H	H
Y.037	CH ₂	H	H	H	H	3-F	4-Cl	H
Y.038	CH ₂	H	H	H	H	4-OCF ₃	H	H
Y.039	CH ₂	H	H	H	H	4-Br	H	H
Y.040	CH ₂	H	H	H	H	4-CN	H	H
Y.041	CH ₂	H	H	H	H	2-CF ₃	4-F	H
Y.042	CH ₂	H	H	H	H	2-Br	4-F	H
Y.043	CH ₂	H	H	H	H	4-SMe	H	H
Y.044	CH ₂	H	H	H	H	4-cPr	H	H
Y.045	CH ₂	H	H	H	H	4-S(O)Me	H	H
Y.046	CH ₂	H	H	H	H	4-S(O) ₂ Me	H	H
Y.047	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-F	H
Y.048	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-F	H
Y.049	CH ₂	H	H	H	H	4-(imidazol-1-yl)	H	H
Y.050	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-F	6-F
Y.051	CH ₂	H	H	H	H	4-methyl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.052	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl	H	H
Y.053	CH ₂	H	H	H	H	4-aryl	H	H
Y.054	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl	H	H
Y.055	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl)	H	H
Y.056	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl)	H	H
Y.057	CH ₂	H	H	H	H	4-metoxy	H	H
Y.058	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl-oxy	H	H
Y.059	CH ₂	H	H	H	H	4-aryloxy	H	H
Y.060	CH ₂	H	H	H	H	4-propargylox y	H	H
Y.061	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl)oxy	H	H
Y.062	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl)oxy	H	H
Y.063	CH ₂	H	H	H	H	4-metoxy-carbonyl	H	H
Y.064	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl-oxycarbonyl	H	H
Y.065	CH ₂	H	H	H	H	4-aryl-oxycarbonyl	H	H
Y.066	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl-oxycarbonyl	H	H
Y.067	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl)-oxycarbonyl	H	H
Y.068	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl)-oxycarbonyl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.069	CH ₂	H	H	H	H	4- methylamino	H	H
Y.070	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentylamino	H	H
Y.071	CH ₂	H	H	H	H	4-allylamino	H	H
Y.072	CH ₂	H	H	H	H	4- propargylamino	H	H
Y.073	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-chlorophenyl)- amino	H	H
Y.074	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dichloropyrid-2yl)- amino	H	H
Y.075	CH ₂	H	H	H	H	4-methyl-N- phenylamino	H	H
Y.076	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl-N- phenylamino	H	H
Y.077	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl-N- phenylamino	H	H
Y.078	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl-N- phenylamino	H	H
Y.079	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-chlorophenyl)-N- phenylamino	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.080	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo- pyrid-2yl) - N- phenylamin o	H	H
Y.081	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl-N- metylamino	H	H
Y.082	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl- N- metylamino	H	H
Y.083	CH ₂	H	H	H	H	4-alyl-N- metylamino	H	H
Y.084	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl- N- metylamino	H	H
Y.085	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo- phenyl) -N- metylamino	H	H
Y.086	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo- pyrid-2yl) - N- metylamino	H	H
Y.087	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl- aminocarbo nyl	H	H
Y.088	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl- aminocarbo nyl	H	H
Y.089	CH ₂	H	H	H	H	4-alyl- aminocarbo nyl	H	H
Y.090	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl- aminocarbo nyl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.091	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl) -aminocarbo-nyl	H	H
Y.092	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl) -aminocarbo-nyl	H	H
Y.093	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl-N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.094	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl-N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.095	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl-N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.096	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl-N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.097	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl) -N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.098	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl) -N-metyl-amino-carbonyl	H	H
Y.099	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl-aminosulfon-yl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.100	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl aminosulfon yl	H	H
Y.101	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl aminosulfon yl	H	H
Y.102	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl aminosulfon yl	H	H
Y.103	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl) aminosulfon yl	H	H
Y.104	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl) aminosulfon yl	H	H
Y.105	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl sulfon yl	H	H
Y.106	CH ₂	H	H	H	H	4-xyclopentyl sulfon yl	H	H
Y.107	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl sulfon yl	H	H
Y.108	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl sulfon yl	H	H
Y.109	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl) sulfon yl	H	H
Y.110	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl) sulfon yl	H	H
Y.111	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl sulfon ylami no	H	H

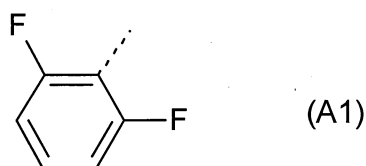
Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.112	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl sulfonylami no	H	H
Y.113	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl sulfonylami no	H	H
Y.114	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl sulfonylami no	H	H
Y.115	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo- phenyl) sulfonylami no	H	H
Y.116	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo- pyrid-2yl) sulfonylami no	H	H
Y.117	CH ₂	H	H	H	H	4-metyl sulfonyl-N- metylamino	H	H
Y.118	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl sulfonyl-N- metylamino	H	H
Y.119	CH ₂	H	H	H	H	4-allyl sulfonyl-N- metylamino	H	H
Y.120	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl sulfonyl-N- metylamino	H	H
Y.121	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo- phenyl) sulfonyl-N- metylamino	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.122	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo- pyrid-2yl) sulfonyl-N- methylamino	H	H
Y.123	CH ₂	H	H	H	H	4-axetoxy	H	H
Y.124	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentyl- carbonyloxy	H	H
Y.125	CH ₂	H	H	H	H	4- allylcarbonyl -oxy	H	H
Y.126	CH ₂	H	H	H	H	4-propargyl- carbonyloxy	H	H
Y.127	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo- phenyl) carbonyloxy	H	H
Y.128	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclo- pyrid-2yl) carbonyloxy	H	H
Y.129	CH ₂	H	H	H	H	4-axetamido	H	H
Y.130	CH ₂	H	H	H	H	4- xyclopentylc ar- bonylamino	H	H
Y.131	CH ₂	H	H	H	H	4- allylcarbonyl -amino	H	H
Y.132	CH ₂	H	H	H	H	4- propargylcar -bonylamino	H	H
Y.133	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clo- phenyl) carbonylami no	H	H

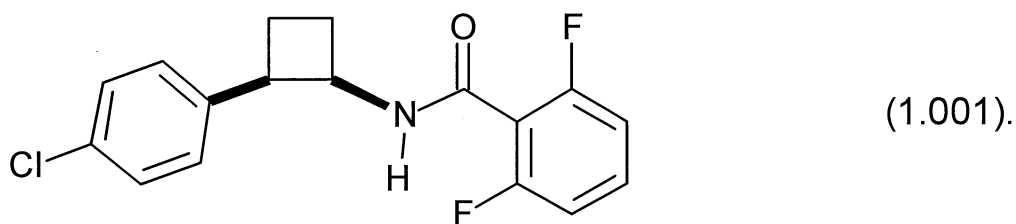
Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.134	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-diclopyrid-2yl) carbonylami no	H	H
Y.136	O	H	H	H	H	2-Cl	H	H
Y.137	O	H	H	H	H	4-OBn	H	H
Y.138	O	H	H	H	H	4-F	H	H
Y.139	O	H	H	H	H	4-OCHF ₂	H	H
Y.140	O	H	H	H	H	2-Cl	4-Br	H
Y.141	O	H	H	H	H	2-Cl	4-Cl	H
Y.142	O	H	H	H	H	2-F	4-Cl	H
Y.143	O	H	H	H	H	4-CF ₃	H	H
Y.144	O	H	H	H	H	3-F	4-Cl	H
Y.145	O	H	H	H	H	4-OCF ₃	H	H
Y.146	O	H	H	H	H	4-Br	H	H
Y.147	O	H	H	H	H	4-CN	H	H
Y.148	O	H	H	H	H	2-CF ₃	4-F	H
Y.149	O	H	H	H	H	2-Br	4-F	H
Y.150	O	H	H	H	H	4-SMe	H	H
Y.151	O	H	H	H	H	4-cPr	H	H
Y.152	O	H	H	H	H	4-S(O)Me	H	H
Y.153	O	H	H	H	H	4-S(O) ₂ Me	H	H
Y.154	O	H	H	H	H	2-F	4-F	H
Y.155	O	H	H	H	H	2-Cl	4-F	H
Y.156	O	H	H	H	H	4-(imidazol-1-yl)	H	H
Y.157	O	H	H	H	H	2-F	4-F	6-F
Y.158	O	H	H	H	H	4-metyl	H	H

Hợp chất số	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.159	O	H	H	H	H	4-xyclopentyl	H	H
Y.160	O	H	H	H	H	4-allyl	H	H
Y.161	O	H	H	H	H	4-propargyl	H	H
Y.162	O	H	H	H	H	4-(4-clo-phenyl)	H	H
Y.163	O	H	H	H	H	4-(3,5-diclo-pyrid-2yl)	H	H

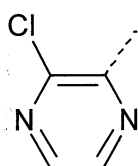
Bảng 1 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA), trong đó A là



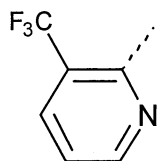
(2,6-diflophenyl) trong đó nét đứt biểu thị điểm gắn của nhóm A với nhóm amit, và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y. Ví dụ, hợp chất 1.001 có cấu trúc sau đây:



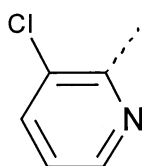
Bảng 2 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-clo-2-pyrazinyl (A2) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



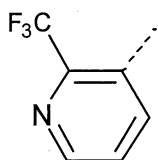
Bảng 3 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-triflometyl-2-pyridyl (A3) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



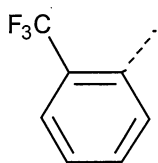
Bảng 4 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-clo-2-pyridyl (A4) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



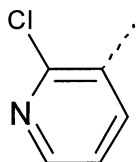
Bảng 5 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-triflometyl-3-pyridyl (A5) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



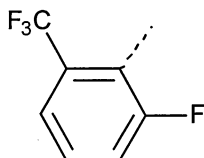
Bảng 6 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-triflometyl-phenyl (A6) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



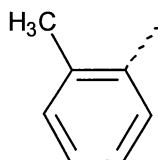
Bảng 7 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-clo-3-pyridyl (A7) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



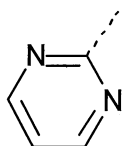
Bảng 8 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-flo-6-triflometyl-phenyl (A8) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



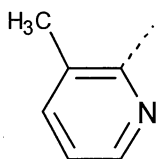
Bảng 9 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-tolyl (A9) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



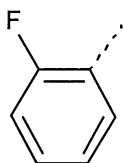
Bảng 10 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-pyrimidinyl (A10) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



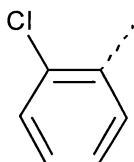
Bảng 11 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-metyl-2-pyridyl (A11) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



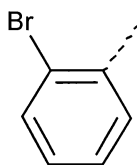
Bảng 12 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-flophenyl (A12) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



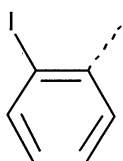
Bảng 13 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-clophenyl (A13) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



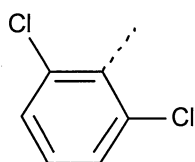
Bảng 14 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-bromophenyl (A14) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



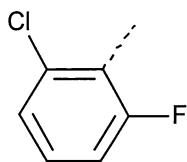
Bảng 15 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-iodophenyl (A15) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



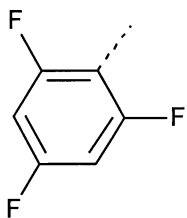
Bảng 16 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2,6-diclophenyl (A16) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



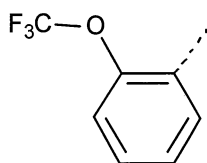
Bảng 17 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-clo-6-flo-phenyl (A17) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



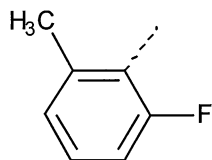
Bảng 18 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2,4,6-triflophenyl (A18) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



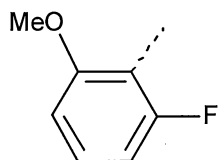
Bảng 19 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-triflometoxyphenyl (A19) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



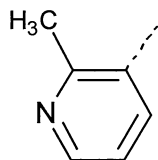
Bảng 20 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-fluoro-6-methylphenyl (A20) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



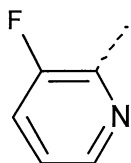
Bảng 21 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-fluoro-6-methoxyphenyl (A21) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



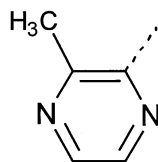
Bảng 22 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-methyl-3-pyridyl (A22) và R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



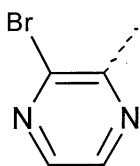
Bảng 23 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-flo-2-pyridyl (A23) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



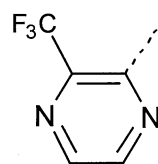
Bảng 24 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-metyl-2-pyrazinyl (A24) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



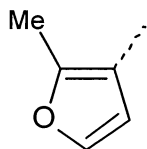
Bảng 25 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-bromo-2-pyrazinyl (A25) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



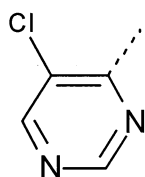
Bảng 26 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-triflometyl-2-pyrazinyl (A26) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



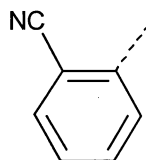
Bảng 27 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-metyl-3-furyl (A27) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



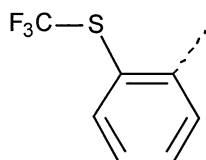
Bảng 28 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 5-clo-4-pyrimidinyl (A28) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



Bảng 29 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-xyanophenyl (A29) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.

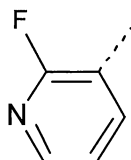


Bảng 30 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-triflometylthiophenyl (A30) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng

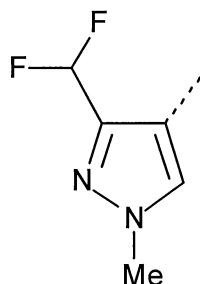


của bảng Y.

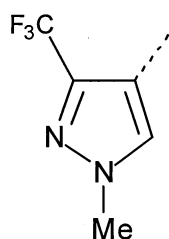
Bảng 31 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 2-fluoro-3-pyridyl (A31) và Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



Bảng 32 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-(diflometyl)-1-methyl-pyrazol-4-yl (A32) và R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



Bảng 33 đề xuất 163 hợp chất có công thức (IA) trong đó A là 3-(triflometyl)-1-methyl-pyrazol-4-yl (A33) và R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} và R_{9c} như được xác định trong mỗi dòng của bảng Y.



Các ví dụ về công thức (II) được đề xuất là các ví dụ trong đó phần tử thế B, Y, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 và R_5 trong công thức (II) tương ứng với mỗi dòng của bảng Y đã nêu trong phạm vi của công thức (Ia). Ví dụ, hợp chất có công thức (II) trong phạm vi của dòng Y.001 có thể là B là 4-clo phenyl; Y là CH_2 ; và mỗi R_1 đến R_5 là hydro.

Các ví dụ về công thức (XIXa) có sẵn là các ví dụ trong đó phần tử thế B, Y, R_1 , R_2 , R_3 , và R_4 trong công thức (XIXa) tương ứng với mỗi dòng của Bảng Y đã nêu trong phạm vi của công thức (Ia). Ví dụ, hợp chất có công thức (XIXa) trong phạm vi của dòng Y.001 có thể là B là 4-clo phenyl; Y là CH_2 ; và mỗi R_1 đến R_4 là hydro.

Hợp chất có công thức (I) được biết là kiểm soát thiệt hại gây ra bởi loài gây hại và/hoặc nấm.

Theo một phương án, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng trong nông nghiệp.

Theo đó, sáng chế còn đề cập đến phương pháp kiểm soát thiệt hại và/hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/hoặc nấm phương pháp này bao gồm việc áp dụng lên loài gây hại, nơi cư trú của loài gây hại, hoặc thực vật dễ bị tấn công bởi loài gây hại

và/hoặc nấm hoặc vật liệu nhân giống cây lương có hiệu quả của hợp chất có công thức (I).

Các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng để kiểm soát, tức là chứa hoặc phá hủy, loài gây hại và/hoặc nấm, mà xuất hiện cụ thể là trên cây, đặc biệt là cây có ích và cây cảnh trong nông nghiệp, trong nghề làm vườn và trong lâm nghiệp, hoặc trên các cơ quan, như quả, hoa, lá, thân, thân củ, hạt hoặc rễ, của cây này, và trong một số trường hợp cả các cơ quan của cây mà được tạo thành ở thời điểm sau vẫn được bảo vệ kháng các loài gây hại này.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế là hoạt chất có giá trị phòng ngừa và/hoặc chữa bệnh trong lĩnh vực kiểm soát loài gây hại, thậm chí ở các tỷ lệ sử dụng thấp, mà có thể được sử dụng chống các loài gây hại và nấm kháng chất diệt loài gây hại, trong đó các hợp chất có công thức (I) có phổ diệt sinh vật rất có ích và được dung nạp tốt bởi các loài động vật máu nóng, cá và cây.

Các hợp chất theo sáng chế có thể hoạt động kháng toàn bộ hoặc từng giai đoạn phát triển riêng của các loài gây hại trên động vật nhạy cảm thông thường, cả các loài gây hại trên động vật có sức đề kháng, như côn trùng hoặc các đại diện của bộ ve bét. Hoạt tính diệt côn trùng hoặc ve bét của các hợp chất theo sáng chế có thể tự nó trực tiếp thể hiện, cụ thể là trong việc tiêu diệt các loài gây hại, mà có tác dụng hoặc là ngay lập tức hoặc chỉ sau qua một ít thời gian, ví dụ trong quá trình lột xác, hoặc không trực tiếp, ví dụ làm giảm tỷ lệ đẻ trứng và/hoặc chần nuôi, hoạt tính tốt tương ứng với tỷ lệ tiêu diệt (tỷ lệ chết) bằng ít nhất 50 đến 60%.

Đối với các mục đích thực tế, hiện tại đã phát hiện ra rằng các hợp chất có công thức I có phổ hoạt tính rất có lợi để bảo vệ động vật và cây có ích kháng sự tấn công và thiệt hại do giun tròn. Theo đó, sáng chế còn đề xuất chế phẩm diệt giun tròn chứa các hợp chất theo sáng chế, như công thức (I).

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt là hữu dụng để kiểm soát giun tròn. Do đó, theo khía cạnh khác, sáng chế còn đề cập đến phương pháp kiểm soát thiệt hại cho cây và các bộ phận của chúng bởi giun tròn ký sinh trên cây (giun tròn nội ký sinh, giun tròn bán nội ký sinh và giun tròn ngoại ký sinh), đặc biệt là giun tròn ký sinh trên cây như giun nốt rễ, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* và các loài *Meloidogyne* khác; giun tạo nang, *Globodera rostochiensis* và các loài *Globodera* khác; *Heterodera avenae*, *Heterodera*

glycines, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, và các loài *Heterodera* khác; Giun tạo mụn ở hạt, các loài *Anguina*; giun tròn hại lá và cành, các loài *Aphelenchoides*; giun Sting, *Eelonolaimus longicaudatus* và các loài *Belonolaimus* khác; Giun ở cây thông, *Bursaphelenchus xylophilus* và các loài *Bursaphelenchus* khác; giun móc, các loài *Criconema*, các loài *Criconemella*, các loài *Criconemoides*, các loài *Mesocriconema*; Giun hại thân và củ, tuyến trùng hại củ, *Ditylenchus dipsaci* và các loài *Ditylenchus* khác; Giun kim, các loài *Dolichodorus*; giun xoắn, *Heliocotylenchus multicinctus* và các loài *Helicotylenchus* khác; giun ống và sheathoid, các loài *Hemicycliophora* và các loài *Hemicriconemoides*; các loài *Hirshmanniella*; giun chỉ, các loài *Hoploaimus*; giun nốt rỗ giả, các loài *Nacobbus*; Giun tròn hại lá kim, *Longidorus elongatus* và các loài *Longidorus* khác; Giun ống, các loài *Pratylenchus*; giun tròn gây thương tổn, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* và các loài *Pratylenchus* khác; giun tròn Burrowing, *Radopholus similis* và các loài *Radopholus* khác; giun tròn tái tạo hình, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* và các loài *Rotylenchus* khác; các loài *Scutellonema*; giun hại gốc cây, *Trichodorus primitivus* và các loài *Trichodorus* khác, các loài *Paratrichodorus*; giun cần, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* và các loài *Tylenchorhynchus* khác; giun tròn hại họ cam quýt, các loài *Tylenchulus*; giun găm, các loài *Xiphinema*; và các loài giun tròn ký sinh trên cây khác, như *Subanguina spp.*, *Hypsoperine spp.*, *Macroposthonia spp.*, *Melinius spp.*, *Punctodera spp.*, và *Quinisulcius spp.*.

Cụ thể là, các loài giun tròn *Meloidogyne spp.*, *Heterodera spp.*, *Rotylenchus spp.* và *Pratylenchus spp.* có thể được kiểm soát bởi các hợp chất theo sáng chế.

Các ví dụ về loài gây hại động vật là:

- bộ ve bét, ví dụ,

Acalitus spp., *Aculus spp.*, *Acaricalus spp.*, *Aceria spp.*, *Acarus siro*, *Amblyomma spp.*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia spp.*, *Calipitrimerus spp.*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides spp.*, *Eotetranychus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Hemitarsonemus spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Olygonychus spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Polyphagotarsonema latus*, *Panonychus spp.*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Phytonemus spp.*, *Polyphagotarsonemus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus*

spp., *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Steneotarsonemus spp.*, *Tarsonemus spp.* và *Tetranychus spp.*;

- bộ chấy rận, ví dụ,

Haematopinus spp., *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Pemphigus spp.* và *Phylloxera spp.*;

- bộ cánh cứng, ví dụ,

Agriotes spp., *Amphimallon majale*, *Anomala orientalis*, *Anthonomus spp.*, *Aphodius spp.*, *Astylus atromaculatus*, *Ataenius spp.*, *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cerotoma spp.*, *Conoderus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Cotinis nitida*, *Curculio spp.*, *Xyclocephala spp.*, *Dermestes spp.*, *Diabrotica spp.*, *Diloboderus abderus*, *Epilachna spp.*, *Eremnus spp.*, *Heteronychus arator*, *Hypothenemus hampei*, *Lagria vilosa*, *Leptinotarsa decemLineata*, *Lissorhoptrus spp.*, *Liogenys spp.*, *Maecolaspis spp.*, *Maladera castanea*, *Megascelis spp.*, *Melighetes aeneus*, *Melolontha spp.*, *Myochrous armatus*, *Orycaephilus spp.*, *Otiorhynchus spp.*, *Phyllophaga spp.*, *Phlyctinus spp.*, *Popillia spp.*, *Psylliodes spp.*, *Rhyssomatus aubtilis*, *Rhizopertha spp.*, *Scarabeidae*, *Sitophilus spp.*, *Sitotroga spp.*, *Somaticus spp.*, *Sphenophorus spp.*, *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio spp.*, *Tribolium spp.* và *Trogoderma spp.*;

- bộ hai cánh, ví dụ,

Aedes spp., *Anopheles spp.*, *Antherigona soccata*, *Bactrocea oleae*, *Bibio hortulanus*, *Bradysia spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Culex spp.*, *Cuterebra spp.*, *Dacus spp.*, *Delia spp.*, *Drosophila melanogaster*, *Fannia spp.*, *Gastrophilus spp.*, *Geomyza tripunctata*, *Glossina spp.*, *Hypoderma spp.*, *Hyppobosca spp.*, *Liriomyza spp.*, *Lucilia spp.*, *Melanagromyza spp.*, *Musca spp.*, *Oestrus spp.*, *Orseolia spp.*, *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia spp.*, *Rhagoletis spp.*, *Rivelia quadrifasciata*, *Scatella spp.*, *Sciara spp.*, *Stomoxys spp.*, *Tabanus spp.*, *Tannia spp.* và *Tipula spp.*;

- bộ cánh nửa, ví dụ,

Acanthocoris scabrator, *Acrosternum spp.*, *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathypoelia thalassina*, *Blissus spp.*, *Cimex spp.*, *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades spp.*, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus spp.*, *Edessa spp.*, *Euchistus spp.*, *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster spp.*, *Halyomorpha halys*, *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa spp.*, *Lygus spp.*, *Margarodes spp.*, *Murgantia*

histrionic, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp., *Thyanta* spp, *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*;

- bộ cánh đều, ví dụ,

Acyrtosium pisum, *Adalges* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., Giống rệp vừngidae, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii* Scop., *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes* spp, *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp, *Trioza erythrae*, *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*, *Zyginidia scutellaris*, ;

- bộ cánh màng, ví dụ,

Acromyrmex, *Arge* spp, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp, *Slenopsis invicta*, *Solenopsis* spp. và *Vespa* spp.;

- bộ cánh bằng, ví dụ,

Coptotermes spp, *Cornitermes cumulans*, *Incisitermes spp*, *Macrotermes spp*, *Mastotermes spp*, *Microtermes spp*, *Reticulitermes spp.*; *Solenopsis geminata*

- bộ cánh vảy, ví dụ,

Acleris spp., *Adoxophyes spp.*, *Aegeria spp.*, *Agrotis spp.*, *Alabama argillaceae*, *Amylois spp.*, *Anticarsia gemmatilis*, *Archips spp.*, *Argyresthia spp*, *Argyrotaenia spp.*, *Autographa spp.*, *Bucculatrix thurberiella*, *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo spp.*, *Choristoneura spp.*, *Chrysoteuchia topiaria*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis spp.*, *Cnephasia spp.*, *Cochylis spp.*, *Coleophora spp.*, *Colias lesbia*, *Cosmophila flava*, *Crambus spp*, *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydalima perspectalis*, *Cydia spp.*, *Diaphania perspectalis*, *Diatraea spp.*, *Diparopsis castanea*, *Earias spp.*, *Eldana saccharina*, *Ephestia spp.*, *Epinotia spp*, *Estigmene acrea*, *Etiella zinckinella*, *Eucosma spp.*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis spp.*, *Euxoa spp.*, *Feltia jaculiferia*, *Grapholita spp.*, *Hedya nubiferana*, *Heliothis spp.*, *Hellula undalis*, *Herpetogramma spp*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Lasmopalpus lignosellus*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis spp.*, *Lobesia botrana*, *Loxostege bifidalis*, *Lymantria spp.*, *Lyonetia spp.*, *Malacosoma spp.*, *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Mythimna spp*, *Noctua spp*, *Operophtera spp.*, *Orniodes indica*, *Ostrinia nubilalis*, *Pammene spp.*, *Pandemis spp.*, *Panolis flammea*, *Papaipema nebris*, *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera cà phêlla*, *Pseudaletia unipuncta*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris spp.*, *Plutella xylostella*, *Prays spp.*, *Pseudoplusia spp*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Scirpophaga spp.*, *Sesamia spp.*, *Sparganothis spp.*, *Spodoptera spp.*, *Sylepta derogate*, *Synanthedon spp.*, *Thaumatopoea spp.*, *Tortrix spp.*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, và *Yponomeuta spp.*;

- bộ ăn lông, ví dụ,

Damalinea spp. và *Trichodectes spp.*;

- bộ cánh thẳng, ví dụ,

Blatta spp., *Blattella spp.*, *Gryllotalpa spp.*, *Leucophaea maderae*, *Châu châu spp.*, *Neocurtilla hexadactyla*, *Periplaneta spp.*, *Scapteriscus spp.*, và *Schistocerca spp.*;

- bộ rệp sáp, ví dụ,

Liposcelis spp.;

- bộ *bọ chét*, ví dụ,

Ceratophyllus spp., *Ctenocephalides spp.* và *Xenopsylla cheopis*;

- bộ *cánh tơ*, ví dụ,

Calliothrips phaseoli, *Frankliniella spp.*, *Heliothrips spp.*, *Hercinothrips spp.*, *Parthenothrips spp.*, *Scirtothrips aurantii*, *Sericothrips variabilis*, *Taeniothrips spp.*, *Thrips spp.*;

- bộ *Thysanura*, ví dụ,

Lepisma saccharina.

Theo khía cạnh khác, sáng chế cũng có thể đề cập đến phương pháp kiểm soát hoặc phòng ngừa sự tàn phá cây có ích bởi các vi sinh vật gây bệnh thực vật, trong đó hợp chất có công thức (I) được sử dụng làm hoạt chất lên cây, các bộ phận của chúng hoặc địa điểm của chúng. Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế khác biệt bởi hoạt tính, sự dung nạp tốt của cây và tính an toàn đối với môi trường. Chúng có các đặc tính chữa bệnh, phòng bệnh và ngấm thuốc và rất hữu dụng và được sử dụng để bảo vệ nhiều cây có ích. Các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để ức chế hoặc tiêu diệt các bệnh trên cây hoặc các bộ phận của cây (quả, hoa, lá, cành, thân củ, rễ) của các cây có ích khác nhau, trong khi ở cùng thời điểm bảo vệ cả các bộ phận này của cây sẽ lớn lên sau đó ví dụ khỏi vi sinh vật gây bệnh thực vật. Cũng có thể sử dụng các hợp chất có công thức (I) làm chất bao để xử lý vật liệu nhân giống cây, cụ thể là hạt (quả, thân củ, hạt) và cành giâm (ví dụ lúa), để bảo vệ chống sự phá hoại của nấm cũng như chống nấm gây bệnh thực vật có ở trong đất.

Các ví dụ về nấm bao gồm: Nấm bắt toàn (ví dụ *Botrytis*, *Pyricularia*, *Helminthosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora* và *Alternaria*); nấm đảm (ví dụ *Rhizoctonia*, *Hemileia*, *Puccinia*); các lớp nấm nang (ví dụ *Venturia* và *Erysiphe*, *Podosphaera*, *Monilinia*, *Uncinula*); các lớp nấm noãn (ví dụ *Phytophthora*, *Pythium*, *Plasmopara*); nấm tiếp hợp (ví dụ, *Rhizopus spp.*); họ *Phakopsoraceae*, cụ thể là các loài của chi *Phakopsora*, ví dụ *Phakopsora pachyrhizi*, mà được gọi là nấm gây bệnh gỉ sắt đậu tương châu Á, và các loài thuộc họ *Pucciniaceae*, cụ thể là các loài thuộc chi *Puccinia* như *Puccinia graminis*, còn được gọi là nấm gây bệnh gỉ sắt ở cành hoặc nấm gây bệnh đốm đen, là vấn nạn của các cây ngũ cốc và *Puccinia recondita*, còn gọi là nấm gây bệnh đốm nâu.

Trong số các cây và các bệnh có thể ở các cây này được bảo vệ bởi phương pháp theo sáng chế, có thể kể ra:

- lúa mỳ, khi kiểm soát các bệnh ở hạt sau đây: bệnh héo vàng (*Microdochium nivale* và *Fusarium roseum*), bệnh than đen (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* hoặc *Tilletia indica*), bệnh đốm lá (*Septoria nodorum*) và bệnh nấm than xốp;
- lúa mỳ, khi kiểm soát các bệnh của các bộ phận trên mặt đất của cây sau đây: bệnh đốm mắt trên ngũ cốc (*Tapesia yallundae*, *Tapesia acuiformis*), bệnh (*Gaeumannomyces graminis*), bệnh cháy gốc (*F. culmorum*, *F. graminearum*), bệnh đốm đen (*Rhizoctonia cerealis*), bệnh phấn trắng (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), bệnh rỉ sắt (*Puccinia striiformis* và *Puccinia recondita*) và bệnh đốm lá (*Septoria tritici* và *Septoria nodorum*);
- lúa mỳ và lúa mạch, khi kiểm soát các bệnh do vi khuẩn và virus, ví dụ bệnh khảm vàng trên lúa mạch; - lúa mạch, khi kiểm soát các bệnh ở hạt sau đây: bệnh đốm vùng (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* và *Cochliobolus sativus*), bệnh nấm than xốp (*Ustilago nuda*) và bệnh héo vàng (*Microdochium nivale* và *Fusarium roseum*);
- lúa mạch, khi kiểm soát các bệnh của các bộ phận trên mặt đất của cây sau đây: bệnh đốm mắt trên ngũ cốc (*Tapesia yallundae*), bệnh đốm vùng (*Pyrenophora teres* và *Cochliobolus sativus*), bệnh phấn trắng (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), bệnh lùn sọc lá (*Puccinia hordei*) và bệnh đốm lá (*Rhynchosporium secalis*);
- khoai tây, khi kiểm soát các bệnh ở thân củ (cụ thể là *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), bệnh nấm (*Platyophthora infestans*) và một số virus (virus Y);
- khoai tây, khi kiểm soát các bệnh ở lá: bệnh úa sớm (*Alternaria solani*), bệnh nấm (*Phytophthora infestans*);
- bông, khi kiểm soát các bệnh sau đây của cây non nảy mầm từ hạt: ngập úng và bệnh đốm vòng (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*) và đốm rễ đen (*Thielaviopsis basicola*);
- cây cho protein, ví dụ đậu Hà Lan, khi kiểm soát các bệnh ở hạt sau đây: bệnh thán thư (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), bệnh héo vàng (*Fusarium oxysporum*), bệnh mốc nâu (*Botrytis cinerea*) và bệnh nấm (*Peronospora pisi*);
- cây cho dầu, ví dụ cây cải dầu, khi kiểm soát các bệnh ở hạt sau đây: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* và *Sclerotinia sclerotiorum*;

- ngô, khi kiểm soát các bệnh sau đây: (*Rhizopus sp.*, *Penicillium sp.*, [0104]*Trichoderma sp.*, *Aspergillus sp.*, và *Gibberella fujikuroi*);
- cây lanh, khi kiểm soát các bệnh ở hạt sau đây: *Alternaria linicola*;
- cây lâm nghiệp, khi kiểm soát ngập úng (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);
- lúa, khi kiểm soát các bệnh sau đây của các bộ phận trên mặt đất: bệnh tàn (*Magnaporthe grisea*), bệnh đốm màng viền (*Rhizoctonia solani*);
- cây họ đậu, khi kiểm soát các bệnh sau đây của hạt hoặc của cây non nảy mầm từ hạt: ngập úng và bệnh đốm vòng (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium sp.*);
- cây họ đậu, khi kiểm soát các bệnh sau đây của các bộ phận trên mặt đất: bệnh mốc xám (*Botrytis sp.*), bệnh phần trắng (cụ thể là *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* và *Leveillula taurica*), bệnh héo vàng (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), đốm lá (*Cladosporium sp.*), đốm vòng cà chua (*Alternaria sp.*), bệnh thán thư (*Colletotrichum sp.*), đốm lá cà chua (*Septoria sp.*), bệnh đốm đen (*Rhizoctonia solani*), bệnh nấm (ví dụ *Bremia lactucae*, *Peronospora sp.*, *Pseudoperonospora sp.*, *Phytophthora sp.*);
- cây ăn quả, đối với các bệnh của các bộ phận trên mặt đất: bệnh thối quả (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), bệnh nấm vảy (*Venturia inaequalis*), bệnh phần trắng (*Podosphaera leucotricha*); - nho, đối với các bệnh của lá: cụ thể là bệnh mốc nâu (*Botrytis cinerea*), bệnh phần trắng (*Uncinula necator*), đốm đen (*Guignardia biwelli*) và bệnh nấm (*Plasmopara viticola*);
- củ cải đường, đối với các bệnh sau đây của các bộ phận trên mặt đất: bệnh bạc lá (*Cercospora beticola*), bệnh phần trắng (*Erysiphe beticola*), đốm lá (*Ramularia beticola*).

Chế phẩm diệt nấm theo sáng chế còn có thể được sử dụng để chống các bệnh nấm có thể phát triển trên hoặc trong gỗ. Thuật ngữ "gỗ" nghĩa là tất cả các loại gỗ, và tất cả các dạng gia công của gỗ dùng để xây dựng, ví dụ gỗ cứng, gỗ mật độ cao, ván ép, và gỗ dán. Phương pháp xử lý gỗ theo sáng chế chủ yếu bao gồm việc cho tiếp xúc một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, hoặc chế phẩm theo sáng chế; phương pháp này bao gồm ví dụ sử dụng trực tiếp, phun, nhúng, tiêm hoặc các phương pháp thích hợp bất kỳ khác.

Các hợp chất theo sáng chế hiệu quả để kiểm soát giun tròn, côn trùng, các loài gây hại ve bét và/hoặc các bệnh thực vật do nấm của các cây nông nghiệp, cả khi trồng và thu hoạch, khi sử dụng riêng, chúng còn có thể được dùng kết hợp với các hoạt chất sinh học khác được dùng trong nông nghiệp, như một hoặc nhiều chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, chất diệt ve bét, chất diệt nấm, chất diệt vi khuẩn, chất kích thích thực vật, chất diệt động vật thân mềm, và pheromon (hoá học hoặc sinh học). Việc trộn các hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm của chúng dưới dạng sử dụng làm chất diệt loài gây hại với các chất diệt loài gây hại khác thường tạo ra phổ hoạt động diệt loài gây hại rộng hơn. Ví dụ, các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được sử dụng một cách hiệu quả chung hoặc kết hợp với các hợp chất pyrethroid, neonicotinoid, phân tử vòng lớn, diamit, phosphat, carbamat, xyclodien, formamidin, phenol thiếc, hydrocacbon clo hoá, benzoylphenyl ure, pyrol và tương tự.

Hoạt tính của các chế phẩm theo sáng chế có thể mở rộng đáng kể, và thích hợp với hoàn cảnh hiện hành, bằng cách thêm, ví dụ, một hoặc nhiều hoạt chất diệt côn trùng, diệt loài gây hại thân mềm, diệt giun tròn và/hoặc diệt nấm. Các kết hợp của các hợp chất có công thức (I) với hoạt chất diệt côn trùng, diệt loài gây hại thân mềm, diệt giun tròn và/hoặc diệt nấm có thể còn có hiệu quả bất ngờ nữa mà có thể được mô tả, theo nghĩa rộng hơn, là hoạt tính hiệp đồng. Ví dụ, cây dung nạp tốt hơn, tính độc đối với thực vật giảm, loài gây hại hoặc nấm có thể được kiểm soát trong các giai đoạn phát triển khác nhau hoặc tính năng tốt hơn trong quá trình sản xuất chúng, ví dụ trong khi nghiền hoặc trộn, trong khi lưu trữ hoặc sử dụng chúng.

Danh mục chất diệt loài gây hại sau đây mà các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng cùng với chúng, là nhằm minh họa các kết hợp có thể bằng cách ví dụ.

Các kết hợp sau đây của các hợp chất có công thức (I) với các hợp chất hoạt tính khác được ưu tiên (từ viết tắt “TX” nghĩa là “một hợp chất được chọn từ 163 hợp chất của mỗi một trong số các bảng từ 1 đến 33 của sáng chế”:

tá được được chọn từ nhóm các chất có chứa dầu mỏ (tên gọi khác) (628) + TX, chất diệt ve bét được chọn từ nhóm các chất bao gồm 1,1-bis(4-clophenyl)-2-etoxyetanol (tên theo IUPAC) (910) + TX, 2,4-diclophenyl benzensulfonat (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-flo-*N*-metyl-*N*-1-naphthylaxetamit (tên theo IUPAC) (1295) + TX, 4-clophenyl phenyl sulfon (tên theo IUPAC) (981) + TX, abamectin (1) + TX, axequinoxyl (3) + TX, axetoprol [CCN] + TX, acrinathrin (9) +

TX, aldicarb (16) + TX, aldoxycarb (863) + TX, alpha-xypermethrin (202) + TX, amitithion (870) + TX, amitoflumet [CCN] + TX, amitothioat (872) + TX, amiton (875) + TX, amiton hydro oxalat (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramit (881) + TX, arsen oxit (882) + TX, AVI 382 (mã hợp chất) + TX, AZ 60541 (mã hợp chất) + TX, azinphos-etyl (44) + TX, azinphos-metyl (45) + TX, azobenzen (tên theo IUPAC) (888) + TX, azoxyclostin (46) + TX, azothoat (889) + TX, benomyl (62) + TX, benoxafos (tên gọi khác) [CCN] + TX, benzoximat (71) + TX, benzyl benzoat (tên theo IUPAC) [CCN] + TX, bifenazat (74) + TX, bifenthrin (76) + TX, binapacryl (907) + TX, brofenvalerat (tên gọi khác) + TX, bromoxycloen (918) + TX, bromophos (920) + TX, bromophos-etyl (921) + TX, bromopropylat (94) + TX, buprofezin (99) + TX, butocacboxim (103) + TX, butoxycacboxim (104) + TX, butylpyridaben (tên gọi khác) + TX, canxi polysulfua (tên theo IUPAC) (111) + TX, campheclo (941) + TX, propylat (943) + TX, carbaryl (115) + TX, cacbofuran (118) + TX, cacbophenothion (947) + TX, CGA 50'439 (mã mở rộng) (125) + TX, chinomethionat (126) + TX, clobensit (959) + TX, clodimeform (964) + TX, clodimeform hydroclorua (964) + TX, clofenapyr (130) + TX, clofenethol (968) + TX, clofenson (970) + TX, clofensulphit (971) + TX, clofenvinphos (131) + TX, clobenzilat (975) + TX, clomebuform (977) + TX, clomethiuron (978) + TX, clopropylat (983) + TX, clopyrifos (145) + TX, clopyrifos-metyl (146) + TX, clothiophos (994) + TX, xinerin I (696) + TX, xinerin II (696) + TX, xinerin (696) + TX, clofentezin (158) + TX, closantel (tên gọi khác) [CCN] + TX, coumaphos (174) + TX, crotamiton (tên gọi khác) [CCN] + TX, crotoxyphos (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, xyanthoat (1020) + TX, xyflumetofen (Số đăng ký CAS: 400882-07-7) + TX, xyhalothrin (196) + TX, xyhexatin (199) + TX, xypermethrin (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demephion (1037) + TX, demephion-O (1037) + TX, demephion-S (1037) + TX, demeton (1038) + TX, demeton-metyl (224) + TX, demeton-O (1038) + TX, demeton-O-metyl (224) + TX, demeton-S (1038) + TX, demeton-S-metyl (224) + TX, demeton-S-metylsulphon (1039) + TX, diafenthiuron (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diazinon (227) + TX, dichlofluanid (230) + TX, dichlorvos (236) + TX, dicliphos (tên gọi khác) + TX, dixofol (242) + TX, dicrotophos (243) + TX, dienochlor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimethoat (262) + TX, dinactin (tên gọi khác) (653) + TX, dinex (1089) + TX,

dinex-diclexin (1089) + TX, dinobuton (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinoceton (1090) + TX, dinopenton (1092) + TX, dinosulfon (1097) + TX, dinoterbon (1098) + TX, dioxathion (1102) + TX, diphenyl sulfon (tên theo IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (tên gọi khác) [CCN] + TX, disulfoton (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapyn (1113) + TX, doramectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, endosulfan (294) + TX, endothion (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, ethion (309) + TX, ethoat-metyl (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfos (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquin (328) + TX, fenbutatin oxit (330) + TX, fenothiocarb (337) + TX, fenpropathrin (342) + TX, fenpyrad (tên gọi khác) + TX, fenpyroximat (345) + TX, fenson (1157) + TX, fentrifanil (1161) + TX, fenvalerat (349) + TX, fipronil (354) + TX, fluacrypyrim (360) + TX, fluazuron (1166) + TX, flubenzimin (1167) + TX, fluxycloxuron (366) + TX, fluxythrinate (367) + TX, fluenetil (1169) + TX, flufenoxuron (370) + TX, flumethrin (372) + TX, fluorbenside (1174) + TX, flupyradifuron + TX, fluvalinat (1184) + TX, FMC 1137 (mã mở rộng) (1185) + TX, formetanat (405) + TX, formetanat hydroclorua (405) + TX, formothion (1192) + TX, formparanat (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, glyodin (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenophos (432) + TX, hexadexyl xyclopropanecarboxylat (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexythiazox (441) + TX, iodometan (tên theo IUPAC) (542) + TX, isocarbophos (tên gọi khác) (473) + TX, isopropyl *O*-(metoxyaminothiophosphoryl)salixylat (tên theo IUPAC) (473) + TX, ivermectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, jasmolin I (696) + TX, jasmolin II (696) + TX, jodfenphos (1248) + TX, lindan (430) + TX, lufenuron (490) + TX, malathion (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mephosfolan (1261) + TX, mesulfen (tên gọi khác) [CCN] + TX, methacrifos (1266) + TX, methamidophos (527) + TX, methidathion (529) + TX, methiocarb (530) + TX, methomyl (531) + TX, metyl bromua (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinphos (556) + TX, mexacarbate (1290) + TX, milbemectin (557) + TX, milbemycin oxim (tên gọi khác) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotophos (561) + TX, morphothion (1300) + TX, moxidectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (mã hợp chất) + TX, NC-512 (mã hợp chất) + TX, nifluridide (1309) + TX, nikkomyxin (tên gọi khác) [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, nitrilacarb 1:1 zinc

clorua complex (1313) + TX, NNI-0101 (mã hợp chất) + TX, NNI-0250 (mã hợp chất) + TX, omethoat (594) + TX, oxamyl (602) + TX, oxydeprofos (1324) + TX, oxydisulfoton (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, parathion (615) + TX, permethrin (626) + TX, dầu mỏ (tên gọi khác) (628) + TX, phenkapton (1330) + TX, phenthoat (631) + TX, phorat (636) + TX, phosalon (637) + TX, phosfolan (1338) + TX, phosmet (638) + TX, phosphamidon (639) + TX, phoxim (642) + TX, pirimiphos-metyl (652) + TX, polycloterpen (tên truyền thống) (1347) + TX, polynactin (tên gọi khác) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofos (662) + TX, promaxyl (1354) + TX, propargit (671) + TX, propetamphos (673) + TX, propoxur (678) + TX, prothidathion (1360) + TX, prothoat (1362) + TX, pyrethrin I (696) + TX, pyrethrin II (696) + TX, pyrethrins (696) + TX, pyridaben (699) + TX, pyridaphenthion (701) + TX, pyrimidifen (706) + TX, pyrimitat (1370) + TX, quinalphos (711) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (mã mở rộng) (1382) + TX, RA-17 (mã mở rộng) (1383) + TX, rotenon (722) + TX, schradan (1389) + TX, sebufos (tên gọi khác) + TX, selamectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, SI-0009 (mã hợp chất) + TX, sophamit (1402) + TX, spirodiclofen (738) + TX, spiromesifen (739) + TX, SSI-121 (mã mở rộng) (1404) + TX, sulfiram (tên gọi khác) [CCN] + TX, sulfluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, sulphur (754) + TX, SZI-121 (mã mở rộng) (757) + TX, tau-fluvalinat (398) + TX, tebufenpyrad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (tên gọi khác) + TX, tetrachlorvinphos (777) + TX, tetradifon (786) + TX, tetranactin (tên gọi khác) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, thiafenox (tên gọi khác) + TX, thiocarboxim (1431) + TX, thiofanox (800) + TX, thiometon (801) + TX, thioquinox (1436) + TX, thuringiensin (tên gọi khác) [CCN] + TX, triamiphos (1441) + TX, triarathen (1443) + TX, triazophos (820) + TX, triazuron (tên gọi khác) + TX, trichlorfon (824) + TX, trifenofos (1455) + TX, trinactin (tên gọi khác) (653) + TX, vamidothion (847) + TX, vaniliprol [CCN] và YI-5302 (mã hợp chất) + TX,

chất trừ tảo được chọn từ nhóm các chất bao gồm bethoxazin [CCN] + TX, đồng dioctanoat (tên theo IUPAC) (170) + TX, đồng sulfat (172) + TX, xybutryn [CCN] + TX, dichlon (1052) + TX, diclophen (232) + TX, endothal (295) + TX, fentin (347) + TX, hydrated lime [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamin (714) + TX, quinonamit (1379) + TX, simazin (730) + TX, triphenyltin axetat (tên theo IUPAC) (347) và triphenyltin hydroxit (tên theo IUPAC) (347) + TX,

chất diệt giun sán được chọn từ nhóm các chất bao gồm abamectin (1) + TX, crufomat (1011) + TX, doramectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, emamectin (291) + TX, emamectin benzoat (291) + TX, eprinomectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, ivermectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, milbemyxin oxim (tên gọi khác) [CCN] + TX, moxitetin (tên gọi khác) [CCN] + TX, piperazin [CCN] + TX, selamectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, spinosad (737) và thiophanat (1435) + TX,

chất diệt chim được chọn từ nhóm các chất bao gồm cloalozơ (127) + TX, endrin (1122) + TX, fenthion (346) + TX, pyridin-4-amin (tên theo IUPAC) (23) và strychnin (745) + TX,

chất diệt khuẩn được chọn từ nhóm các chất bao gồm 1-hydroxy-1*H*-pyridin-2-thion (tên theo IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ylamino)benzensulfonamid (tên theo IUPAC) (748) + TX, 8-hydroxyquinolin sulfat (446) + TX, bronopol (97) + TX, đồng dioctanoat (tên theo IUPAC) (170) + TX, đồng hydroxit (tên theo IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclophen (232) + TX, dipyrithion (1105) + TX, dodixin (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehyt (404) + TX, hydrargaphen (tên gọi khác) [CCN] + TX, kasugamycin (483) + TX, kasugamycin hydroclorua hydrat (483) + TX, nickel bis(dimetyldithiocarbamat) (tên theo IUPAC) (1308) + TX, nitrapyrin (580) + TX, octhilinon (590) + TX, oxolinic axit (606) + TX, oxytetraacyclin (611) + TX, kali hydroxyquinolin sulfat (446) + TX, probenazol (658) + TX, streptomycin (744) + TX, streptomycin sesquisulfat (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, và thiomersal (tên gọi khác) [CCN] + TX,

tác nhân sinh học được chọn từ nhóm bao gồm *Adoxophyes orana* GV (tên gọi khác) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (tên gọi khác) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (tên gọi khác) (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (tên gọi khác) (28) + TX, *Anagrus atomus* (tên gọi khác) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (tên gọi khác) (33) + TX, *Aphidius colemani* (tên gọi khác) (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (tên gọi khác) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (tên gọi khác) (38) + TX, *Bacillus firmus* (tên gọi khác) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (tên khoa học) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (tên khoa học) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (tên khoa học) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (tên khoa học) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (tên khoa học) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (tên khoa học) (51) + TX, *Bacillus*

thuringiensis subsp. *tenebrionis* (tên khoa học) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (tên gọi khác) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (tên gọi khác) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (tên gọi khác) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (tên gọi khác) (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (tên gọi khác) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (tên gọi khác) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (tên gọi khác) (254) + TX, *Encarsia formosa* (tên khoa học) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (tên gọi khác) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (tên gọi khác) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* và *H. megidis* (tên gọi khác) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (tên gọi khác) (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (tên gọi khác) (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (tên gọi khác) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (tên gọi khác) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (tên gọi khác) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (tên khoa học) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (tên khoa học) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV và *N. lecontei* NPV (tên gọi khác) (575) + TX, *Orius* spp. (tên gọi khác) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (tên gọi khác) (613) + TX, *Pasteuria penetrans* + TX, *Pasteuria thornei* + TX, *Pasteuria nishizawae* + TX, *Pasteuria ramosa* + TX, *Phytoseiulus persimilis* (tên gọi khác) (644) + TX, virus NPV (nuclear polyhedrosis virus) đa vỏ đối với *Spodoptera exigua* (tên khoa học) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema riobravensis* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (tên gọi khác) (742) + TX, *Steinernema* spp. (tên gọi khác) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (tên gọi khác) (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (tên gọi khác) (844) và *Verticillium lecanii* (tên gọi khác) (848) + TX,

chất diệt trùng trong đất được chọn từ nhóm các chất bao gồm iodometan (tên theo IUPAC) (542) và metyl bromua (537) + TX,

chất diệt sản côn trùng được chọn từ nhóm các chất bao gồm apholat [CCN] + TX, bisazir (tên gọi khác) [CCN] + TX, busulfan (tên gọi khác) [CCN] + TX, diflubenzuron (250) + TX, dimatif (tên gọi khác) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, methiotepa [CCN] + TX, metyl apholat [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penfluron (tên gọi khác) [CCN] + TX, tepa

[CCN] + TX, thiohempa (tên gọi khác) [CCN] + TX, thiotepa (tên gọi khác) [CCN] + TX, tretamin (tên gọi khác) [CCN] và uredepa (tên gọi khác) [CCN] + TX,

Pheromon côn trùng được chọn từ nhóm các chất bao gồm (*E*)-dec-5-en-1-yl axetat với (*E*)-dec-5-en-1-ol (tên theo IUPAC) (222) + TX, (*E*)-tridec-4-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-methylhept-2-en-4-ol (tên theo IUPAC) (541) + TX, (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (779) + TX, (*Z*)-dodec-7-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (tên theo IUPAC) (436) + TX, (*Z*)-hexadec-11-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (437) + TX, (*Z*)-hexadec-13-en-11-yn-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-one (tên theo IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (tên theo IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (tên theo IUPAC) (783) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (784) + TX, (*7E,9Z*)-dodeca-7,9-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (283) + TX, (*9Z,11E*)-tetradeca-9,11-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (780) + TX, (*9Z,12E*)-tetradeca-9,12-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (781) + TX, 14-metyloctadec-1-ene (tên theo IUPAC) (545) + TX, 4-metylnonan-5-ol với 4-metylnonan-5-one (tên theo IUPAC) (544) + TX, alpha-multistriatin (tên gọi khác) [CCN] + TX, brevicomin (tên gọi khác) [CCN] + TX, codlure (tên gọi khác) [CCN] + TX, codlemon (tên gọi khác) (167) + TX, cuelure (tên gọi khác) (179) + TX, disparlure (277) + TX, dodec-8-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (286) + TX, dodec-9-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, 10-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (284) + TX, dominicalure (tên gọi khác) [CCN] + TX, etyl 4-metyloctanoat (tên theo IUPAC) (317) + TX, eugenol (tên gọi khác) [CCN] + TX, frontalin (tên gọi khác) [CCN] + TX, gossyplure (tên gọi khác) (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlure I (tên gọi khác) (421) + TX, grandlure II (tên gọi khác) (421) + TX, grandlure III (tên gọi khác) (421) + TX, grandlure IV (tên gọi khác) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol (tên gọi khác) [CCN] + TX, ipsenol (tên gọi khác) [CCN] + TX, japonilure (tên gọi khác) (481) + TX, lineatin (tên gọi khác) [CCN] + TX, litlure (tên gọi khác) [CCN] + TX, looplure (tên gọi khác) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, megatomoic axit (tên gọi khác) [CCN] + TX, methyl eugenol (tên gọi khác) (540) + TX, muscalure (563) + TX, octadeca-2,13-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (588) + TX, octadeca-3,13-dien-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (589) + TX, orfralure (tên gọi khác) [CCN] + TX, oryctalure (tên gọi

khác) (317) + TX, ostramon (tên gọi khác) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidin (tên gọi khác) (736) + TX, sulcatol (tên gọi khác) [CCN] + TX, tetradec-11-en-1-yl axetat (tên theo IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlure A (tên gọi khác) (839) + TX, trimedlure B₁ (tên gọi khác) (839) + TX, trimedlure B₂ (tên gọi khác) (839) + TX, trimedlure C (tên gọi khác) (839) và trunc-call (tên gọi khác) [CCN] + TX,

chất xua đuổi côn trùng được chọn từ nhóm các chất bao gồm 2-(octylthio)etanol (tên theo IUPAC) (591) + TX, butopyronoxyl (933) + TX, butoxy(polypropylen glycol) (936) + TX, dibutyl adipat (tên theo IUPAC) (1046) + TX, dibutyl phtalat (1047) + TX, dibutyl succinat (tên theo IUPAC) (1048) + TX, dietyltoluamit [CCN] + TX, dimetyl carbat [CCN] + TX, dimetyl phtalat [CCN] + TX, etyl hexandiol (1137) + TX, hexamit [CCN] + TX, methoquin-butyl (1276) + TX, metylneodecanamit [CCN] + TX, oxamat [CCN] và picaridin [CCN] + TX,

chất diệt côn trùng được chọn từ nhóm chất bao gồm 1-diclo-1-nitroetan (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-diclo-2,2-bis(4-etylphenyl)etan (tên theo IUPAC) (1056), + TX, 1,2-diclopropan (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-diclopropan with 1,3-diclopropen (tên theo IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloetan (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, 2,2,2-triclo-1-(3,4-diclophenyl)etyl axetat (tên theo IUPAC) (1451) + TX, 2,2-dicloviny 2-etylsulphinyetyl metyl phosphat (tên theo IUPAC) (1066) + TX, 2-(1,3-dithiolan-2-yl)phenyl dimetylcarbamat (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, 2-(2-butoxyetoxy)etyl thioxyanat (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, 2-(4,5-dimetyl-1,3-dioxolan-2-yl)phenyl metylcarbamat (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-clo-3,5-xylyloxy)etanol (tên theo IUPAC) (986) + TX, 2-cloviny dietyl phosphat (tên theo IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidon (tên theo IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerylindan-1,3-dion (tên theo IUPAC) (1246) + TX, 2-metyl(prop-2-ynyl)aminophenyl metylcarbamat (tên theo IUPAC) (1284) + TX, 2-thioxyanatoetyl laurat (tên theo IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloprop-1-ene (tên theo IUPAC) (917) + TX, 3-metyl-1-phenylpyrazol-5-yl dimetylcarbamat (tên theo IUPAC) (1283) + TX, 4-metyl(prop-2-ynyl)amino-3,5-xylyl metylcarbamat (tên theo IUPAC) (1285) + TX, 5,5-dimetyl-3-oxoxyclohex-1-enyl dimetylcarbamat (tên theo IUPAC) (1085) + TX, abamectin (1) + TX, axephat (2) + TX, axetamidrid

(4) + TX, axethion (tên gọi khác) [CCN] + TX, acetoprole [CCN] + TX, acrinathrin (9) + TX, acrylonitril (tên theo IUPAC) (861) + TX, alanycarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxycarb (863) + TX, aldrin (864) + TX, allethrin (17) + TX, allosamidin (tên gọi khác) [CCN] + TX, allyxycarb (866) + TX, alpha-xypermethrin (202) + TX, alpha-ecdysone (tên gọi khác) [CCN] + TX, nhôm phosphua (640) + TX, amidithion (870) + TX, amidothioat (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amiton (875) + TX, amiton hydro oxalat (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasin (877) + TX, athidathion (883) + TX, AVI 382 (mã hợp chất) + TX, AZ 60541 (mã hợp chất) + TX, azadirachtin (tên gọi khác) (41) + TX, azamethiphos (42) + TX, azinphos-ethyl (44) + TX, azinphos-methyl (45) + TX, azothoat (889) + TX, *Bacillus thuringiensis* độc tố delta (tên gọi khác) (52) + TX, bari hexaflorua (tên gọi khác) [CCN] + TX, bari polysulfua (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, barthrin [CCN] + TX, Bayer 22/190 (mã mở rộng) (893) + TX, Bayer 22408 (mã mở rộng) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfuracarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-xyfluthrin (194) + TX, beta-xypermethrin (203) + TX, bifenthrin (76) + TX, bioallethrin (78) + TX, bioallethrin *S*-xyclopentenyl isomer (tên gọi khác) (79) + TX, bioethanomethrin [CCN] + TX, biopermethrin (908) + TX, bioresmethrin (80) + TX, bis(2-cloetyl) ete (tên theo IUPAC) (909) + TX, bistrifluron (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerat (tên gọi khác) + TX, bromfenvinfos (914) + TX, bromoxycylen (918) + TX, bromo-DDT (tên gọi khác) [CCN] + TX, bromophos (920) + TX, bromophos-ethyl (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezin (99) + TX, butacarb (926) + TX, butathiofos (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonat (932) + TX, butoxycarboxim (104) + TX, butylpyridaben (tên gọi khác) + TX, cadusafos (109) + TX, canxi arsenat [CCN] + TX, canxi xyanua (444) + TX, canxi polysulfua (tên theo IUPAC) (111) + TX, camphechlor (941) + TX, carbanolat (943) + TX, carbaryl (115) + TX, carbofuran (118) + TX, carbon disulfua (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, carbon tetracloarua (tên theo IUPAC) (946) + TX, carbophenothion (947) + TX, carbosulfan (119) + TX, cartap (123) + TX, cartap hydroclorua (123) + TX, xevadin (tên gọi khác) (725) + TX, clobicyclic (960) + TX, clodan (128) + TX, clodecon (963) + TX, clodimeform (964) + TX, clodimeform hydroclorua (964) + TX, cloetoxifos (129) + TX, clofenapyr (130) + TX, clofenvinphos (131) + TX, clofluaazuron (132) + TX, clomephos (136) + TX,

cloform [CCN] + TX, clopicrin (141) + TX, clophoxim (989) + TX, cloprazophos (990) + TX, clopyrifos (145) + TX, clopyrifos-metyl (146) + TX, clothiophos (994) + TX, chromafenozit (150) + TX, xinerin I (696) + TX, xinerin II (696) + TX, xinerins (696) + TX, cis-resmethrin (tên gọi khác) + TX, cismethrin (80) + TX, cloxythrin (tên gọi khác) + TX, cloethocarb (999) + TX, closantel (tên gọi khác) [CCN] + TX, clothianidin (165) + TX, đồng axetoarsenit [CCN] + TX, đồng arsenat [CCN] + TX, đồng oleat [CCN] + TX, coumaphos (174) + TX, coumithoat (1006) + TX, crotamiton (tên gọi khác) [CCN] + TX, crotoxyphos (1010) + TX, crufomat (1011) + TX, cryolit (tên gọi khác) (177) + TX, CS 708 (mã mở rộng) (1012) + TX, xyanofenphos (1019) + TX, xyanophos (184) + TX, xyanthoat (1020) + TX, xyclethrin [CCN] + TX, xycloprothrin (188) + TX, xyfluthrin (193) + TX, xyhalothrin (196) + TX, xypermethrin (201) + TX, xyphenothrin (206) + TX, xyromazin (209) + TX, xythioat (tên gọi khác) [CCN] + TX, *d*-limonen (tên gọi khác) [CCN] + TX, *d*-tetramethrin (tên gọi khác) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofuran (1034) + TX, deltamethrin (223) + TX, demephion (1037) + TX, demephion-O (1037) + TX, demephion-S (1037) + TX, demeton (1038) + TX, demeton-metyl (224) + TX, demeton-O (1038) + TX, demeton-O-metyl (224) + TX, demeton-S (1038) + TX, demeton-S-metyl (224) + TX, demeton-S-metylsulphon (1039) + TX, diafenthiuron (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diamidafos (1044) + TX, diazinon (227) + TX, dicapthon (1050) + TX, dichlofenthion (1051) + TX, dichlorvos (236) + TX, dicliphos (tên gọi khác) + TX, dicresyl (tên gọi khác) [CCN] + TX, dicrotophos (243) + TX, dixyclanil (244) + TX, dieldrin (1070) + TX, dietyl 5-metylpyrazol-3-yl phosphat (tên theo IUPAC) (1076) + TX, diflubenzuron (250) + TX, dilor (tên gọi khác) [CCN] + TX, dimefluthrin [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetan (1085) + TX, dimethoat (262) + TX, dimethrin (1083) + TX, dimetylviphos (265) + TX, dimetilan (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexin (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefuran (271) + TX, diofenolan (1099) + TX, dioxabenzofos (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxathion (1102) + TX, disulfoton (278) + TX, dithicrofos (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdysterone (tên gọi khác) [CCN] + TX, EI 1642 (mã mở rộng) (1118) + TX, emamectin (291) + TX,

emamectin benzoat (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empenthrin (292) + TX, endosulfan (294) + TX, endothion (1121) + TX, endrin (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonan (1124) + TX, eprinomectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, esfenvalerat (302) + TX, etaphos (tên gọi khác) [CCN] + TX, ethiofencarb (308) + TX, ethion (309) + TX, ethiprol (310) + TX, ethoat-metyl (1134) + TX, ethoprophos (312) + TX, etyl format (tên theo IUPAC) [CCN] + TX, etyl-DDD (tên gọi khác) (1056) + TX, etylen dibromua (316) + TX, etylen diclorua (tên hoá học) (1136) + TX, etylen oxit [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfos (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famphur (323) + TX, fenamiphos (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclophos (1148) + TX, fenethacarb (1149) + TX, fenfluthrin (1150) + TX, fenitrothion (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxycarb (340) + TX, fenpirithrin (1155) + TX, fenpropathrin (342) + TX, fenpyrad (tên gọi khác) + TX, fensulfothion (1158) + TX, fenthion (346) + TX, fenthion-etyl [CCN] + TX, fenvalerat (349) + TX, fipronil (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamit (CAS. Số đăng ký: 272451-65-7) + TX, flucofuron (1168) + TX, fluxycloxuron (366) + TX, flucythrinate (367) + TX, fluenetil (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxuron (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumethrin (372) + TX, fluvalinat (1184) + TX, FMC 1137 (mã mở rộng) (1185) + TX, fonofos (1191) + TX, formetanat (405) + TX, formetanat hydroclorua (405) + TX, formothion (1192) + TX, formparanat (1193) + TX, fosmethilan (1194) + TX, fospirat (1195) + TX, fosthiazat (408) + TX, fosthietan (1196) + TX, furathiocarb (412) + TX, furethrin (1200) + TX, gamma-xyhalothrin (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatin (422) + TX, guazatin axetat (422) + TX, GY-81 (mã mở rộng) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozit (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclo (1211) + TX, heptenophos (432) + TX, heterophos [CCN] + TX, hexaflumuron (439) + TX, HHDN (864) + TX, hydrametylnon (443) + TX, hydro xyanit (444) + TX, hydropren (445) + TX, hyquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprothrin (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, iodometan (tên theo IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofos (1231) + TX, isobenzan (1232) + TX, isocarbophos (tên gọi khác) (473) + TX, isodrin (1235) + TX, isofenphos (1236) + TX, isolan (1237) + TX, isoprocab (472) + TX, isopropyl *O*-(metoxyaminothiophosphoryl)salixylat (tên theo IUPAC) (473) + TX, isoprothiolan

(474) + TX, isothioat (1244) + TX, isoxathion (480) + TX, ivermectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, jasmolin I (696) + TX, jasmolin II (696) + TX, jodfenphos (1248) + TX, juvenil hoocmon I (tên gọi khác) [CCN] + TX, juvenil hormon II (tên gọi khác) [CCN] + TX, juvenil hormon III (tên gọi khác) [CCN] + TX, kelevan (1249) + TX, kinopren (484) + TX, lambda-xyhalothrin (198) + TX, lead arsenat [CCN] + TX, lepimectin (CCN) + TX, leptophos (1250) + TX, lindan (430) + TX, lirimfos (1251) + TX, lufenuron (490) + TX, lythidathion (1253) + TX, *m*-cumenyl metylcarbammat (tên theo IUPAC) (1014) + TX, magie phosphua (tên theo IUPAC) (640) + TX, malathion (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarphon (1258) + TX, menazon (1260) + TX, mephosfolan (1261) + TX, mercurous clorua (513) + TX, mesulfenfos (1263) + TX, metaflumizon (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-kali (tên gọi khác) (519) + TX, metam-natri (519) + TX, methacrifos (1266) + TX, methamidophos (527) + TX, metansulphonyl fluorua (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, methidathion (529) + TX, methiocarb (530) + TX, methocrotophos (1273) + TX, methomyl (531) + TX, methopren (532) + TX, methoquin-butyl (1276) + TX, methothrin (tên gọi khác) (533) + TX, metoxyclo (534) + TX, metoxyfenozit (535) + TX, metyl bromua (537) + TX, metyl isothioxyanat (543) + TX, metylcloform (tên gọi khác) [CCN] + TX, metylen clorua [CCN] + TX, metofluthrin [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazon (1288) + TX, mevinphos (556) + TX, mexacarat (1290) + TX, milbemectin (557) + TX, milbemycin oxim (tên gọi khác) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotophos (561) + TX, morphothion (1300) + TX, moxidectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, naftalofos (tên gọi khác) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naphthalen (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (mã mở rộng) (1306) + TX, NC-184 (mã hợp chất) + TX, nicotin (578) + TX, nicotin sulfat (578) + TX, nifluridide (1309) + TX, nitenpyram (579) + TX, nithiazin (1311) + TX, nitrilacarb (1313) + TX, phức chất nitrilacarb 1:1 kẽm clorua (1313) + TX, NNI-0101 (mã hợp chất) + TX, NNI-0250 (mã hợp chất) + TX, nornicotin (tên truyền thống) (1319) + TX, novaluron (585) + TX, noviflumuron (586) + TX, *O*-5-diclo-4-iodophenyl *O*-etyl etylphosphonothioat (tên theo IUPAC) (1057) + TX, *O,O*-dietyl *O*-4-metyl-2-oxo-2*H*-chromen-7-yl phosphorothioat (tên theo IUPAC) (1074) + TX, *O,O*-dietyl *O*-6-metyl-2-propylpyrimidin-4-yl

phosphorothioat (tên theo IUPAC) (1075) + TX, *O,O,O',O'*-tetrapropyl dithiopyrophosphat (tên theo IUPAC) (1424) + TX, axit oleic (tên theo IUPAC) (593) + TX, omethoat (594) + TX, oxamyl (602) + TX, oxydemeton-metyl (609) + TX, oxydeprofos (1324) + TX, oxydisulfoton (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclobenzen [CCN] + TX, parathion (615) + TX, parathion-metyl (616) + TX, penfluron (tên gọi khác) [CCN] + TX, pentaclophenol (623) + TX, pentaclophenyl laurat (tên theo IUPAC) (623) + TX, permethrin (626) + TX, dầu mỏ (tên gọi khác) (628) + TX, PH 60-38 (mã mở rộng) (1328) + TX, phenkapton (1330) + TX, phenothrin (630) + TX, phenthoat (631) + TX, phorat (636) + TX, phosalon (637) + TX, phosfolan (1338) + TX, phosmet (638) + TX, phosniclo (1339) + TX, phosphamidon (639) + TX, phosphin (tên theo IUPAC) (640) + TX, phoxim (642) + TX, phoxim-metyl (1340) + TX, pirimetaphos (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimiphos-etyl (1345) + TX, pirimiphos-metyl (652) + TX, các chất đồng phân polyclodixyclopentadien (tên theo IUPAC) (1346) + TX, polycloterpen (tên truyền thống) (1347) + TX, kali arsenit [CCN] + TX, kali thioxyanat [CCN] + TX, prallethrin (655) + TX, precoxen I (tên gọi khác) [CCN] + TX, precoxen II (tên gọi khác) [CCN] + TX, precoxen III (tên gọi khác) [CCN] + TX, primidophos (1349) + TX, profenofos (662) + TX, profluthrin [CCN] + TX, promaxyl (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propaphos (1356) + TX, propetamphos (673) + TX, propoxur (678) + TX, prothidathion (1360) + TX, prothiofos (686) + TX, prothoat (1362) + TX, protrifenbut [CCN] + TX, pymetrozin (688) + TX, pyraclofos (689) + TX, pyrazophos (693) + TX, pyresmethrin (1367) + TX, pyrethrin I (696) + TX, pyrethrin II (696) + TX, pyrethrins (696) + TX, pyridaben (699) + TX, pyridalyl (700) + TX, pyridaphenthion (701) + TX, pyrimidifen (706) + TX, pyrimitat (1370) + TX, pyriproxyfen (708) + TX, quassia (tên gọi khác) [CCN] + TX, quinalphos (711) + TX, quinalphos-metyl (1376) + TX, quinothion (1380) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (mã mở rộng) (1382) + TX, rafoxanit(tên gọi khác) [CCN] + TX, resmethrin (719) + TX, rotenon (722) + TX, RU 15525 (mã mở rộng) (723) + TX, RU 25475 (mã mở rộng) (1386) + TX, ryania (tên gọi khác) (1387) + TX, ryanodin (tên truyền thống) (1387) + TX, sabadilla (tên gọi khác) (725) + TX, schradan (1389) + TX, sebufos (tên gọi khác) + TX, selamectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, SI-0009 (mã hợp chất) + TX, SI-0205 (mã hợp chất) + TX, SI-0404 (mã hợp

chất) + TX, SI-0405 (mã hợp chất) + TX, silafluofen (728) + TX, SN 72129 (mã mở rộng) (1397) + TX, natri arsenit [CCN] + TX, natri xyanua (444) + TX, natri florua (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, natri hexaflosilicat (1400) + TX, natri pentaclophenoxit (623) + TX, natri selenat (tên theo IUPAC) (1401) + TX, natri thioxyanat [CCN] + TX, sophamit (1402) + TX, spinosad (737) + TX, spiromesifen (739) + TX, spirotetmat (CCN) + TX, sulcofuron (746) + TX, sulcofuron-natri (746) + TX, sulfluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, sulphuryl florua (756) + TX, sulprofos (1408) + TX, dầu hắc ín (tên gọi khác) (758) + TX, tau-fluvalinat (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozit (762) + TX, tebufenpyrad (763) + TX, tebupirimfos (764) + TX, teflubenzuron (768) + TX, tefluthrin (769) + TX, temephos (770) + TX, TEPP (1417) + TX, terallethrin (1418) + TX, terbam (tên gọi khác) + TX, terbufos (773) + TX, tetracloetan [CCN] + TX, tetrachlorvinphos (777) + TX, tetramethrin (787) + TX, theta-xypermethrin (204) + TX, thiacloprid (791) + TX, thiafenox (tên gọi khác) + TX, thiamethoxam (792) + TX, thicrofos (1428) + TX, thiocarboxim (1431) + TX, thioxyclam (798) + TX, thioxyclam hydro oxalat (798) + TX, thiodicarb (799) + TX, thiofanox (800) + TX, thiometon (801) + TX, thionazin (1434) + TX, thiosultap (803) + TX, thiosultap-natri (803) + TX, thuringiensin (tên gọi khác) [CCN] + TX, tolfenpyrad (809) + TX, tralomethrin (812) + TX, transfluthrin (813) + TX, transpermethrin (1440) + TX, triamiphos (1441) + TX, triazamat (818) + TX, triazophos (820) + TX, triazuron (tên gọi khác) + TX, triclofon (824) + TX, trichlormetaphos-3 (tên gọi khác) [CCN] + TX, triclomat (1452) + TX, trifenofos (1455) + TX, triflumuron (835) + TX, trimethacarb (840) + TX, tripren (1459) + TX, vamidothion (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridin (tên gọi khác) (725) + TX, veratrin (tên gọi khác) (725) + TX, XMC (853) + TX, xylylcarb (854) + TX, YI-5302 (mã hợp chất) + TX, zeta-xypermethrin (205) + TX, zetamethrin (tên gọi khác) + TX, kẽm phosphua (640) + TX, zolaprofos (1469) và ZXI 8901 (mã mở rộng) (858) + TX, xyantraniliprol [736994-63-19] + TX, cloantraniliprol [500008-45-7] + TX, xyenopyrafen [560121-52-0] + TX, xyflumetofen [400882-07-7] + TX, pyrifluquinazon [337458-27-2] + TX, spinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, spirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxafloer [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperfluthrin [915288-13-0] + TX, tetrametylfluthrin [84937-88-2] + TX,

chất diệt động vật thân mềm được chọn từ nhóm các chất bao gồm bis(tributyltin) oxit (tên theo IUPAC) (913) + TX, bromoaxetamit [CCN] + TX, canxi arsenat [CCN] + TX, cloethocarb (999) + TX, đồng axetoarsenit [CCN] + TX, đồng sulfat (172) + TX, fentin (347) + TX, ferric phosphat (tên theo IUPAC) (352) + TX, metaldehyt (518) + TX, methiocarb (530) + TX, niclosamit (576) + TX, niclosamit-olamin (576) + TX, pentaclophenol (623) + TX, natri pentaclophenoxit (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, thiodicarb (799) + TX, tributyltin oxit (913) + TX, trifenmorph (1454) + TX, trimethacarb (840) + TX, triphenyltin axetat (tên theo IUPAC) (347) và triphenyltin hydroxit (tên theo IUPAC) (347) + TX, pyriprol [394730-71-3] + TX,

chất diệt giun tròn được chọn từ nhóm các chất bao gồm AKD-3088 (mã hợp chất) + TX, 1,2-dibromo-3-clopropan (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-diclopropan (Tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-diclopropan với 1,3-diclopropen (tên theo IUPAC) (1063) + TX, 1,3-diclopropen (233) + TX, 3,4-diclotetrahydrothiophen 1,1-dioxit (tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clophenyl)-5-metylrhodanin (tên theo IUPAC) (980) + TX, 5-metyl-6-thioxo-1,3,5-thiadiazinan-3-ylaxetic axit (tên theo IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenylaminopurin (tên gọi khác) (210) + TX, abamectin (1) + TX, axetoprol [CCN] + TX, alanycarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxycarb (863) + TX, AZ 60541 (mã hợp chất) + TX, benclonthiaz [CCN] + TX, benomyl (62) + TX, butylpyridaben (tên gọi khác) + TX, cadusafos (109) + TX, cacbofuran (118) + TX, cacbon disulfua (945) + TX, cacbosulfan (119) + TX, clopicrin (141) + TX, clopyrifos (145) + TX, cloethocarb (999) + TX, xytokinin (tên gọi khác) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamitafos (1044) + TX, dichlofenthion (1051) + TX, dicliphos (tên gọi khác) + TX, dimethoat (262) + TX, doramectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, emamectin (291) + TX, emamectin benzoat (291) + TX, eprinomectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, ethoprophos (312) + TX, etylen dibromua (316) + TX, fenamiphos (326) + TX, fenpyrad (tên gọi khác) + TX, fensulfothion (1158) + TX, fosthiazat (408) + TX, fosthietan (1196) + TX, furfural (tên gọi khác) [CCN] + TX, GY-81 (mã mở rộng) (423) + TX, heterophos [CCN] + TX, iodometan (tên theo IUPAC) (542) + TX, isamitofos (1230) + TX, isazofos (1231) + TX, ivermectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, kinetin (tên gọi khác)

(210) + TX, mecarphon (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-kali (tên gọi khác) (519) + TX, metam-natri (519) + TX, metyl bromua (537) + TX, metyl isothioxyanat (543) + TX, milbemyxin oxim (tên gọi khác) [CCN] + TX, moxictin (tên gọi khác) [CCN] + TX, chế phẩm *Myrothecium verrucaria* (tên gọi khác) (565) + TX, NC-184 (mã hợp chất) + TX, oxamyl (602) + TX, phorat (636) + TX, phosphamiton (639) + TX, phosphocarb [CCN] + TX, sebufos (tên gọi khác) + TX, selamectin (tên gọi khác) [CCN] + TX, spinosad (737) + TX, terbam (tên gọi khác) + TX, terbufos (773) + TX, tetraclothiophen (Tên theo IUPAC/Chemical Abstracts) (1422) + TX, thiafenox (tên gọi khác) + TX, thionazin (1434) + TX, triazophos (820) + TX, triazuron (tên gọi khác) + TX, xlenols [CCN] + TX, YI-5302 (mã hợp chất) và zeatin (tên gọi khác) (210) + TX, fluensulfon [318290-98-1] + TX,

chất ức chế nitrat hóa được chọn từ nhóm các chất bao gồm kali etylxanthat [CCN] và nitrapyrin (580) + TX,

chất kích hoạt thực vật được chọn từ nhóm các chất bao gồm axibenzolar (6) + TX, axibenzolar-*S*-metyl (6) + TX, probenazol (658) và phần chiết từ *Reynoutria sachalinensis* (tên gọi khác) (720) + TX,

chất diệt động vật gặm nhấm được chọn từ nhóm các chất bao gồm 2-isovalerylindan-1,3-dion (tên theo IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ylamino)benzensulfonamit (tên theo IUPAC) (748) + TX, alpha-clohydrin [CCN] + TX, nhôm phosphua (640) + TX, antu (880) + TX, arsen oxit (882) + TX, bari cacbonat (891) + TX, bisthiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolone (91) + TX, bromethalin (92) + TX, canxi xyanua (444) + TX, cloraloza (127) + TX, clophaxinon (140) + TX, cholecalxiferol (tên gọi khác) (850) + TX, coumaclo (1004) + TX, coumafuryl (1005) + TX, coumatetralyl (175) + TX, crimidin (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difethialon (249) + TX, diphaxinon (273) + TX, ergocalxiferol (301) + TX, flocoumafen (357) + TX, floaxetamit (379) + TX, flupropadin (1183) + TX, flupropadin hydroclorua (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, hydro xyanua (444) + TX, iodometan (tên theo IUPAC) (542) + TX, lindan (430) + TX, magie phosphua (tên theo IUPAC) (640) + TX, metyl bromua (537) + TX, norbormua (1318) + TX, phosaxetim (1336) + TX, phosphin (tên theo IUPAC) (640) + TX, phospho [CCN] + TX, pindon (1341) + TX, kali arsenit [CCN] + TX, pyrinuron (1371) + TX, scillirosit (1390) + TX, natri

arsenit [CCN] + TX, natri xyanua (444) + TX, natri floaxetat (735) + TX, strychnin (745) + TX, tali sulfat [CCN] + TX, warfarin (851) và kẽm phosphua (640) + TX,

chất hiệp đồng được chọn từ nhóm các chất bao gồm 2-(2-butoxyetoxy)etyl piperonylat (tên theo IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-yl)-3-hexylxyclohex-2-enon (tên theo IUPAC) (903) + TX, farnesol với nerolidol (tên gọi khác) (324) + TX, MB-599 (mã mở rộng) (498) + TX, MGK 264 (mã mở rộng) (296) + TX, piperonyl butoxit (649) + TX, piprotal (1343) + TX, propyl isome (1358) + TX, S421 (mã mở rộng) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolin (1394) và sulfoxit (1406) + TX,

chất xua đuổi động vật được chọn từ nhóm các chất bao gồm anthraquinon (32) + TX, cloraloza (127) + TX, đồng naphthenat [CCN] + TX, đồng oxyclorua (171) + TX, diazinon (227) + TX, dixyclopentadien (tên hóa học) (1069) + TX, guazatin (422) + TX, guazatin axetat (422) + TX, methiocarb (530) + TX, pyridin-4-amin (tên theo IUPAC) (23) + TX, thiram (804) + TX, trimethacarb (840) + TX, kẽm naphthenat [CCN] và ziram (856) + TX,

chất diệt virus được chọn từ nhóm các chất bao gồm imanin (tên gọi khác) [CCN] và ribavirin (tên gọi khác) [CCN] + TX,

chất bảo vệ vết thương được chọn từ nhóm các chất bao gồm thủy ngân oxit (512) + TX, oethilinin (590) và thiophanat-metyl (802) + TX,

và các hoạt chất sinh học được chọn từ nhóm bao gồm azaconazol (60207-31-0) + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, xyproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalil [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, myclobutanil [88671-89-0] + TX, pefurazoat [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, prothioconazol [178928-70-6] + TX, pyrifenox [88283-41-4] + TX, procloaz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefon [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, anxyimidol

[12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimat [41483-43-6] + TX, dimethirimol [5221-53-4] + TX, ethirimol [23947-60-6] + TX, dodemorph [1593-77-7] + TX, fenpropidin [67306-00-7] + TX, fenpropimorph [67564-91-4] + TX, spiroxamin [118134-30-8] + TX, tridemorph [81412-43-3] + TX, xyprodinil [121552-61-2] + TX, mepanipyrin [110235-47-7] + TX, pyrimetanil [53112-28-0] + TX, fenpiclonil [74738-17-3] + TX, fludioxonil [131341-86-1] + TX, benalaxyl [71626-11-4] + TX, furalaxyl [57646-30-7] + TX, metalaxyl [57837-19-1] + TX, R-metalaxyl [70630-17-0] + TX, ofurac [58810-48-3] + TX, oxadixyl [77732-09-3] + TX, benomyl [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, thiabendazol [148-79-8] + TX, chlozolinat [84332-86-5] + TX, dichlozolin [24201-58-9] + TX, iprodion [36734-19-7] + TX, myclozolin [54864-61-8] + TX, procymidon [32809-16-8] + TX, vinclozolin [50471-44-8] + TX, boscalid [188425-85-6] + TX, cacboxin [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanil [66332-96-5] + TX, mepronil [55814-41-0] + TX, oxycacboxin [5259-88-1] + TX, penthiopyrad [183675-82-3] + TX, thifluzamit [130000-40-7] + TX, guazatine [108173-90-6] + TX, dodin [2439-10-3] [112-65-2] (không có bazơ) + TX, iminoctadin [13516-27-3] + TX, azoxystrobin [131860-33-8] + TX, dimoxystrobin [149961-52-4] + TX, enestroburin {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxastrobin [361377-29-9] + TX, kresoxim-metyl [143390-89-0] + TX, metominostrobin [133408-50-1] + TX, trifloxystrobin [141517-21-7] + TX, orysastrobin [248593-16-0] + TX, picoxystrobin [117428-22-5] + TX, pyraclostrobin [175013-18-0] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, thiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captan [133-06-2] + TX, dichlofluanid [1085-98-9] + TX, floimit [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolylfluanid [731-27-1] + TX, hỗn hợp bordeaux [8011-63-0] + TX, đồng hydroxit [20427-59-2] + TX, đồngoxycyclorua [1332-40-7] + TX, đồng sulfat [7758-98-7] + TX, đồng oxit [1317-39-1] + TX, mancopper [53988-93-5] + TX, oxin-đồng [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrothal-isopropyl [10552-74-6] + TX, edifenphos [17109-49-8] + TX, iprobenphos [26087-47-8] + TX, isoprothiolan [50512-35-1] + TX, phosdiphen

[36519-00-3] + TX, pyrazophos [13457-18-6] + TX, tolclofos-metyl [57018-04-9] + TX, axibenzolar-S-metyl [135158-54-2] + TX, anilazin [101-05-3] + TX, benthiavalicarb [413615-35-7] + TX, blastixidin-S [2079-00-7] + TX, chinomethionat [2439-01-2] + TX, cloneb [2675-77-6] + TX, clothalonil [1897-45-6] + TX, xyflufenamid [180409-60-3] + TX, xymoxanil [57966-95-7] + TX, dichlon [117-80-6] + TX, dicloxymet [139920-32-4] + TX, diclomezin [62865-36-5] + TX, dicloran [99-30-9] + TX, diethofencarb [87130-20-9] + TX, dimethomorph [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorph) [211867-47-9] + TX, dithianon [3347-22-6] + TX, ethaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadon [131807-57-3] + TX, fenamidon [161326-34-7] + TX, fenoxanil [115852-48-7] + TX, fentin [668-34-8] + TX, ferimzon [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolide [239110-15-7] + TX, flusulfamit [106917-52-6] + TX, fenhexamid [126833-17-8] + TX, fosetyl-nhôm [39148-24-8] + TX, hymexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Xyazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamycin [6980-18-3] + TX, methasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenon [220899-03-6] + TX, penxycuron [66063-05-6] + TX, phthalit [27355-22-2] + TX, polyoxins [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, pyroquilon [57369-32-1] + TX, quinoxifen [124495-18-7] + TX, quintozen [82-68-8] + TX, lư huỳnh [7704-34-9] + TX, tiadinil [223580-51-6] + TX, triazoxit [72459-58-6] + TX, trixylazol [41814-78-2] + TX, triforin [26644-46-2] + TX, validamycin [37248-47-8] + TX, zoxamit (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamid [374726-62-2] + TX, isopyrazam [881685-58-1] + TX, sedaxan [874967-67-6] + TX, 3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxylic axit (9-diclometylen-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methano-naphthalen-5-yl)-amit (được bộc lộ trong WO 2007/048556) + TX, 3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxylic axit [2-(2,4-diclophenyl)-2-metoxi-1-metyl-etyl]-amit (được bộc lộ trong WO 2008/148570) + TX, 1-[4-[4-[(5S)5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl]piperidin-1-yl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon + TX, 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl]piperidin-1-yl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon [1003318-67-9], cả hai được bộc lộ trong WO 2010/123791, WO 2008/013925, WO 2008/013622 và WO 2011/051243

trang 20) +TX, và 3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxylic axit (3',4',5'-triflo-biphenyl-2-yl)-amit (được bộc lộ trong WO 2006/087343) + TX.

Các tài liệu trong ngoặc vuông sau thành phần hoạt tính, ví dụ [3878-19-1] đề cập đến số đăng ký Chemical Abstracts. Các thành phần trộn được mô tả trên là đã được biết. Trong trường hợp các hoạt chất có trong "Sách chỉ dẫn thuốc diệt loài gây hại" [The Pesticide Manual – Trích yếu toàn cầu; Xuất bản lần thứ mười ba; Chủ biên: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council], chúng được mô tả trong đó dưới số đầu vào được cho trong ngoặc đơn ở trên đối với hợp chất cụ thể; ví dụ, hợp chất "abamectin" được mô tả dưới số đầu vào (1). Khi "[CCN]" được thêm ở trên vào hợp chất cụ thể, hợp chất đang đặt ra là bao gồm trong "Compendium of Pesticide Common Names", mà có thể truy cập trên internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; ví dụ, hợp chất "axetoprol" được mô tả tại địa chỉ internet: <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

Hầu hết các hoạt chất được mô tả trên được nhắc đến ở phần trên của tài liệu này bởi cái gọi là "tên thông thường", "tên thông thường theo ISO" hoặc "tên thông thường" khác có liên quan được dùng trong các trường hợp riêng. Nếu ký hiệu không phải "tên thông thường", bản chất của ký hiệu thay vào đó được dùng được đưa ra trong ngoặc tròn đối với hợp chất cụ thể; trong trường hợp này, tên theo IUPAC, tên theo IUPAC/Chemical Abstracts, "tên hoá học", "tên truyền thống", "tên hợp chất" hoặc "mã mở rộng" được sử dụng hoặc, nếu không có một trong số các designations hoặc "tên thông thường" được sử dụng, thì "tên gọi khác" được sử dụng. "Số đăng ký CAS" nghĩa là số đăng ký Chemical Abstracts.

Tỷ lệ khối lượng của hai thành phần bất kỳ trong mỗi kết hợp được chọn để tạo ra, ví dụ, tác dụng hiệp đồng mong muốn. Nói chung, tỷ lệ khối lượng có thể thay đổi phụ thuộc vào thành phần cụ thể và bao nhiêu thành phần có mặt trong kết hợp. Thông thường, tỷ lệ khối lượng giữa hai thành phần bất kỳ trong kết hợp bất kỳ theo sáng chế, độc lập với nhau, là từ 100:1 đến 1:100, bao gồm từ 99:1, 98:2, 97:3, 96:4, 95:5, 94:6, 93:7, 92:8, 91:9, 90:10, 89:11, 88:12, 87:13, 86:14, 85:15, 84:16, 83:17, 82:18, 81:19, 80:20, 79:21, 78:22, 77:23, 76:24, 75:25, 74:26, 73:27, 72:28, 71:29, 70:30, 69:31, 68:32, 67:33, 66:34, 65:45, 64:46, 63:47, 62:48, 61:49, 60:40, 59:41, 58:42, 57:43, 56:44, 55:45, 54:46, 53:47, 52:48, 51:49, 50:50, 49:51, 48:52, 47:53, 46:54, 45:55, 44:56, 43:57, 42:58, 41:59, 40:60, 39:61, 38:62, 37:63, 36:64, 35:65, 34:66, 33:67,

32:68, 31:69, 30:70, 29:71, 28:72, 27:73, 26:74, 25:75, 24:76, 23:77, 22:78, 21:79, 20:80, 19:81, 18:82, 17:83, 16:84, 15:85, 14:86, 13:87, 12:88, 11:89, 10:90, 9:91, 8:92, 7:93, 6:94, 5:95, 4:96, 3:97, 2:98, đến 1:99. Các tỷ lệ khối lượng được ưu tiên giữa hai thành phần bất kỳ theo sáng chế là từ 75:1 đến 1:75, tốt hơn nữa là, 50:1 đến 1:50, đặc biệt là 25:1 đến 1:25, có lợi là 10:1 đến 1:10, như 5:1 đến 1:5, ví dụ 1:3 đến 3:1. Tỷ lệ trộn được hiểu là bao gồm, một mặt, tỷ lệ theo khối lượng và cả, mặt khác, tỷ lệ mol.

Các ví dụ về phương pháp áp dụng đối với các hợp chất theo sáng chế và chế phẩm của chúng, mà là phương pháp kiểm soát loài gây hại / nấm trong nông nghiệp, là phun, tán nhỏ, phun bụi, quét lên, bao, tung rắc hoặc trút nước – mà được chọn để phù hợp với mục tiêu đặt ra trong các hoàn cảnh hiện tại.

Các phương pháp áp dụng được ưu tiên trong nông nghiệp là áp dụng lên lá của cây (áp dụng trên lá), có thể lựa chọn tần suất và tỷ lệ sử dụng phù hợp với sự nguy hiểm của sự tàn phá bởi loài gây hại/nấm đang bàn đến. Theo cách khác, thành phần hoạt tính có thể vào cây thông qua hệ rễ (tác dụng nội hấp), bằng cách sử dụng hợp chất lên địa điểm của cây, ví dụ bằng cách sử dụng chế phẩm lỏng chứa hợp chất vào đất (bằng cách tưới ẩm), hoặc bằng cách sử dụng dạng rắn của hợp chất ở dạng hạt vào đất (sử dụng trong đất). Trong trường hợp cây lúa nước, các hạt này có thể được đo vào ruộng lúa ngập nước.

Tỷ lệ sử dụng thông thường cho mỗi hecta thường là 1 đến 2000g thành phần hoạt tính mỗi hecta, cụ thể là 10 đến 1000g/ha, tốt hơn là 10 đến 600g/ha, như 50 đến 300g/ha.

Các hợp chất theo sáng chế và chế phẩm của chúng còn thích hợp để bảo vệ vật liệu nhân giống cây, ví dụ hạt, như quả, thân củ hoặc nhân, hoặc cây non, kháng các loài gây hại thuộc loài được đề cập ở trên. Vật liệu nhân giống có thể được xử lý bằng hợp chất trước khi trồng, ví dụ hạt có thể được xử lý trước khi gieo. Theo cách khác, hợp chất có thể được sử dụng cho hạt (bao), hoặc là bằng cách ngâm hạt trong chế phẩm lỏng hoặc bằng cách sử dụng lớp của chế phẩm rắn. Cũng có thể sử dụng các chế phẩm khi vật liệu nhân giống đã được trồng trên vị trí sử dụng, ví dụ như vào rãnh hạt khi gieo. Các phương pháp xử lý vật liệu nhân giống cây này và vật liệu nhân giống cây được xử lý như vậy là mục đích khác theo sáng chế. Các tỷ lệ xử lý thông thường sẽ phụ thuộc vào cây và loài gây hại/nấm được kiểm soát và thường nằm trong

khoảng từ 1 đến 200 gam/ 100kg hạt, tốt hơn là từ 5 đến 150 gam/ 100kg hạt, như từ 10 đến 100 gam/ 100kg hạt.

Thuật ngữ hạt bao gồm hạt và cành giâm của cây thuộc tất cả các loại bao gồm nhưng không giới hạn ở hạt thật, mảnh hạt, chồi của rễ cây, hạt ngô, củ hành, quả, thân củ, hạt nhỏ, thân rễ, cành giâm, cành non được chiết và tương tự và theo một phương án ưu tiên nghĩa là hạt thật.

Sáng chế còn bao gồm hạt được bao hoặc xử lý với hoặc chứa hợp chất có công thức I. Thuật ngữ "được bao hoặc xử lý với và/hoặc chứa" thường có nghĩa là thành phần hoạt tính là cho phần nhiều nhất trên bề mặt của hạt vào thời điểm sử dụng, mặc dù phần nhiều hơn hoặc phần ít hơn của thành phần này có thể xâm nhập vào vật liệu hạt, phụ thuộc vào phương pháp sử dụng. Khi sản phẩm hạt đã nêu được trồng (lại), nó có thể hấp thụ thành phần hoạt tính. Theo một phương án, sáng chế đề xuất vật liệu nhân giống cây được dính hợp chất có công thức (I). Hơn nữa, sáng chế còn đề xuất, chế phẩm chứa vật liệu nhân giống cây được xử lý bằng hợp chất có công thức (I).

Xử lý hạt bao gồm toàn bộ các kỹ thuật xử lý hạt thích hợp đã biết trong lĩnh vực này, như bao hạt, phủ hạt, phun bụi lên hạt, ngâm hạt và viên hạt. Việc áp dụng xử lý hạt của hợp chất có công thức I có thể được thực hiện bằng các phương pháp bất kỳ đã biết, như phun hoặc bằng phun bụi hạt trước khi gieo hoặc trong khi gieo/trồng hạt.

Cụ thể, các cây đích thích hợp là ngũ cốc, như lúa mỳ, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, lúa, ngô hoặc lúa miến; củ cải, như củ cải đường hoặc củ cải bó; cây ăn quả, ví dụ cây ăn quả họ táo, cây ăn quả hạt cứng hoặc cây ăn quả hạt mềm, như táo, lê, mận, đào, cây quả hạnh, cây anh đào hoặc quả mọng, ví dụ dâu tây, cây mâm xôi hoặc cây mâm xôi đen; cây họ đậu, như đậu, cây đậu lăng, cây đậu Hà Lan hoặc đậu tương; cây lấy dầu, như cây cải dầu, cây cải, cây thuốc phiện, cây ô liu, cây hướng dương, cây dừa, cây thầu dầu, đậu cacao hoặc cây lạc; cây họ dưa chuột, như bí đỏ, dưa chuột hoặc dưa; cây lấy sợi, như bông, lanh, gai dầu hoặc đay; cây cam quýt, như cam, chanh, bưởi hoặc quýt; rau, như rau bina, rau diếp, măng tây, bắp cải, cà rốt, hành, cà chua, khoai tây hoặc ớt chuông; họ long não, như cây lê tàu, cây quế hoặc long não; và cả thuốc lá, quả hạch, cà phê, cà tím, mía đường, chè, hạt tiêu, nho, cây hoa bia, họ mã đề, cây lấy nhựa và cây cảnh (như hoa, và bãi cỏ hoặc cây cảnh).

Theo một phương án, cây được chọn từ ngũ cốc, ngô, đậu tương, lúa, mía đường, rau và cây lấy dầu.

Thuật ngữ "cây" được hiểu là bao gồm cả các cây được biến đổi bằng cách sử dụng kỹ thuật ADN tái tổ hợp mà chúng có khả năng tổng hợp một hoặc nhiều độc tố hoạt tính chọn lọc, như đã biết, ví dụ, từ vi khuẩn tạo độc tố, đặc biệt là vi khuẩn thuộc chi *Bacillus*.

Các độc tố mà có thể được biểu hiện bằng cây chuyển gen này, bao gồm, ví dụ, protein diệt côn trùng từ *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; hoặc protein diệt côn trùng từ *Bacillus thuringiensis*, như nội độc tố δ , ví dụ Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 hoặc Cry9C, hoặc protein diệt côn trùng từ thực vật (Vip), ví dụ Vip1, Vip2, Vip3 hoặc Vip3A; hoặc protein diệt côn trùng từ vi khuẩn ký sinh giun tròn, ví dụ *Photorhabdus spp.* hoặc *Xenorhabdus spp.*, như *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; độc tố được tạo ra bởi các động vật, như độc tố bọ cạp, độc tố nhện, độc tố ong bắp cày và các độc tố thần kinh không đặc hiệu với côn trùng khác; độc tố được tạo ra bởi nấm, như độc tố từ Streptomycetes, lectin thực vật, như lectin từ đậu Hà lan hoặc lúa mạch hoặc lectin từ cây giọt tuyết; agglutinin; các chất ức chế proteinaza, như các chất ức chế trypsin, các chất ức chế serin proteaza, các chất ức chế patatin, xystatin hoặc papain; protein bất hoạt ribosom (RIP), như rixin, RIP ở ngô, abrin, luffin, saporin hoặc bryodin; enzym chuyển hóa steroid, như 3-hydroxysteroidoxidaza, ecdysteroid-UDP-glycosyl-transferaza, cholesterol oxidaza, các chất ức chế ecdyson, HMG-CoA-reductaza, chất chặn kênh ion, như chất chặn kênh natri hoặc canxi; hormon esteraza nguyên sinh, thụ thể của hormon lợi tiểu, stilben syntaza, bibenzyl syntaza, chitinaza và glucanaza.

Theo phạm vi của sáng chế cần hiểu các nội độc tố δ , ví dụ như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 hoặc Cry9C, hoặc các protein diệt côn trùng sinh dưỡng (Vip), ví dụ như Vip1, Vip2, Vip3 hoặc Vip3A, cũng chỉ các độc tố lai, độc tố cắt cụt và độc tố biến đổi. Các độc tố lai là sản phẩm tái tổ hợp được tạo ra bởi tổ hợp mới của các vùng khác nhau thuộc các protein này (xem, ví dụ như, WO 02/15701). Các độc tố cắt cụt, ví dụ như Cry1Ab cắt cụt, đã được biết. Trong trường hợp các độc tố biến đổi, một hoặc nhiều axit amin của độc tố có trong tự nhiên được thay thế. Trong các thay thế axit amin này, tốt hơn là các trình tự nhận biết proteaza không có trong tự nhiên được chèn vào độc tố, ví dụ như, trong trường hợp Cry3A055, trình tự nhận biết cathepsin-G được chèn vào độc tố Cry3A (xem WO 03/018810).

Các ví dụ về các độc tố như vậy hoặc các cây chuyển gen có thể tổng hợp các độc tố này được bộc lộ, ví dụ như, trong EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 và WO 03/052073.

Quá trình tạo ra các cây chuyển gen này nói chung là đã biết đối với người có kỹ năng trong lĩnh vực này và được mô tả, ví dụ như, trong các xuất bản phẩm đã nêu trên. Axit deoxyribonucleic loại CryI và điều chế chúng là đã biết, ví dụ, từ WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 và WO 90/13651.

Độc tố có trong các cây chuyển gen truyền cho cây khả năng chịu được các côn trùng gây hại. Các côn trùng này có thể tìm thấy trong nhóm phân loại côn trùng bất kỳ, nhưng đặc biệt là thường tìm thấy trong nhóm côn trùng cánh cứng (Bộ cánh cứng), côn trùng hai cánh (Bộ hai cánh) và bướm (Bộ cánh phấn).

Các cây chuyển gen có một hoặc nhiều gen mã hóa kháng côn trùng và biểu hiện một hoặc nhiều độc tố đã được biết và một số trong chúng có bán trên thị trường. Các ví dụ về các cây này là: YieldGard® (giống ngô biểu hiện độc tố Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (giống ngô biểu hiện độc tố Cry3Bb1); YieldGard Plus® (giống ngô biểu hiện độc tố Cry1Ab và Cry3Bb1); Starlink® (giống ngô biểu hiện độc tố Cry9C); Herculex I® (giống ngô biểu hiện độc tố Cry1Fa2 và enzym phosphinothrixin N-acetyltransferaza (PAT) để thu được khả năng kháng chất diệt cỏ glufosinat amoni); NuCOTN 33B® (giống bông biểu hiện độc tố Cry1Ac); Bollgard I® (giống bông biểu hiện độc tố Cry1Ac); Bollgard II® (giống bông biểu hiện độc tố Cry1Ac và Cry2Ab); VipCot® (giống bông biểu hiện độc tố Vip3A và a Cry1Ab); NewLeaf® (giống khoai tây biểu hiện độc tố Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (đặc điểm kháng GA21 glyphosat), Agrisure® CB Advantage (đặc điểm dBt11 sâu đục thân ngô (CB)) và Protecta®.

Các ví dụ khác của các cây chuyển gen này là:

1. Ngô Bt11 của Syngenta Hạt SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, số đăng ký C/FR/96/05/10. *Zea mays* biến đổi gen được truyền khả năng chống sự phá hoại của sâu đục thân ngô châu Âu (*Ostrinia nubilalis* và *Sesamia nonagrioides*) bằng biểu hiện chuyển gen của độc tố cắt cụt Cry1Ab. Ngô Bt11 cũng biểu hiện chuyển gen enzym PAT để đạt được khả năng dung nạp thuốc diệt cỏ glufosinat amoni.

2. Ngô Bt176 từ Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, số đăng ký C/FR/96/05/10. *Zea mays* biến đổi gen được truyền khả năng chống sự phá hoại của sâu đục thân ngô châu Âu (*Ostrinia nubilalis* và *Sesamia nonagrioides*) bằng biểu hiện chuyển gen của độc tố Cry1Ab. Ngô Bt176 cũng biểu hiện chuyển gen enzyme PAT để đạt được khả năng dung nạp được thuốc diệt cỏ glufosinat amoni.
3. Ngô MIR604 từ Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, số đăng ký C/FR/96/05/10. Ngô đã được truyền khả năng kháng côn trùng bằng biểu hiện chuyển gen của độc tố Cry3A biến đổi. Độc tố này là Cry3A055 được biến đổi bằng cách chèn trình tự nhận biết cathepsin-G-protease. Phương pháp tạo cây ngô chuyển gen này được mô tả trong WO 03/018810.
4. Ngô MON 863 của Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, số đăng ký C/DE/02/9. MON 863 biểu hiện độc tố Cry3Bb1 và có khả năng kháng một số côn trùng Bộ Cánh cứng.
5. Bông IPC 531 từ Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, số đăng ký C/ES/96/02.
6. Ngô 1507 từ Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, số đăng ký C/NL/00/10. Ngô biến đổi gen để biểu hiện protein Cry1F để đạt được tính kháng với một số côn trùng Bộ cánh vảy và biểu hiện protein PAT để đạt được tính dung nạp đối với thuốc diệt cỏ glufosinat amoni.
7. Ngô NK603 × MON 810 của Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Bỉ, số đăng ký C/GB/02/M3/03. Bao gồm các giống ngô lai được gây giống thông thường bằng lai chéo các giống biến đổi gen NK603 và MON 810. Ngô NK603 × MON 810 biểu hiện protein CP4 EPSPS bằng cách chuyển gen, thu được từ loài *Agrobacterium sp.* chủng CP4, truyền khả năng dung nạp thuốc diệt cỏ Roundup® (có chứa glyphosat), và cả độc tố Cry1Ab thu được từ *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* mang lại khả năng chống chịu với một số côn trùng Bộ cánh vảy, bao gồm sâu đục thân ngô châu Âu.

Thông thường, hợp chất theo sáng chế được sử dụng ở dạng chế phẩm (ví dụ chế phẩm dạng bào chế) chứa chất mang. Hợp chất theo sáng chế và chế phẩm của chúng có thể được sử dụng dưới nhiều dạng khác nhau như chất phân tán sol khí, huyền phù bao nang, dịch đặc mờ lạnh, bột tan bụi được, dịch đặc nhũ hóa được, nhũ

tương dầu trong nước, nhũ tương nước trong dầu, hạt kết nang, hạt mịn, dịch đặc chảy được để xử lý hạt, khí (dưới áp suất), sản phẩm tạo khí, hạt, dịch đặc mờ nóng, hạt to, vi hạt, bột phân tán được trong dầu, dịch đặc chảy trộn được với dầu, chất lỏng trộn được với dầu, hồ bột, dạng que cây, bột để xử lý hạt khô, hạt được bao bằng chất diệt loài gây hại, dịch đặc tan được, bột tan được, dung dịch để xử lý hạt, dịch đặc huyền phù (dịch đặc chảy được), chất lỏng thể tích siêu thấp (ulv), huyền phù thể tích siêu thấp (ulv), hạt hoặc viên nén phân tán được trong nước, bột phân tán được trong nước để xử lý bột nhão, hạt hoặc viên nén tan được trong nước, bột tan trong nước được để xử lý hạt và bột thấm ướt được.

Chế phẩm thường chứa chất mang rắn hoặc lỏng và tùy ý một hoặc nhiều chất phụ gia bào chế thông thường, mà có thể là chất phụ gia rắn hoặc lỏng, ví dụ dầu thực vật epoxit hóa hoặc không epoxit hóa (ví dụ dầu dừa, dầu hạt cải hoặc dầu đậu tương không epoxit hóa), chất chống bọt, ví dụ dầu silicon, chất bảo quản, đất sét, các hợp chất vô cơ, chất điều chỉnh độ nhớt, chất hoạt động bề mặt, chất kết dính và/hoặc chất dính. Chế phẩm còn có thể chứa phân bón, chất cho vi dinh dưỡng hoặc chế phẩm khác mà ảnh hưởng đến sự tăng trưởng của cây cũng như bao gồm chế phẩm kết hợp chứa hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều chất có hoạt tính sinh học, như chất diệt vi khuẩn, chất diệt nấm, chất diệt giun tròn, chất kích thích thực vật, chất diệt ve bét, và chất diệt côn trùng.

Theo đó, sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế và chất mang nông học và tùy ý một hoặc nhiều chất phụ gia bào chế thông thường.

Chế phẩm được điều chế theo cách đã biết, không có mặt chất phụ gia ví dụ bằng cách nghiền, sàng và/hoặc nén hợp chất rắn theo sáng chế và có mặt ít nhất một chất phụ gia ví dụ bằng cách trộn đều và/hoặc nghiền hợp chất theo sáng chế chất phụ gia (các chất phụ gia). Trong trường hợp các hợp chất rắn theo sáng chế, việc nghiền/nghiền bi các hợp chất là để đảm bảo kích thước hạt cụ thể. Các quy trình này để điều chế chế phẩm và sử dụng các hợp chất theo sáng chế để điều chế các chế phẩm này cũng là đối tượng của sáng chế.

Các ví dụ về chế phẩm để dùng trong nông nghiệp là dịch đặc nhũ hóa được, dịch đặc huyền phù, vi nhũ tương, chất phân tán dầu, dung dịch phun trực tiếp hoặc pha loãng, hồ bột trải rộng được, nhũ tương pha loãng, bột tan được, bột phân tán được, bột thấm ướt được, bụi, hạt hoặc kết nang trong các chất polyme, mà bao gồm -

ít nhất – hợp chất theo sáng chế và dạng chế phẩm là để lựa chọn cho phù hợp với mục đích và hoàn cảnh hiện có.

Các ví dụ về chất mang lỏng thích hợp là hydrocacbon thơm không hydro hóa hoặc hydro hóa một phần, tốt hơn là các đoạn C_8 đến C_{12} của alkylbenzen, như hỗn hợp xylen, naphthalen hoặc tetrahydronaphthalen alkyl hóa, hydrocacbon béo hoặc béo mạch vòng, như parafin hoặc xyclohexan, alcohol như etanol, propanol hoặc butanol, glycol và ete và este của chúng như propylen glycol, dipropylen glycol ete, etylen glycol hoặc etylen glycol monometyl ete hoặc etylen glycol monoetyl ete, keton, như xyclohexanon, isophoron hoặc diaxeton alcohol, dung môi phân cực mạnh, như N-metylpyrolid-2-on, dimetyl sulfoxit hoặc N,N-dimetylformamit, nước, dầu thực vật epoxit hóa hoặc không epoxit hóa, như dầu hạt cải, thầu dầu, dừa hoặc đậu tương và silicon epoxit hóa hoặc không epoxit hóa.

Các ví dụ về chất mang rắn được sử dụng ví dụ cho bụi và bột phân tán được là, về nguyên tắc, các chất khoáng tự nhiên được nghiền như calxit, bột tan, cao lanh, montmorilonit hoặc atapulgit. Để cải thiện các đặc tính vật lý, còn có thể thêm Silic oxit tán mịn hoặc polyme hấp phụ tán mịn. Các chất mang hấp phụ cụ thể cho hạt là dạng xốp, như đá bọt, mặt gạch, sepiolit hoặc bentonit, và vật liệu chất mang không hấp phụ thích hợp là calxit hoặc cát. Ngoài ra, số lượng lớn vật liệu được tạo hạt có bản chất hữu cơ hoặc vô cơ có thể được sử dụng, cụ thể là dolomit hoặc các phần dư của cây bị gãy vụn.

Các hợp chất hoạt tính bề mặt thích hợp, phụ thuộc vào dạng của thành phần hoạt tính được điều chế, các chất hoạt động bề mặt không ion, cation và/hoặc anion hoặc hỗn hợp chất hoạt động bề mặt có đặc tính nhũ hóa, phân tán và thấm ướt tốt. Các chất hoạt động bề mặt được đề cập dưới đây chỉ được coi là ví dụ; nhiều chất hoạt động bề mặt khác được sử dụng thông thường trong lĩnh vực bào chế và thích hợp theo sáng chế được mô tả trong các tài liệu liên quan.

Các chất hoạt động bề mặt không ion là, chủ yếu, các dẫn xuất polyglycol ete của aliphatic hoặc xycloaliphatic alcohol, axit béo bão hòa hoặc không bão hòa hoặc of alkyl phenol có thể chứa khoảng 3 đến khoảng 30 nhóm glycol ete và khoảng 8 đến khoảng 20 nguyên tử cacbon trong gốc (xyclo)aliphatic hydrocacbon hoặc khoảng 6 đến khoảng 18 nguyên tử cacbon trong gốc alkyl của alkyl phenol. Cũng thích hợp là phụ phẩm polyetylen oxit tan được trong nước với polypropylen glycol,

etylendiaminopolypropylen glycol hoặc alkyl polypropylen glycol có 1 đến khoảng 10 nguyên tử cacbon trong mạch alkyl và khoảng 20 đến khoảng 250 nhóm etylen glycol ete và khoảng 10 đến khoảng 100 nhóm propylen glycol ete. Thông thường, các hợp chất nêu trên chứa 1 đến khoảng 5 đơn vị etylen glycol cho mỗi đơn vị propylene glycol. Các ví dụ có thể kể ra là nonylphenoxypolyetoxyetanol, polyglycol ete dầu thầu dầu, phụ phẩm polypropylen glycol/polyetylen oxit, tributylphenoxypolyetoxyetanol, polyetylen glycol hoặc octylphenoxypolyetoxyetanol. Còn thích hợp là este axit béo của polyoxyetylen sorbitan, như polyoxyetylen sorbitan trioleat.

Các chất hoạt động bề mặt cation là, chủ yếu, các muối amoni bậc bốn thường có ít nhất một gốc alkyl có khoảng 8 đến khoảng 22 nguyên tử C làm phần tử thế và làm phần tử thế khác (halogen hóa hoặc không halogen hóa) các gốc alkyl hoặc hydroxyalkyl hoặc benzyl thấp hơn. Các muối tốt hơn là ở dạng of halogenua, metylsulfat hoặc etylsulfat. Các ví dụ là stearyltrimetylamonium clorua và benzylbis(2-cloetyl)etylamonium bromua.

Các ví dụ về các chất hoạt động bề mặt anion thích hợp là xà phòng tan trong nước hoặc các hợp chất hoạt tính bề mặt tổng hợp tan trong nước. Các ví dụ về xà phòng thích hợp là muối kiềm, kiềm thổ hoặc (được thế hoặc không được thế) amoni của axit béo có khoảng 10 đến khoảng 22 nguyên tử C, như muối natri hoặc kali của axit oleic hoặc axit stearic, hoặc của hỗn hợp axit béo tự nhiên thu được ví dụ dầu dừa hoặc dầu cao; cũng có thể đề cập đến methyl taurat của axit béo. Tuy nhiên, chất hoạt động bề mặt tổng hợp được sử dụng thường xuyên hơn, cụ thể là sulfonat béo, sulfat béo, các dẫn xuất benzimidazol của sulfonat hóa hoặc alkylaryl sulfonat. Về nguyên tắc, sulfonat béo và sulfat béo có mặt là muối kiềm, kiềm thổ hoặc (được thế hoặc không được thế) amoni và chúng thường có gốc alkyl có khoảng 8 đến khoảng 22 nguyên tử C, alkyl còn được hiểu là bao gồm gốc alkyl của gốc axyl; các ví dụ được đề cập là muối natri hoặc canxi của axit lignosulfonic, của dodecylsulphuric este hoặc của hỗn hợp sulfat alcohol béo được điều chế từ axit béo tự nhiên. Nhóm này còn bao gồm muối của sulphuric este và axit sulfonic của phụ phẩm rượu béo/etylen oxit. Các dẫn xuất benzimidazol sulfonat hóa tốt hơn là chứa 2 nhóm sulphonyl và gốc axit béo có khoảng 8 đến khoảng 22 nguyên tử C. Các ví dụ về alkylarylsulfonat là muối natri, canxi hoặc trietanolamoni của axit dexylbenzensulfonic, của axit

dibutylnaphtalensulfonic hoặc của naphtalensulfonic axit/formaldehyt đậm đặc. Ngoài ra, còn có thể là, phosphat thích hợp, như muối của phosphoric este của phụ phẩm p-nonylphenol/(4-14)etylen oxit, hoặc phospholipit.

Về nguyên tắc, chế phẩm chứa 0,1 đến 99%, đặc biệt là 0,1 đến 95%, hợp chất theo sáng chế và 1 đến 99,9%, đặc biệt là 5 đến 99,9%, ít nhất một chất mang rắn hoặc lỏng, về nguyên tắc có thể cho 0 đến 25%, đặc biệt là 0,1 đến 20%, chế phẩm là chất hoạt động bề mặt (% trong mỗi trường hợp nghĩa là phần trăm theo khối lượng). Trong khi chế phẩm đậm đặc tốt hơn làm hàng hóa bán trên thị trường, người tiêu dùng cuối cùng về nguyên tắc sử dụng chế phẩm pha loãng có nồng độ thành phần hoạt tính cơ bản thấp hơn. Chế phẩm được ưu tiên bao gồm cụ thể như sau (% = phần trăm theo khối lượng):

Dịch đặc nhũ hóa được:

thành phần hoạt tính:	1 đến 95%, tốt hơn là 5 đến 20%
chất hoạt động bề mặt:	1 đến 30%, tốt hơn là 10 đến 20%
dung môi:	5 đến 98%, tốt hơn là 70 đến 85%

Bụi:

thành phần hoạt tính:	0,1 đến 10%, tốt hơn là 0,1 đến 1%
chất mang rắn:	99,9 đến 90%, tốt hơn là 99,9 đến 99%

Dịch đặc huyền phù và dịch đặc chảy được:

thành phần hoạt tính:	5 đến 75%, tốt hơn là 10 đến 50%
Nước:	94 đến 24%, tốt hơn là 88 đến 30%
chất hoạt động bề mặt:	1 đến 40%, tốt hơn là 2 đến 30%

Bột thấm ướt được:

thành phần hoạt tính:	0,5 đến 90%, tốt hơn là 1 đến 80%
chất hoạt động bề mặt:	0,5 đến 20%, tốt hơn là 1 đến 15%
chất mang rắn:	5 đến 99%, tốt hơn là 15 đến 98%

Hạt:

thành phần hoạt tính:	0,5 đến 30%, tốt hơn là 3 đến 15%
-----------------------	-----------------------------------

chất mang rắn: 99,5 đến 70%, tốt hơn là 97 đến 85%

Ví dụ chế phẩm (% = phần trăm theo khối lượng)

Ví dụ F1: Dịch đặc nhũ hóa a) b) c)

Thành phần hoạt tính 25% 40% 50%

Canxi dodexylbenzensulfonat 5% 8% 6 %

Polyetylen dầu thầu dầu

glycol ete (36 mol EO) 5% - -

Tributylphenoxypolyetylen glycol

ete (30mol EO) - 12% 4%

Xyclohexanon - 15% 20%

Hỗn hợp xylen 65% 25% 20%

Nhũ tương có nồng độ mong muốn có thể được điều chế từ dịch đặc này bằng cách pha loãng với nước.

Ví dụ F2: Dung dịch a) b) c) d)

Thành phần hoạt tính 80% 10% 5% 95%

Etylen glycol monometyl

ete 20% - - -

Polyetylen glycol

MW 400 - 70% - -

N-Metylpyrolid-2-on - 20% - -

Dầu dừa được epoxy hoá - - 1% 5%

Ete dầu mỏ

(khoảng sôi: 160-190°) - - 94% -

Dung dịch thích hợp để dùng ở dạng giọt cực nhỏ.

Ví dụ F3: Hạt a) b) c) d)

Thành phần hoạt tính 5% 10% 8% 21%

Cao lanh 94% - 79% 54%

Silic oxit phân tán mạnh 1% - 13% 7%

Atapulgit - 90% - 18%

Thành phần hoạt tính được pha loãng trong diclometan, dung dịch được phun lên (các) chất mang, và dung môi sau đó được làm bay hơi trong chân không.

Ví dụ F4: Bụi	a)	b)
Thành phần hoạt tính	2%	5%
Silic oxit phân tán mạnh	1%	5%
Bột tan	97%	-
Cao lanh	-	90%

Bụi sử dụng ngay thu được bằng cách trộn kỹ chất mang và thành phần hoạt tính.

Ví dụ F5: Bột thấm ướt được	a)	b)	c)
Thành phần hoạt tính	25%	50%	75%
Natri lignosulfonat	5%	5%	-
Natri lauryl sulfat	3%	-	5%
Natri diisobutyl-naphtalensulfonat	-	6 %	10%
Octylphenoxypolyetylen glycol ete (7-8 mol of EO)	-	2%	-
Silic oxit phân tán mạnh	5%	10%	10%
Cao lanh	62%	27%	-

Thành phần hoạt tính được trộn với chất phụ gia và hỗn hợp được nghiền mịn trong máy nghiền thích hợp. Ở đây tạo ra bột thấm ướt được, mà có thể pha loãng với nước để tạo ra huyền phù có nồng độ mong muốn bất kỳ.

Ví dụ F6: Hạt đùn

Thành phần hoạt tính	10%
Natri lignosulfonat	2%
Carboxymetylxenluloza	1%
Cao lanh	87%

Thành phần hoạt tính được trộn với chất phụ gia, và hỗn hợp được nghiền, được làm ẩm với nước, được đùn, được tạo hạt và được làm khô trong luồng khí.

Ví dụ F7: Hạt bao

Thành phần hoạt tính	3%
Polyetylen glycol (MW 200)	3%
Cao lanh	94%

Trong máy trộn, thành phần hoạt tính nghiền mịn được sử dụng đồng nhất cho cao lanh, mà được làm ẩm bằng polyetylen glycol. Ở đây tạo ra hạt bao không bụi.

Ví dụ F8: Dịch đặc huyền phù

Thành phần hoạt tính	40%
Etylen glycol	10%
Nonylphenoxypolyetylen glycol ete (15 mol EO)	6 %
Natri lignosulfonat	10%
Carboxymetylxenluloza	1%
dung dịch nước formaldehyt 37%	0,2%
Dầu silicon (nhũ tương nước 75%)	0,8%
Nước	32%

Thành phần hoạt tính nghiền mịn được trộn đều với chất phụ gia. Huyền phù có nồng độ mong muốn bất kỳ có thể được điều chế từ dịch đặc huyền phù thu được này bằng cách pha loãng với nước.

Ví dụ F9: Bột để xử lý hạt khô	a)	b)	c)
thành phần hoạt tính	25%	50%	75%
dầu khoáng nhẹ	5%	5%	5%
axit silicic nghiền mịn	5%	5%	-
Cao lanh	65%	40%	-
Bột tan	-	-	20%

Kết hợp được trộn đều với tá dược và hỗn hợp được nghiền mịn trong máy nghiền thích hợp, tạo ra bột có thể được sử dụng trực tiếp để xử lý hạt.

Ví dụ F10: Dịch đặc nhũ hóa được

thành phần hoạt tính	10%
octylphenol polyetylen glycol ete	3%

(4-5 mol etylen oxit)

canxi dodexylbenzensulfonat	3%
polyglycol ete dầu thầu dầu (35 mol etylen oxit)	4%
Xyclohexanon	30%
hỗn hợp xylen	50%

Nhũ tương của chất pha loãng yêu cầu bất kỳ, mà có thể sử dụng để bảo vệ cây, có thể thu được từ dịch đặc bằng cách pha loãng với nước.

Ví dụ F11: Dịch đặc chảy được để xử lý hạt

thành phần hoạt tính	40%
propylen glycol	5%
copolyme butanol PO/EO	2%
Tristyrenphenol với 10-20mol EO	2%
1,2-benzisothiazolin-3-on (ở dạng dung dịch 20% trong nước)	0,5%
muối canxi chất màu monoazo	5%
Dầu silicon (ở dạng huyền phù trong nước 75%)	0,2%
Nước	45,3%

Chế phẩm kết hợp đã được nghiền mịn được trộn đều với tá được, tạo ra dịch đặc huyền phù từ huyền phù của chất pha loãng mong muốn bất kỳ có thể thu được bằng cách pha loãng với nước. Sử dụng các chất pha loãng này, cây sống cũng như vật liệu nhân giống cây có thể được xử lý và bảo vệ chống lại sự tàn phá do vi sinh vật, bằng cách phun, tưới nước hoặc ngâm.

Các ví dụ về loại chế phẩm dùng cho lá đối với chế phẩm trộn trước là:

GR: Hạt

WP: bột thấm ướt được

WG: hạt phân tán được trong nước (bột)

SG: hạt tan được trong nước

SL: dịch đặc tan được

EC: dịch đặc nhũ hóa được

EW: nhũ tương, dầu trong nước

ME: vi nhũ tương

SC: dịch đặc huyền phù nước

CS: huyền phù bao nang nước

OD: dịch đặc huyền phù trên cơ sở dầu, và

SE: nhũ-huyền phù nước.

Trong khi đó, các ví dụ về loại chế phẩm xử lý hạt đối với chế phẩm trộn trước:

WS: bột nhão của bột thấm ướt được để xử lý hạt

LS: dung dịch để xử lý hạt

ES: nhũ tương để xử lý hạt

FS: dịch đặc huyền phù để xử lý hạt

WG: hạt phân tán được trong nước, và

CS: huyền phù bao nang nước.

Các ví dụ về loại chế phẩm thích hợp làm chế phẩm trộn trong bể là dung dịch, nhũ tương pha loãng, huyền phù, hoặc hỗn hợp của chúng, và bụi.

Như với bản chất của chế phẩm, phương pháp sử dụng, như lá, ngâm, phun, tán nhỏ, phun bụi, tung rắc, bao hoặc trút nước, được chọn tương ứng với mục đích sử dụng và hoàn cảnh hiện tại.

Chế phẩm trộn trong bể thường được điều chế bằng cách pha loãng với dung môi (ví dụ, nước) một hoặc nhiều chế phẩm trộn trước chứa các chất diệt loài gây hại khác nhau, và tùy ý thêm chất phụ gia.

Các chất mang và tá dược thích hợp có thể là chất rắn hoặc chất lỏng và là chất thường được sử dụng trong công nghệ chế phẩm, ví dụ chất khoáng tự nhiên hoặc tái tạo, dung môi, chất phân tán, chất thấm ướt, chất dính, chất làm dày, chất kết dính hoặc phân bón.

Thông thường, chế phẩm trộn trong bể để sử dụng trên lá hoặc trong đất chứa 0,1 đến 20%, đặc biệt là 0,1 đến 15%, thành phần mong muốn, và 99,9 đến 80%, đặc biệt là 99,9 đến 85%, chất phụ gia rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, dung môi như nước), khi chất phụ gia có thể là chất hoạt động bề mặt với lượng bằng 0 đến 20%, đặc biệt là 0,1 đến 15%, trên cơ sở chế phẩm trộn trong bể.

Thông thường, chế phẩm trộn trước để sử dụng trên lá chứa 0,1 đến 99,9%, đặc biệt là 1 đến 95%, thành phần mong muốn, và 99,9 đến 0,1%, đặc biệt là 99 đến 5%, tá dược rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, dung môi như nước), khi chất phụ gia có thể là chất hoạt động bề mặt với lượng bằng 0 đến 50%, đặc biệt là 0,5 đến 40%, trên cơ sở

chế phẩm trộn trong bể.

Thông thường, chế phẩm trộn trong bể để xử lý hạt chứa 0,25 đến 80%, đặc biệt là 1 đến 75%, thành phần mong muốn, và 99,75 đến 20%, đặc biệt là 99 đến 25%, chất phụ gia rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, dung môi như nước), khi chất phụ gia có thể là chất hoạt động bề mặt với lượng bằng 0 đến 40%, đặc biệt là 0,5 đến 30%, trên cơ sở chế phẩm trộn trong bể.

Thông thường, chế phẩm trộn sẵn dùng để xử lý hạt chứa 0,5 đến 99,9%, đặc biệt là 1 đến 95%, thành phần mong muốn, và 99,5 đến 0,1%, đặc biệt là 99 đến 5%, tá được rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, dung môi như nước), khi chất phụ gia có thể là chất hoạt động bề mặt với lượng bằng 0 đến 50%, đặc biệt là 0,5 đến 40%, trên cơ sở chế phẩm trộn sẵn.

Trong khi các sản phẩm bán trên thị trường sẽ tốt hơn là được điều chế ở dạng dịch đặc (ví dụ, chế phẩm trộn sẵn (chế phẩm dạng bào chế)), người dùng cuối thường sẽ dùng các chế phẩm pha loãng (ví dụ, chế phẩm trộn trong bể).

Chế phẩm trộn sẵn để xử lý hạt được ưu tiên là dịch đặc huyền phù nước. Chế phẩm có thể được sử dụng cho hạt sử dụng các kỹ thuật và máy móc xử lý thông thường, như kỹ thuật nền hóa lỏng, phương pháp nghiền cán, thiết bị xử lý hạt rotostatic, và thiết bị bao trống. Các phương pháp khác, như nền phun cũng có thể hữu dụng. Hạt có thể được tạo kích thước trước khi bao. Sau khi bao, hạt thường được làm khô và sau đó chuyển sang máy chỉnh kích thước để chỉnh kích thước. Quy trình này là đã biết trong lĩnh vực này.

Thông thường, chế phẩm trộn trước theo sáng chế chứa 0,5 đến 99,9%, đặc biệt là 1 đến 95%, có lợi là 1 đến 50%, theo khối lượng thành phần mong muốn, và 99,5 đến 0,1%, đặc biệt là 99 đến 5%, theo khối lượng tá được rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, dung môi như nước), khi chất phụ gia (hoặc tá được) có thể là chất hoạt động bề mặt với lượng bằng 0 đến 50%, đặc biệt là 0,5 đến 40%, theo khối lượng chế phẩm trộn trước.

Hợp chất có công thức (I) là theo một phương án ưu tiên, độc lập với các phương án khác, ở dạng chế phẩm xử lý (hoặc bảo vệ) vật liệu nhân giống cây, trong đó chế phẩm bảo vệ vật liệu nhân giống cây này bao gồm thêm chất tạo màu. Chế phẩm hoặc hỗn hợp bảo vệ vật liệu nhân giống cây hoặc còn chứa ít nhất một polyme từ các polyme tạo màng phân tán được trong nước và phân tán được trong nước mà cải

thiện sự kết kính của các thành phần hoạt tính với vật liệu nhân giống cây được xử lý, trong đó polyme thường có khối lượng mol trung bình bằng ít nhất 10.000 đến khoảng 100.000.

Chế phẩm kết hợp theo sáng chế (cụ thể là chúng chứa hợp chất theo sáng chế và một hoặc nhiều hoạt chất sinh học khác) có thể được sử dụng đồng thời hoặc liên tục.

Trong trường hợp này, các thành phần của chế phẩm kết hợp được sử dụng liên tục (tức là cái này sau cái kia), các thành phần được sử dụng liên tục trong khoảng thời gian hợp lý của mỗi thành phần để đạt được hiệu quả sinh học, như trong vài giờ hoặc vài ngày. Thứ tự sử dụng các thành phần trong chế phẩm kết hợp, tức là, liệu các hợp chất có công thức (I) có nên được sử dụng trước hay không phải là quá quan trọng để thực hiện sáng chế.

Trong trường hợp các thành phần của chế phẩm kết hợp được sử dụng đồng thời theo sáng chế, chúng có thể được sử dụng dưới dạng chế phẩm kết hợp, trong đó trường hợp (A) hợp chất có công thức (I) và một hoặc nhiều thành phần khác trong chế phẩm kết hợp có thể thu được từ các nguồn bào chế riêng rẽ và được trộn với nhau (được biết là hỗn hợp trộn trong bể, trộn sẵn, nước cốt phun, hoặc bột nhào), hoặc (B) hợp chất có công thức (I) và một hoặc nhiều thành phần khác có thể thu được dưới dạng chỉ một nguồn hỗn hợp bào chế (được biết là sản phẩm hỗn hợp trộn trước, trộn sẵn, dịch đặc, hoặc sản phẩm bào chế).

Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, hợp chất theo sáng chế được sử dụng dưới dạng chế phẩm kết hợp. Theo đó, sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế như được mô tả ở đây và một hoặc nhiều hoạt chất sinh học khác, và tùy ý một hoặc nhiều chất phụ gia bào chế thông thường; có thể ở dạng hỗn hợp trộn trong bể hoặc chế phẩm trộn trước.

Ngoài hoạt động hiệp đồng hiện tại liên quan đến hoạt tính sinh học, các chế phẩm kết hợp theo sáng chế còn có thể có các đặc tính có lợi đáng ngạc nhiên mà còn có thể được mô tả, theo nghĩa rộng, là hoạt tính hiệp đồng. Các ví dụ về đặc tính có lợi này có thể được đề cập là: đặc điểm có lợi trong khi bào chế và/hoặc khi sử dụng, ví dụ khi nghiền, sàng, nhũ hóa, hòa tan hoặc phân tán; tăng tính ổn định khi bảo quản; tăng tính ổn định với ánh sáng; khả năng thoái biến có lợi hơn; cải thiện đặc điểm tính

độc và/hoặc độc đối với sinh thái; hoặc bất kỳ lợi ích khác quen thuộc đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này.

Các hợp chất theo sáng chế để dùng trong nông nghiệp là tốt hơn là chất diệt giun tròn.

Các hợp chất theo sáng chế còn có thể được sử dụng trong các lĩnh vực khác, như một hoặc nhiều bảo vệ cho hàng hóa lưu trữ và phòng lưu trữ, bảo vệ vật liệu thô (như gỗ cà vôi), phủ nền và xây dựng, và quản lý vệ sinh - đặc biệt là bảo vệ người, vật nuôi và gia súc sinh sản kháng loài gây hại. Sáng chế do đó còn đề xuất chế phẩm diệt loài gây hại cho sử dụng này và phương pháp của chúng. Chế phẩm có thể cần được thay đổi để sử dụng cho mục đích cụ thể, và người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này hiểu rằng cần điều chế chế phẩm như vậy cho mục đích sử dụng cụ thể.

Trong lĩnh vực vệ sinh, chế phẩm theo sáng chế có hoạt tính chống loài ký sinh ngoài như con tích cứng, con tích mềm, ve ghẻ, ve thu hoạch, ruồi (hút máu và liếm), ấu trùng ruồi ký sinh, chấy rận, chấy rận trên tóc, chấy rận ở chim và bộ chết.

Các ví dụ về động vật ký sinh này là:

- bộ Anoplurida: *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.* và *Phthirus spp.*, *Solenopotes spp.*.
- bộ Mallophagida: *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.* và *Felicola spp.*.
- bộ hai cánh và các phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.* và *Melophagus spp.*.
- bộ Siphonaptera, ví dụ *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*.
- bộ Heteropterida, ví dụ *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*.

- bộ Blattarida, ví dụ *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattelagermanica* và *Supella* spp..
- các lớp phụ Acaria (Acarida) và các bộ Meta- và Meso-stigmata, ví dụ *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Railletia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. và *Varroa* spp..
- các bộ Actinedida (Prostigmata) và Acaridida (Astigmata), ví dụ *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergatesspp.*, *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. và *Laminosioptes* spp..

Chế phẩm theo sáng chế còn thích hợp để bảo vệ kháng sự tàn phá của côn trùng trong trường hợp vật liệu như gỗ, vải, chất dẻo, chất dính, hồ dán, sơn, giấy và bìa, da, phủ sàn và xây dựng. Chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng, ví dụ, kháng các loài gây hại sau đây: bộ cánh cứng như *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* và *Dinoderus minutus*, và cả bộ cánh màng như *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus* và *Urocerus augur*, và mối như *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* và *Coptotermes formosanus*, và bộ dài đuôi như *Lepisma saccharina*.

Các phương pháp sử dụng để sử dụng hợp chất hoặc chế phẩm của chúng để lưu trữ hàng hoá, phòng lưu trữ, vật liệu thô (như gỗ và vải), phủ sàn và xây dựng, và trong quản lý vệ sinh là đã biết trong lĩnh vực này.

Sáng chế còn đề xuất hợp chất có công thức (I) để sử dụng trong phương pháp xử lý, chữa bệnh, kiểm soát, phòng ngừa và bảo vệ động vật máu nóng, bao gồm

người, và cả chống sự tàn phá và lây nhiễm bởi giun sán, động vật thuộc lớp nhện và động vật chân đốt ký sinh trong và ngoài phương pháp này bao gồm cho dùng qua đường miệng, khu trú hoặc ngoài đường tiêu hóa hoặc dùng cho động vật này với lượng có hiệu quả chống giun sán, diệt loài gây hại thân mềm hoặc chất diệt vật ký sinh trong và ngoài.

Hợp chất có công thức (I) để sử dụng trong phương pháp trên đặc biệt hữu dụng để kiểm soát và phòng ngừa giun sán, giun tròn, ve bét và động vật chân đốt và tàn phá của loài ký sinh trong và ngoài và lây nhiễm ở động vật máu nóng như bò, cừu, heo, lạc đà, hươu nai, ngựa, gia cầm, cá, thỏ, dê, chồn, cáo, sóc, chó và mèo cũng như người.

Trong phạm vi kiểm soát và phòng ngừa sự tàn phá và lây nhiễm ở động vật máu nóng, các hợp chất theo sáng chế đặc biệt hữu dụng để kiểm soát giun sán và giun tròn. Các ví dụ đối với giun sán là thành viên của lớp Trematoda, thường được biết đến là sán lá hoặc sán dẹt, đặc biệt là thành viên của các chi *Fasciola*, *Fascioloides*, *Paramphistomu*, *Dicrocoelium*, *Eurytrema*, *Ophisthorchis*, *Fasciolopsis*, *Echinostoma* và *Paragonimus*. Giun tròn mà có thể được kiểm soát bởi các hợp chất có công thức (I) bao gồm giun sán *Haemonchus*, *Ostertagia*, *Cooperia*, *Oesphagastomu*, *Nematodirus*, *Dictyocaulus*, *Trichuris*, *Dirofilaria*, *Anxyclostoma*, *Ascaris* và tương tự.

Hợp chất theo sáng chế có thể còn kiểm soát sự tàn phá của động vật chân đốt ký sinh như giòi gia súc và giòi dạ dày. Ngoài ra, sự tàn phá của ve bét và động vật chân đốt ký sinh ký sinh ngoài ở động vật máu nóng và cá bao gồm chấy rận hút máu, chấy rận non, ruồi trâu, ruồi hút máu, ruồi muscoid, ruồi, ấu trùng ruồi ma, muỗi mắt, muỗi, bọ chét, mạt, con tích, ruồi dòi mũi, con két và con bọ chét có thể được kiểm soát, phòng ngừa hoặc hạn chế bởi các hợp chất theo sáng chế. Chấy rận hút máu bao gồm thành viên của bộ ăn lông như *Bovicola bovis*, *Trichodectes canis* và *Damalina ovis*. Chấy rận non bao gồm thành viên của Bộ chấy rận như *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli* và *Solenopotes capillatus*. Ruồi hút máu bao gồm thành viên của *Haematobia*. Con tích bao gồm *Boophilus*, *Rhipicephalus*, *Ixodes*, *Hyalomma*, *Amblyomma* và *Dermacentor*. Các hợp chất theo sáng chế có thể còn được sử dụng để kiểm soát mạt mà ký sinh trên động vật có vú máu nóng và gia cầm bao gồm mạt thuộc bộ *Acariformes* và *Parasitiformes*.

Để dùng qua đường miệng cho động vật máu nóng, các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế thành thức ăn cho động vật, hỗn hợp trộn trước thức ăn động vật, dịch đặc thức ăn động vật, thuốc viên, dung dịch, hồ bột, huyền phù, liều thuốc, gel, viên nén, viên thuốc to và viên nang. Ngoài ra, các hợp chất theo sáng chế có thể được dùng cho động vật trong nước uống. Để dùng qua đường miệng, dạng liều dùng được chọn cần cung cấp cho động vật với khoảng 0,01mg/kg đến 100 g/kg khối lượng cơ thể động vật/ngày hợp chất theo sáng chế.

Theo cách khác, các hợp chất theo sáng chế có thể được dùng cho động vật ngoài đường tiêu hóa, ví dụ, bằng cách tiêm trong dạ dày, trong cơ, trong tĩnh mạch hoặc dưới da. Các hợp chất theo sáng chế có thể được phân tán hoặc hòa tan trong chất mang sinh lý dụng để tiêm dưới da. Theo cách khác, các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế thành mô cấy để dùng dưới da. Ngoài ra các hợp chất theo sáng chế có thể được dùng qua chân bì cho động vật. Đối với dùng ngoài đường tiêu hóa, dạng liều dùng được chọn cần cung cấp cho động vật với khoảng 0,01mg/kg đến 100g/kg khối lượng cơ thể động vật/ngày hợp chất theo sáng chế.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được cho dùng khu trú cho động vật ở dạng chế phẩm nhúng, bụi, bột, vòng, huy hiệu, phun và rót lên. Để sử dụng khu trú, nhúng và phun thường chứa khoảng 0,5 ppm đến 5.000 ppm và tốt hơn là khoảng 1 ppm đến 3.000 ppm hợp chất theo sáng chế. Ngoài ra, các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế là miếng gắn tai cho động vật, cụ thể là động vật bốn chân như bò và cừu.

Các hợp chất theo sáng chế có thể còn được dùng kết hợp hoặc liên hợp với một hoặc nhiều hợp chất chất diệt vật ký sinh khác (để mở rộng phổ hoạt tính) bao gồm, nhưng không giới hạn ở, thuốc trừ giun sán, như benzimidazol, piperazin, levamisol, pyrantel, praziquantel và tương tự; chất diệt loài ký sinh như avermectin, milbemyxin và tương tự; chất diệt loài ký sinh ngoài như arylpyrol, organophosphat, carbamat, chất ức chế gamabutyric axit bao gồm fipronil, pyrethroid, spinosad, imidacloprid và tương tự; chất điều chỉnh tăng trưởng côn trùng như pyriproxyfen, xyromazin và tương tự; và chất ức chế kitin synthaza như benzoylure bao gồm flufenoxuron.

Chế phẩm chất diệt vật ký sinh theo sáng chế bao gồm lượng có hiệu quả diệt vật ký sinh của hợp chất theo sáng chế hoặc kết hợp của chúng trộn với một hoặc nhiều chất mang trợ, rắn hoặc lỏng sinh lý dụng đã biết từ thực hành thuốc thú y để cho dùng qua đường miệng, dưới da và khu trú. Chế phẩm có thể còn bao gồm các

chất phụ gia, như chất ổn định, chất chống bọt, chất điều chỉnh độ nhớt, chất gắn kết và chất dính, trong đó các sản phẩm bán trên thị trường sẽ tốt hơn là được điều chế ở dạng dịch đặc, người dùng cuối thường dùng chế phẩm pha loãng.

Chế phẩm theo sáng chế còn có thể được dùng để điều chế chế phẩm hữu dụng để điều trị hoặc phòng các bệnh do nấm ở người và động vật như, ví dụ, bệnh nấm, bệnh da, bệnh nấm biểu bì và bệnh nấm candida hoặc bệnh gây ra bởi *Aspergillus spp.*, ví dụ *Aspergillus fumigatus*.

Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, hợp chất có công thức (I) là hợp chất chống giun sán.

Theo một phương án, độc lập với các phương án khác, hợp chất có công thức (I) là hợp chất diệt loài gây hại, tốt hơn là hợp chất diệt giun tròn.

Theo mỗi khía cạnh và phương án của sáng chế, “chủ yếu chứa” và biến thể của chúng là phương án ưu tiên của “bao gồm” và biến thể của chúng, và “chứa” và biến thể của chúng là phương án ưu tiên của “chủ yếu chứa” và biến thể của chúng.

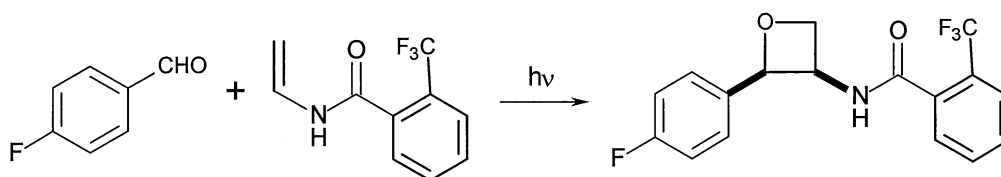
Bộ lộ trong đơn sáng chế đề xuất mỗi và mọi kết hợp của các phương án được bộ lộ ở đây.

Các ví dụ sau đây nhằm minh họa sáng chế. Chúng không làm giới hạn sáng chế. Nhiệt độ được cho là độ C; tỷ lệ trộn của các dung môi được cho theo phần theo thể tích.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế:

Ví dụ P1: Điều chế N-[cis-2-(4-clophenyl)oxetan-3-yl]-2-(triflometyl)benzamid (hợp chất 57.010)

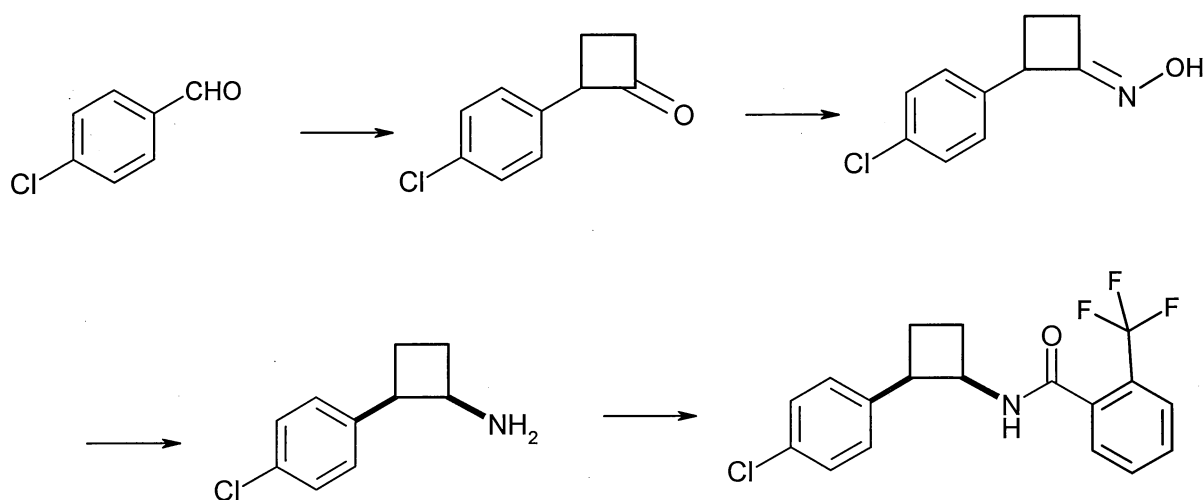


Dung dịch 4-flobenzaldehyt (288mg, 2,32mmol) và 2-triflometyl-N-vinyl-benzamid (ví dụ P8b) (1g, 4,65mmol) trong axetonitril (15ml) được soi bằng đèn hơi natri qua lọc

quarz trong 7 ngày. Hỗn hợp phản ứng được làm bay hơi bớt và chất thô bán rắn (1,6g) được sắc ký trên silic oxit bằng EtOAc / xyclohexan, sau đó làm lại với MeOH / diclometan và làm lại với EtOAc / xyclohexan để tạo ra 43mg (3%) N-[cis-2-(4-clophenyl)oxetan-3-yl]-2-(triflometyl)benzamidit.

¹H-NMR (CDCl₃) 4,51 (1H, t); 5,17 (1H, t); 5,48 (1H, M); 5,71 (1H, br d); 6,08 (1H, d); 6,93 (1H, d); 7,12 (2H, t); 7,38 (2H, m); 7,47 (2H, m); 7,63 (1H, d).

Ví dụ P2: Điều chế cis N-[2-(4-clophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamidit (hợp chất 57.006):



a. Điều chế 2-(4-clophenyl)xyclobutanon

Dung dịch đã được khuấy chứa 4-clo-benzaldehyt (142mg, 1mmol) và xyclopropyldiphenylsulfonium tetraflororat (317mg, 1mmol) trong 10ml THF khan, được làm nguội đến 0°C, được thêm nhỏ giọt, kèm khuấy bột nhào chứa kali tert. butoxit (1,4ml 1M). Sau khi hoàn thành việc thêm, phản ứng được khuấy 30 phút và 1M axit tetraflororic (10% trong THF) (10ml) được thêm. Hỗn hợp được để ấm đến nhiệt độ phòng và được hút vào ete và dung dịch ete được rửa bằng NaHCO₃ bão hòa, nước muối và nước và được làm khô. Lọc và cô bằng bay hơi quay tạo ra chất dầu. Sắc ký qua silica gel và rửa giải i-Hx:ete 5:1 tạo ra 2-(4-clophenyl)xyclobutanon là chất dầu.(180 mg, 83%).

¹H-NMR (CDCl₃) 2,20 (1H, m); 2,57 (1H, m); 3,06 (1H, m); 3,23 (1H, m); 4,51 (1H, m); 7,20 (2H, m); 7,29 (3H, m);

b. Điều chế 2-(4-clophenyl)xyclobutanon oxim

Dung dịch 2-(4-clophenyl)xyclobutanon (1,122g, 6,09mmol), hydroxylamin hydroclorua (3,541g, 8,2 đương lượng) và 36ml NaOH 5% trong 30ml EtOH được gia nhiệt ở hồi lưu trong 2h. Dung dịch được làm nguội, điều chỉnh đến độ pH 6, và được chiết với CHCl_3 . Chất chiết hữu cơ được rửa với nước muối và được làm khô. Lọc và cô thu được 2-(4-clophenyl)xyclobutanon oxim là chất dầu. 1g (84%)

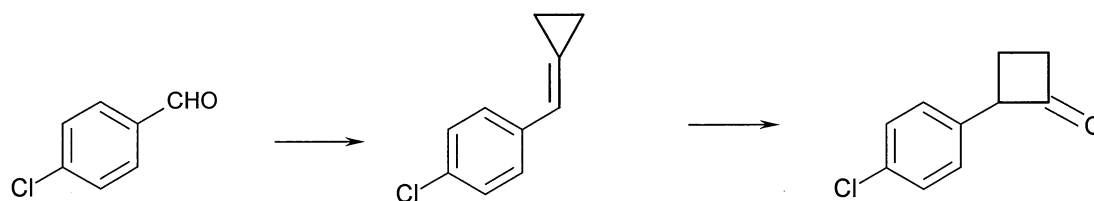
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) 2,13 (1H, m); 2,53 (1H, m); 3,01 (2H, m); 4,40 (1H, m); 7,27 (5H, m);

c. Điều chế 2-(4-clophenyl)xyclobutanamin

Dung dịch 2-(4-clophenyl)xyclobutanon oxim (200mg, 1mmol) trong metanol (5ml) được thêm MoO_3 (205 mg, 1,4 đương lượng) và natri borohydrit (394 mg, 10 đương lượng) ở 0°C . Sau khi khuấy ở nhiệt độ phòng trong 2 h dung môi được làm bay hơi. Hỗn hợp H_2O và CH_2Cl_2 được thêm. Pha hữu cơ được tách, rửa bằng nước muối, được làm khô và được cô trong chân không. 120mg sản phẩm amin được tách thành hỗn hợp của các chất đồng phân cis và trans 2:1. Sản phẩm thô không cần tinh chế được dùng cho phản ứng tiếp theo.

d. Điều chế N-[2-(4-clophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamid: Dung dịch 2-(4-clophenyl)xyclobutanamin (105 mg, 0,55mmol) và trietylamin (140mg 2,5 đương lượng) trong THF được thêm 2-triflometyl-benzoylclorua (127,46mg, 1,1 đương lượng) ở 0°C . RM được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 2 h. $\text{Et}_3\text{N.HCl}$ được lọc bỏ và THF được làm bay hơi. Cặn – hỗn hợp của hai chất đồng phân cis và trans (2:1) được tinh chế và tách bằng sắc ký trên silic oxit, chất rửa giải i-Hx:dietylete 1:1, (chất nhuộm KMnO_4). N-[cis-2-(4-clophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamid (cis) (33mg, điểm nóng chảy $147-9^\circ\text{C}$) và chất đồng phân trans của nó (17mg, điểm nóng chảy $117-9^\circ\text{C}$) được tách thành sản phẩm tinh thể.

Ví dụ P3: Điều chế 2-(4-clophenyl)xyclobutanon (khác)



a. Điều chế 1-clo-4-(xyclopropylidenemetyl)benzen Huyền phù của (4-bromopropyl)triphenylphosphoni bromua (29,3g) trong THF khan (200ml) được thêm

vào thành 5 lần riêng biệt cách nhau 15 phút kali tert. butoxit (14,19g, 2,2 đương lượng) để tạo ra huyền phù màu vàng. Hỗn hợp được gia nhiệt đến hồi lưu trong 10 phút và 4-diclobenzaldehyt (8,08 g, 56,9mmol) được thêm để tạo ra huyền phù màu cam. Hỗn hợp phản ứng được khuấy và sau đó được gia nhiệt ở hồi lưu trong 4h. RM sau đó được làm nguội đến nhiệt độ phòng, và được lọc qua đệm lọc Xêlit. Dung môi được loại trong chân không, và vật liệu thô thu được (9g) được đưa qua sắc ký nhanh với i-hexan làm chất rửa giải, tạo ra 1-clo-4-(xyclopropylidenemetyl)benzen (5g, 53%).

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) 1,19 (2H, m); 1,41 (2H, m); 6,70 (1H, m); 7,27 (2H, m); 7,46 (2H, m)

b. Điều chế 2-(4-clophenyl)xyclobutanon

Dung dịch 1-clo-4-(xyclopropylidenemetyl)benzen (5g, 30mmol) trong CH_2Cl_2 (80ml) được thêm thành 5 phần riêng axit m-cloperbenzoic (5,3g, 30mmol) ở 0°C . Sau khi khuấy ở 0°C trong 3 h, hỗn hợp phản ứng được rửa bằng dung dịch nước NaHCO_3 bão hòa và nước muối, được làm khô qua Na_2SO_4 và cô đặc. Sản phẩm thô trong CH_2Cl_2 (40ml) được thêm 10% HBF_4 (11,6ml 48% HBF_4 và 46ml H_2O). Sau khi khuấy ở nhiệt độ phòng trong 17 h, hỗn hợp was được chiết bằng CH_2Cl_2 , được rửa bằng dung dịch nước NaHCO_3 bão hòa và nước muối. Dung môi được loại trong chân không, và cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silic oxit gel (chất rửa giải i-hexan, chất nhuộm KMnO_4) để tạo ra 2-(4-clophenyl)xyclobutanon (3,470 g, 64%).

Bảng 57: Dữ liệu đặc trưng

Bảng 57 thể hiện điểm nóng chảy lựa chọn, HPLC-MS lựa chọn, và dữ liệu NMR lựa chọn cho các hợp chất theo sáng chế. CDCl_3 được sử dụng làm dung môi cho các số đo NMR, trừ khi có chỉ định khác. Không thử nghiệm được làm để liệt kê tất cả dữ liệu đặc trưng trong mọi trường hợp.

Trong bảng 57 và trong toàn bộ phần mô tả sau đây, nhiệt độ được cho là độ C; "NMR" nghĩa là phổ cộng hưởng từ hạt nhân; HPLC là sắc ký lỏng cao áp; MS là viết tắt của phổ khối; "%" là phần trăm theo khối lượng, trừ khi nồng độ tương ứng được chỉ ra theo đơn vị khác. Các chữ viết tắt sau đây được sử dụng trong toàn bộ phần mô tả:

m.p. = điểm nóng chảy [°C]

b.p.= điểm sôi

S = đơn

br = rộng

d = đôi

dd = đôi đôi

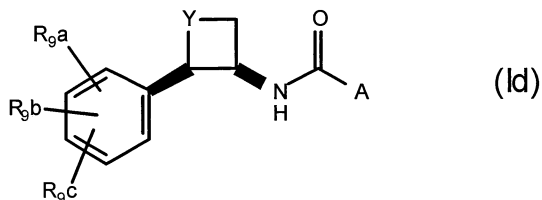
t = ba

q = bốn

m = đa

ppm = phần triệu

Bảng 57 dưới đây là danh mục các hợp chất có công thức Id đặc trưng. Đây là công thức I, trong đó Y hoặc là O hoặc CH₂ và R₁, R₂, R₃, R₄, và R₅ là H.



Hợp chất số	Y	R _{9a} , R _{9b} , R _{9c} *	A	điểm nóng chảy [°C]	Thời gian lưu [phút]	M+H ⁺
57.001	CH ₂	4-OCF ₃	A1	110 - 112		
57.002	CH ₂	4-OCF ₃	A9	120 - 123		
57.003	CH ₂	4-OCF ₃	A6	128 - 131		
57.004	O	4-Cl	A6			NMR
57.005	CH ₂	4-Cl	A1	138 - 140		
57.006	CH ₂	4-Cl	A6	147 - 149		
57.007	CH ₂	4-Cl	A5	149-150		
57.008	CH ₂	2,4-Cl ₂	A1	124-126		
57.009	CH ₂	2,4-Cl ₂	A6	126-128		
57.010	O	4-F	A6		1,7	340
57.011	CH ₂	2,4-Cl ₂	A5	157-159		NMR
57.012	CH ₂	2,4-Cl ₂	A10			NMR
57.013	CH ₂	4-Cl	A10			NMR
57.014	CH ₂	2-F,4-Cl	A1	126 - 129		
57.015	CH ₂	2-F,4-Cl	A6			NMR
57.016	CH ₂	4-OCHF ₂	A1		1,71	354

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A	điểm nóng chảy[°C]	Thời gian lưu [phút]	M+H ⁺
57.017	CH ₂	4-OCHF ₂	A6		1,78	386
57.018	CH ₂	4-Cl	A7	98 - 101		
57.019	CH ₂	4-Cl	A31	86 - 89		
57.020	CH ₂	4-Cl	A3	115 - 116		
57.021	CH ₂	4-Cl	A23	80 - 82		
57.022	CH ₂	4-Cl	A2	138 - 141		
57.023	CH ₂	4-Cl	A26	156 - 158		
57.024	CH ₂	4-Cl	A7	122 - 124		
57.025	CH ₂	2,4-Cl ₂	A3	109 - 111		
57.026	CH ₂	2,4-Cl ₂	A31	96 - 102		
57.027	CH ₂	2,4-Cl ₂	A7	124 - 128		
57.028	CH ₂	2,4-Cl ₂	A23	119 - 121		
57.029	CH ₂	2,4-Cl ₂	A2	92 - 94		
57.030	CH ₂	2,4-Cl ₂	A26	141 - 143		
57.031	CH ₂	2,4-Cl ₂	A4	82 - 84		
57.032	CH ₂	4-F	A1	134 - 135		
57.033	CH ₂	4-F	A6	143 - 144		
57.034	CH ₂	4-Br	A1	137 - 138		
57.035	CH ₂	4-Br	A6	144 - 145		
57.036	không được thử	4-F	A5	156 - 157		
57.037	CH ₂	4-Br	A5	139 -		

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A	điểm nóng chảy[°C]	Thời gian lưu [phút]	M+H ⁺
				140		
57.038	CH ₂	4-cPr	A5	157 - 158		
57.039	CH ₂	4-CN	A5	170 - 174		
57.04	CH ₂	4-F	A3	111 - 114		
57.041	CH ₂	4-F	A4	95 - 98		
57.042	CH ₂	4-F	A23	75 - 80		
57.043	CH ₂	4-F	A2	131 - 132		
57.044	CH ₂	4-F	A26	122 - 124		
57.045	CH ₂	4-Br	A2	167 - 169		
57.046	CH ₂	4-Br	A26	166 - 170		
57.047	O	2,4,6-F ₃	A6		0,89	376
57.048	O	4-OCHF ₂	A6	115 - 120		
57.049	O	4-CF ₃	A6	123 - 125		
57.050	O	2-F, 4-CF ₃	A6	99 - 108		
57.051	O	2,4-F ₂	A1	125 - 130		
57.052	O	2,4,6-F ₃	A1	130 - 136		
57.053	O	4-F	A1	95 - 101		
57.054	O	4-F	A5	107 - 127		
57.055	O	2,4-F ₂	A6	129 - 132		
57.056	O	2,4-F ₂	A5	131 - 134		
57.057	O	2,4,6-	A5	143 -		

Hợp chất số	Y	R9a,R9 b, R9c*	A	điểm nóng chảy[°C]	Thời gian lưu [phút]	M+H ⁺
		F3		146		
57.058	CH2	2,4-F2	A6	106-108		
57.059	CH2	2,4-F2	A3	124-126		
57.060	CH2	2,4-F2	A5	146-147		
57.061	CH2	2,4-F2	A26	108-110		
57.062	CH2	2-Cl, 4-CF3	A6	131-133		
57.063	CH2	2-Cl, 4-CF3	A3	95-97		
57.064	CH2	2-Cl, 4-CF3	A5	137-139		
57.065	CH2	2-Cl, 4-CF3	A26	112-114		
57.066	CH2	2-F, 4-CF3	A6	110-112		
57.067	CH2	2-F, 4-CF3	A3	109-111		
57.068	CH2	2-F, 4-CF3	A5	151-153		
57.069	CH2	2-F, 4-CF3	A26	152-154		
57.070	CH2	2,4-Cl2	A10		1,41	322.27
57.071	CH2	2,4-Cl2	A13		1,75	354.04
57.072	CH2	2,4-Cl2	A9		1,74	334.21
57.073	CH2	2,4-Cl2	A18		1,73	374.17
57.074	CH2	2,4-Cl2	A27		1,66	324.17
57.075	CH2	2,4-Cl2	A4		1,66	355.14
57.076	CH2	2,4-Cl2	A12		1,76	338.47
57.077	CH2	2,4-Cl2	A17		1,74	372.14
57.078	CH2	2,4-Cl2	A11		1,8	335.19
57.079	CH2	2,4-Cl2	A29		1,63	345.2
57.080	CH2	2,4-Cl2	A21		1,72	368.2
57.081	CH2	2,4-Cl2	A20		1,74	352.24
57.082	CH2	2,4-Cl2	A24		1,63	336.17
57.083	CH2	2,4-Cl2	A16		1,8	388.09
57.084	CH2	2,4-Cl2	A12		1,8	446.14

Hợp chất số	Y	R _{9a} , R _{9b} , R _{9c} *	A	điểm nóng chảy[°C]	Thời gian lưu [phút]	M+H ⁺
57.085	CH ₂	2,4-Cl ₂	A19		1,89	404.18
57.086	CH ₂	2,4-Cl ₂	A8		1,8	406.18
57.087	CH ₂	2,4-Cl ₂	A14		1,76	397.97
57.088	CH ₂	2,4-Cl ₂	A22		1,17	335.22
57.089	CH ₂	2,4-Cl ₂	A30		1,92	420.19
57.090	CH ₂	2,4-Cl ₂	A28		1,59	356.14
57.091	CH ₂	4-Cl	A10		1,29	288.32
57.092	CH ₂	4-Cl	A13		1,62	320.28
57.093	CH ₂	4-Cl	A9		1,63	300.16
57.094	CH ₂	4-Cl	A18		1,62	340.09
57.095	CH ₂	4-Cl	A27		1,55	290.23
57.096	CH ₂	4-Cl	A4		1,54	321.13
57.097	CH ₂	4-Cl	A12		1,64	304.22
57.098	CH ₂	4-Cl	A17		1,63	338.45
57.099	CH ₂	4-Cl	A11		1,65	301.17
57.100	CH ₂	4-Cl	A29		1,45	310.98
57.101	CH ₂	4-Cl	A21		1,56	334.22
57.102	CH ₂	4-Cl	A20		1,63	318.18
57.103	CH ₂	4-Cl	A24		1,49	301.73
57.104	CH ₂	4-Cl	A16		1,69	354.18
57.105	CH ₂	4-Cl	A12		1,69	411.53
57.106	CH ₂	4-Cl	A19		1,78	370.22
57.107	CH ₂	4-Cl	A8		1,71	372.19
57.108	CH ₂	4-Cl	A14		1,64	364.26
57.109	CH ₂	4-Cl	A22		1,02	301.29
57.110	CH ₂	4-Cl	A30		1,83	386.28
57.111	CH ₂	4-Cl	A28		1,45	322.05

*bất kỳ một trong số R_{9a}, R_{9b} và R_{9c} là hydro phụ thuộc vào phần tử thế được xác định trong mỗi dòng

+dữ liệu NMR:

57.011:

2,08 (1H, m); 2,37 (2H, m); 2,62 (1H, m); 4,26 (1H, m); 5,05 (1H, m); 5,42 (1H, m); 7,32 (2H, m); 7,41 (1H, s); 7,49 (1H, m); 7,65 (1H, m); 8,69 (1H, d).

57.012:

2,13 (IH, m); 2,39 (2H, m); 2,62 (IH, m); 4,28 (IH, m); 5,17 (IH, m); 7,33 (3H, m); 7,42 (IH, d); 7,75 (1H, br d); 8,76 (1H, d).

57.013:

2,18 (IH, m); 2,35 (2H, m); 2,62 (IH, m); 3,39 (IH, m); 5,07 (IH, m); 7,20 (2H, d); 7,27 (2H, d); 7,38 (1H, t); 7,75 (IH, br d); 8,75 (2H, d).

57.015:

2,11 (IH, m); 2,30 (2H, m); 2,61 (IH, m); 4,15 (IH, m); 5,02 (IH, m); 5,53 (1H, br d); 4,10 (1H, d); 7,10 (IH, m); 7,17 (2H, m); 7,27 (1H, m); 7,47 (2H, m); 7,61 (IH, d).

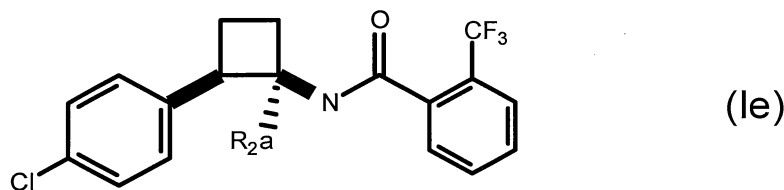
57.004:

4,51 (1H, dd); 5,18 (1H, dd); 5,50 (1H, ddd); 5,69 (1H, br d); 6,08 (1H, d); 6,90 (1H, d); 7,35 – 7,77 (7H, m).

Phương pháp HP LC-MS đối với 57.047 và 57.070 đến 57.111

Quang phổ được ghi trên Khối phổ kế từ Waters (Khối phổ kế mạch bốn cực đơn SQD hoặc ZQ) được trang bị nguồn phun điện (Phân cực: ion dương hoặc âm, Mao quản: 3.00 kV, Dải côn: 30-60 V, Bộ chiết: 2.00 V, Nhiệt độ nguồn: 150°C, Nhiệt độ khử solvat: 350°C, Luồng Khí Côn: 0 L/Giờ, Luồng Khí Khử solvat: 650 L/Giờ, Dải Khối lượng: 100 đến 900 Da) và Acquity UPLC có từ Waters: Bơm hai kỳ, ngăn cột được gia nhiệt và máy dò mạng điốt. Bộ tiết lưu dung môi, bơm hai kỳ, ngăn cột được gia nhiệt và máy dò mạng điốt. Cột: Waters UPLC HSS T3, 1,8mm, 30 x 2,1mm, Nhiệt độ: 60 °C, Dải chiều dài sóng DAD (nm): 210 đến 500, Gradient Dung môi: A = nước + 5% MeOH + 0,05% HCOOH, B= Axetonitril + 05% HCOOH: gradient: gradient: 0 phút 0% B, 100%A; 1,2-1,5 phút 100% B; Dòng chảy (ml/phút) 0,85.

Bảng 58 sau đây là danh mục các hợp chất có công thức Ie đặc trưng. Ở đây đại diện công thức I, trong đó B là 4-clophenyl, A là A6, Y là CH₂ và R₁, R₃, R₄, và R₅ là H.



Hợp chất số	R _{2a}	điểm nóng chảy [°C]	Thời gian lưu [phút]	M ⁺ H ⁺
58.001	-OMe	85 - 93		

58.002	-CN	130 136	-		
--------	-----	------------	---	--	--

Phương pháp LC-MS:

Khối phổ kế ACQUITY SQD từ Waters (Khối phổ kế bốn cực đơn)

Phương pháp ion hóa: Phun điện

Phân cực: ion dương

Mao quản (kV) 3,00, Côn (V) 20,00, Thiết bị chiết (V) 3,00, Nhiệt độ ban đầu (°C) 150, Nhiệt độ cân solvat hóa (°C) 400, Lưu lượng khí côn (L/Giờ) 60, Lưu lượng khí cân solvat hóa (L/Giờ) 700

Dải khối lượng: 100 đến 800 Da

Dải chiều dài sóng DAD (nm): 210 đến 400

Phương pháp nước ACQUITY UPLC với các điều kiện gradient HPLC sau đây

(Dung môi A: Nước/Metanol 9:1, 0,1% axit formic và Dung môi B: Axetonitril, 0,1% axit formic)

Thời gian (phút)	A (%)	B (%)	Tốc độ dòng (ml/phút)
0	100	0	0,75
2,5	0	100	0,75
2,8	0	100	0,75
3,0	100	0	0,75

Kiểu cột: Waters ACQUITY UPLC HSS T3; Chiều dài cột: 30 mm; Đường kính trong của cột: 2,1mm; Kích thước hạt: 1,8 micron; Nhiệt độ: 60°C.

Các ví dụ sinh học:

Hoạt tính tiếp xúc *Meloidogyne spp.* (Giun tròn gây đốt rế), phòng ngừa. Thử nghiệm trong túi.

Giấy lọc (9 cm x 4.5 cm) với túi nhỏ được đặt vào trong túi chất dẻo (12 cm x 6 cm). Một hạt dưa chuột cv. Toshka được đặt vào giữa túi giấy lọc của tất cả các túi cần cho thử nghiệm. Hạt dưa chuột trong các túi được xử lý bằng dung dịch thử ở 200 ppm bằng cách hút dung dịch trực tiếp lên hạt dưa chuột trong túi giấy lọc trong túi. Trước khi sử dụng, dung dịch chứa hợp chất được điều chế hai lần ở nồng độ yêu cầu và huyền phù trứng được điều chế bằng dung dịch dinh dưỡng FORL 3000 trứng/ 0,5ml.

Sau khi sử dụng toàn bộ xử lý, 3000 trứng (trong 0,5ml dung dịch dinh dưỡng FORL) được hút vào trong túi. Các túi được ủ trong phòng ẩm trong mười hai ngày và được tưới nước thường xuyên để duy trì độ ẩm của giấy lọc tốt cần thiết để phát triển hệ rễ dưa chuột. Sau thời gian này, giấy lọc chứa hạt dưa chuột nảy mầm được đưa ra khỏi túi chất dẻo để tạo ra với nhiều mụn cây gây ra bởi *Meloidogyne spp.* cho mỗi hệ rễ.

Các hợp chất sau đây thể hiện hơn 80% phản ứng khử mụn cây so với đối chứng không xử lý: 57.009, 57.010, 57.011, 57.017, 57.012, 57.015, 57.014, 57.006, 57.016, 57.018, 57.020, 57.021, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.028, 57.029, 57.030, 57.031, 57.033, 57.035, 57.036, 57.037, 57.039, 57.047, 57.048, 57.051, 57.052, 57.054, 57.055, 57.056, 57.057.

Thử nghiệm ngâm, phòng ngừa, hoạt tính tiếp xúc *Meloidogyne spp.* (Giun tròn gây đốt rễ).

Hạt dưa chuột cv. Toshka được gieo trực tiếp trong các bình đồ đầy nền cát. Sáu ngày sau khi mỗi bình được xử lý bằng 5ml huyền phù WP10 của hợp chất thử ở 20 ppm. Sau đó các bình được ủ với 3000 trứng *M. incognita*. Thử nghiệm được thu mười bốn ngày sau khi sử dụng thử nghiệm và chủng ngừa. Mụn rễ được đánh giá theo chỉ số mụn cây Zeck (Zeck, 1971).

Các hợp chất sau đây thể hiện hơn 80% phản ứng khử mụn cây so với đối chứng không xử lý: 57.001, 57.002, 57.003, 57.004, 57.005, 57.006, 57.007, 57.008, 57.010, 57.011, 57.014, 57.015, 57.016, 57.017, 57.018, 57.020, 57.021, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.026, 57.028, 57.029, 57.031, 57.032, 57.033, 57.034, 57.035, 57.036, 57.037, 57.039, 57.040, 57.041, 57.042, 57.047, 57.048, 57.051, 57.052, 57.054, 57.055, 57.056, 57.057

Heterodera schachtii

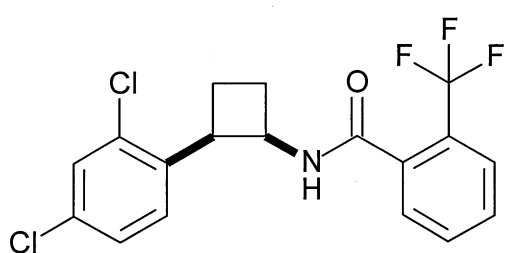
0,5ml dung dịch nước của hợp chất thử (200 ppm hoặc 20 ppm) được hút vào trong mỗi một trong số ba giếng. 0,5ml huyền phù giun tròn chứa xấp xỉ 200 -500 ấu trùng J2 của *Heterodera schachtii* được thêm vào mỗi giếng. Sau khi lưu trữ trong bóng tối

ở 25 °C trong 48 giờ, tỷ lệ chết của ấu trùng được đánh giá và lấy trung bình của ba giếng.

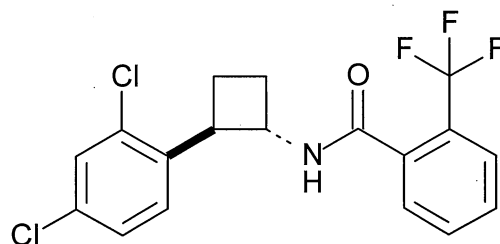
Giun tròn có 0 đến 40% hoạt động trong các giếng được xử lý bằng 20ppm các hợp chất 57.033, 57.035, 57.036, 57.037, 57.040, 57.041, 57.043, 57.044, 57.055, 57.056, 57.057.

Giun tròn có 0 đến 40% hoạt động trong các giếng được xử lý bằng 200ppm các hợp chất 57.007, 57.008, 57.009, 57.010, 57.011, 57.017, 57.018, 57.020, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.028, 57.029, 57.030, 57.031, 57.039, 57.047, 57.048.

Bảng 59 dưới đây thể hiện sự so sánh của hoạt tính diệt giun tròn của các chất đồng phân cis, là đối tượng theo sáng chế với các chất đồng phân trans tương ứng của chúng. Các chất đồng phân trans thu được bằng cách sử dụng phương pháp P2 ở trên và tách biệt với các chất đồng phân cis của chúng như được mô tả trong phương pháp P2d. Trong bảng này, chúng được đánh số thứ tự theo các chất đồng phân cis của chúng với hậu tố “trans” như được thể hiện trong ví dụ này 57-009 và 57-009trans



Hợp chất 57-009
chất đồng phân cis



hợp chất 57-009trans
chất đồng phân trans

Bảng 59

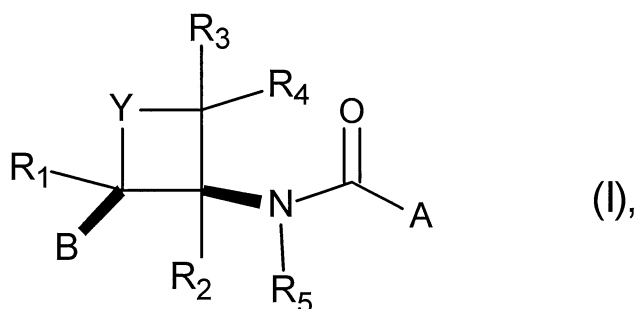
Hợp chất số	hóa học lập thể	Nem 1	Nem 2	điểm nóng chảy .[°C]	Thời gian lưu	M+H+
57.009	cis	100	nt			
57.009trans	trans	68	48	147 - 148		
57.011	cis	100	100			
57.011trans	trans	84	64		1,88	389
57.012	cis	98	83			

57.012trans	trans	1	nt		1,71	322
57.014	cis	93	100			
57.014trans	trans	69	13	117 - 119		

- Biological Screen Nem 1. Phòng ngừa hoạt tính tiếp xúc *Meloidogyne spp.* (Giun tròn gây đốt rế). Thử nghiệm trong túi. Các giá trị được tính theo % tạo mụn rế.
- Biological Screen Nem 2. Thử nghiệm ngâm phòng ngừa hoạt tính tiếp xúc *Meloidogyne spp.* (Giun tròn gây đốt rế). Các giá trị được tính theo % tạo mụn rế.
- nt nghĩa là không được thử nghiệm.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I)



trong đó :

Y là O, C=O, hoặc CR¹²R¹³;

A là dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại, mỗi độc lập được chọn từ oxy, nitơ và lưu huỳnh, hoặc vòng phenyl; dị vòng thơm hoặc phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều R⁶;

R⁶ là, độc lập với nhau, halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-haloalkylthio, C1-C4-alkoxy-C1-4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkoxy-C1-C4-alkyl;

R¹, R², R³, R⁴, R¹² và R¹³, độc lập với nhau là hydro, halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-alkoxy hoặc C1-C4-haloalkyl,

R⁵ là hydro, metoxy hoặc hydroxyl,

B là phenyl được thế bằng một hoặc nhiều R⁸,

R⁸ là, độc lập với nhau, halogen, xyano hoặc nhóm -L-R⁹, trong đó mỗi L độc lập với nhau là liên kết, -O-, -OC(O)-, -NR⁷-, -NR⁷CO-, -NR⁷S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR⁷-, -COO- hoặc CONR⁷-,

n là 0, 1 hoặc 2,

R⁷ là hydro, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, benzyl hoặc phenyl, trong đó benzyl và phenyl không được thế hoặc được thế bằng halogen, xyano, C1-C4-alkyl hoặc C1-C4-haloalkyl,

R⁹ là, độc lập với nhau, C1-C6-alkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R¹⁰, C3-C6-xycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều

R10, C6–C14-bixycloalkyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkenyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, C2-C6-alkynyl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10, phenyl, không được thế hoặc được thế bằng R10, hoặc heteroaryl, không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R10,

R10 là, độc lập với nhau, halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-alkoxy, C1-C4-haloalkoxy, C1-C4-alkylthio, C1-C4-haloalkylthio, C3-C6-alkenyloxy, hoặc C3-C6-alkynyloxy;

hoặc muối hoặc N-oxit của chúng;

trong đó B và A-CO-NR5 là cis với nhau trên vòng bốn cạnh,

hoặc chất hỗ biến hoặc chất đồng phân lập thể của các hợp chất này.

2. Hợp chất theo điểm 1 trong đó Y là O hoặc CH₂;

A dị vòng thơm 6 cạnh chứa 1 đến 2 nguyên tử nitơ, hoặc vòng phenyl; dị vòng thơm hoặc phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều R6;

R6 là, độc lập với nhau, halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, hoặc C1-C4-haloalkoxy;

mỗi R1, R2, R3, R4, và R5 là hydro;

B là phenyl được thế bằng một hoặc nhiều R8;

R8 là, độc lập với nhau, được chọn từ halogen, xyano, C1-C4-alkyl, C1-C4-haloalkyl, C1-C4-haloalkoxy, hoặc C3-C6-xycloalkyl.

3. Hợp chất theo hoặc điểm 1 hoặc điểm 2 trong đó A dị vòng thơm 6 cạnh chứa 1 đến 2 nguyên tử nitơ và có 1 đến 3 phần tử thế được chọn từ R6, hoặc vòng phenyl có 1 hoặc 3 phần tử thế được chọn từ R6.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 trong đó B là phenyl được thế bằng 1 đến 3 phần tử thế R8.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4 trong đó B là phenyl được thế bằng 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn từ flo, clo, triflometyl, xyclopropyl, diflometoxy và triflometoxy;

A là phenyl, pyridyl hoặc pyrazinyl, mà các vòng, độc lập với nhau, không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 phần tử thế, độc lập được chọn, từ clo, bromo, flo, metyl, xyano, và triflometyl, Y là O hoặc CH₂, và R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là hydro.

6. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 trong đó

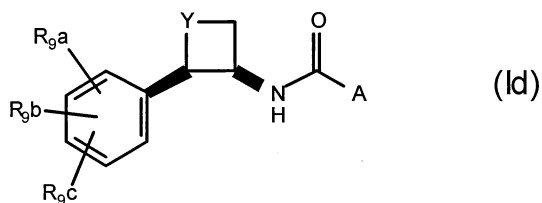
Y là CH₂;

B là phenyl được thế bằng halogen một lần hoặc hai lần;

A được chọn từ phenyl, pyrazinyl và pyridyl, mỗi nhóm trong số này được thế một lần hoặc hai lần bằng phần tử thế độc lập được chọn từ halogen và C₁-C₄-haloalkyl;

R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là hydro.

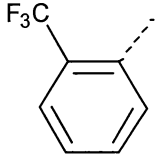
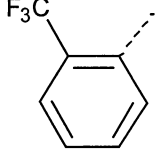
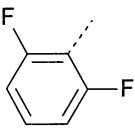
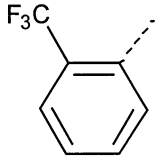
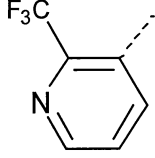
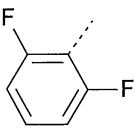
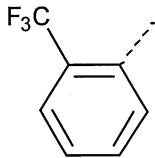
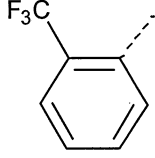
7. Hợp chất theo điểm 1 trong đó hợp chất này được chọn từ hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1 đến 118 có công thức (Id)

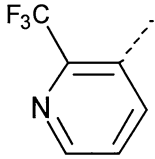
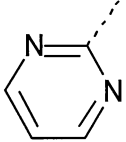
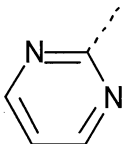
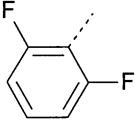
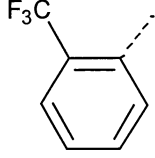
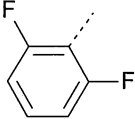
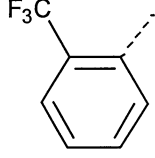
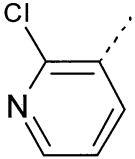


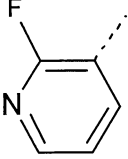
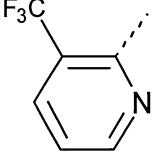
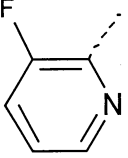
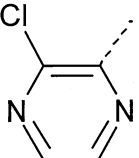
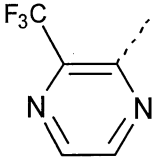
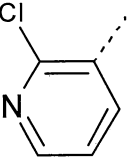
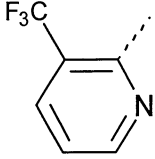
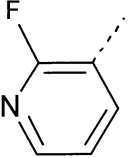
hoặc muối hoặc N-oxit của chúng;

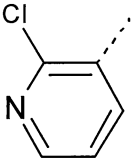
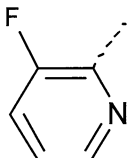
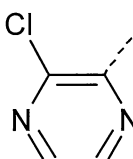
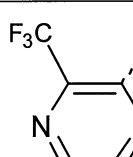
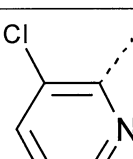
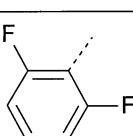
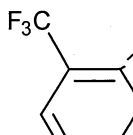
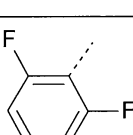
trong đó Y, R_{9a}, R_{9b}, R_{9c} và A là như được xác định trong bảng sau đây:

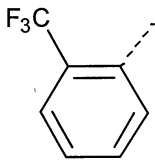
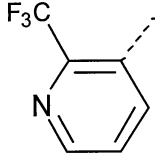
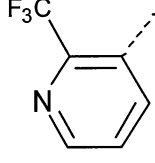
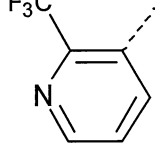
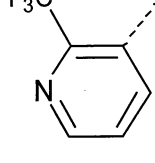
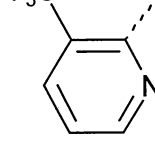
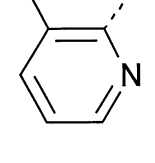
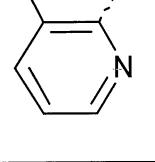
Hợp chất số	Y	R _{9a} , R _{9b} , R _{9c} *	A
1	CH ₂	4-OCF ₃	
2	CH ₂	4-OCF ₃	

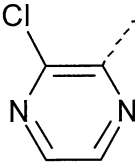
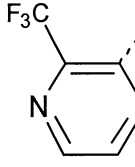
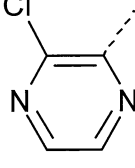
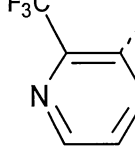
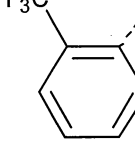
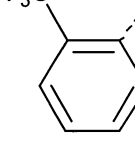
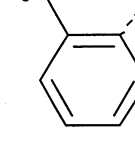
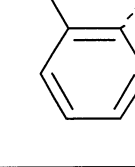
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
3	CH ₂	4-OCF ₃	
4	O	4-Cl	
5	CH ₂	4-Cl	
6	CH ₂	4-Cl	
7	CH ₂	4-Cl	
8	CH ₂	2,4-Cl ₂	
9	CH ₂	2,4-Cl ₂	
10	O	4-F	

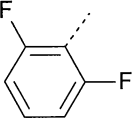
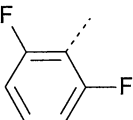
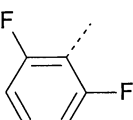
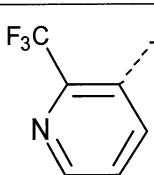
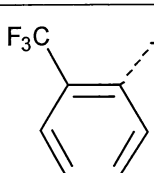
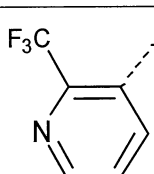
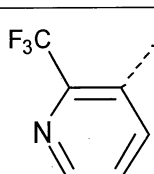
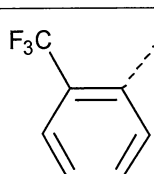
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
11	CH ₂	2,4-Cl ₂	
12	CH ₂	2,4-Cl ₂	
13	CH ₂	4-Cl	
14	CH ₂	2-F,4-Cl	
15	CH ₂	2-F,4-Cl	
16	CH ₂	4-OCHF ₂	
17	CH ₂	4-OCHF ₂	
18	CH ₂	4-Cl	

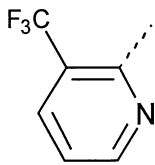
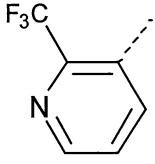
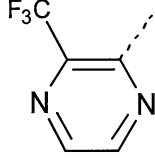
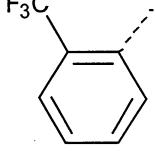
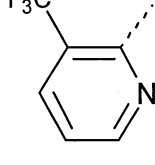
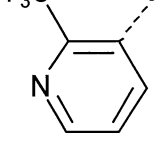
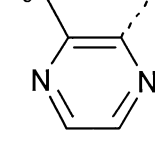
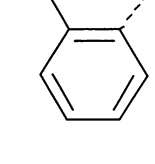
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
19	CH ₂	4-Cl	
20	CH ₂	4-Cl	
21	CH ₂	4-Cl	
22	CH ₂	4-Cl	
23	CH ₂	4-Cl	
24	CH ₂	4-Cl	
25	CH ₂	2,4-Cl ₂	
26	CH ₂	2,4-Cl ₂	

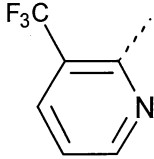
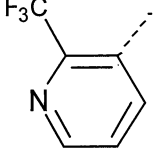
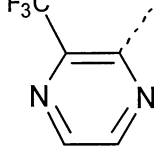
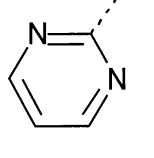
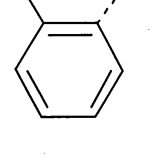
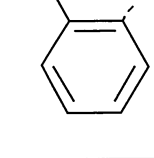
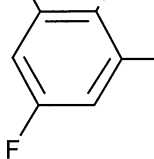
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
27	CH ₂	2,4-Cl ₂	
28	CH ₂	2,4-Cl ₂	
29	CH ₂	2,4-Cl ₂	
30	CH ₂	2,4-Cl ₂	
31	CH ₂	2,4-Cl ₂	
32	CH ₂	4-F	
33	CH ₂	4-F	
34	CH ₂	4-Br	

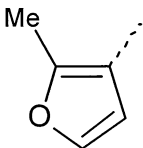
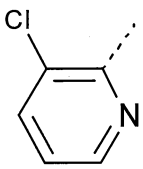
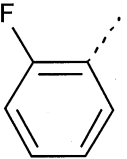
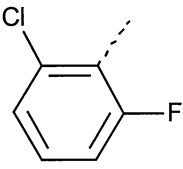
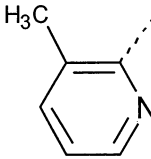
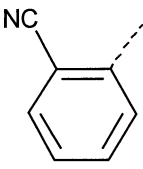
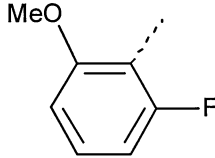
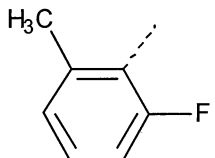
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
35	CH ₂	4-Br	
36	not tested	4-F	
37	CH ₂	4-Br	
38	CH ₂	4-cPr	
39	CH ₂	4-CN	
40	CH ₂	4-F	
41	CH ₂	4-F	
42	CH ₂	4-F	

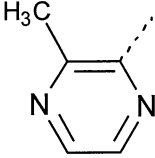
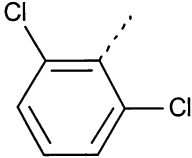
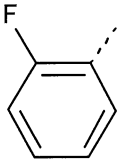
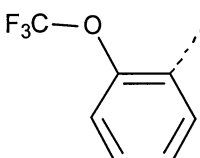
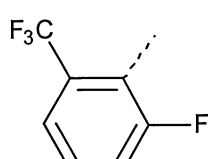
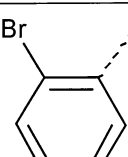
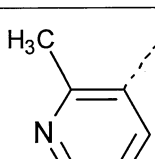
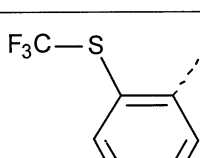
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
43	CH ₂	4-F	
44	CH ₂	4-F	
45	CH ₂	4-Br	
46	CH ₂	4-Br	
47	O	2,4,6-F ₃	
48	O	4-OCHF ₂	
49	O	4-CF ₃	
50	O	2-F, 4-CF ₃	

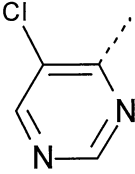
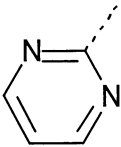
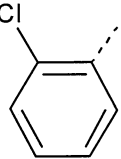
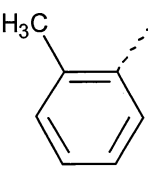
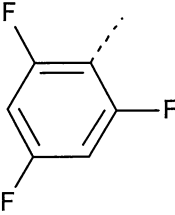
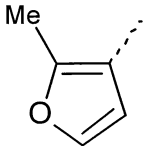
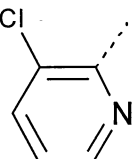
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
51	O	2,4-F ₂	
52	O	2,4,6-F ₃	
53	O	4-F	
54	O	4-F	
55	O	2,4-F ₂	
56	O	2,4-F ₂	
57	O	2,4,6-F ₃	
58	CH ₂	2,4-F ₂	

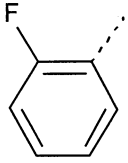
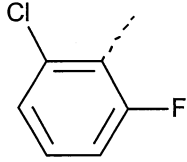
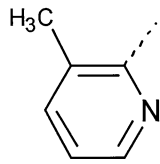
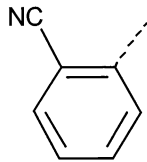
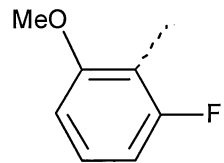
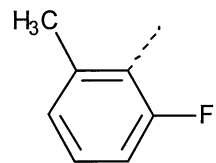
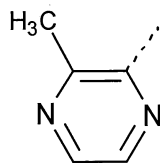
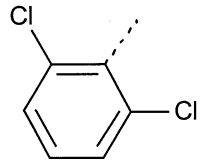
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
59	CH2	2,4-F2	
60	CH2	2,4-F2	
61	CH2	2,4-F2	
62	CH2	2-Cl, 4-CF3	
63	CH2	2-Cl, 4-CF3	
64	CH2	2-Cl, 4-CF3	
65	CH2	2-Cl, 4-CF3	
66	CH2	2-F, 4-CF3	

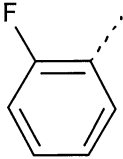
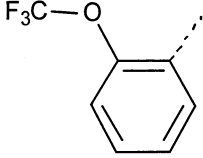
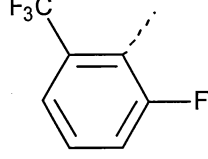
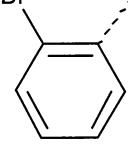
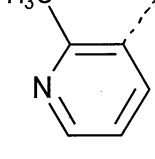
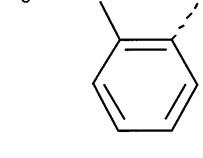
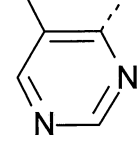
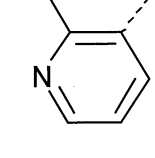
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
67	CH2	2-F, 4-CF3	
68	CH2	2-F, 4-CF3	
69	CH2	2-F, 4-CF3	
70	CH2	2,4-Cl2	
71	CH2	2,4-Cl2	
72	CH2	2,4-Cl2	
73	CH2	2,4-Cl2	

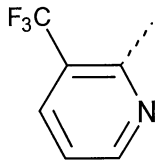
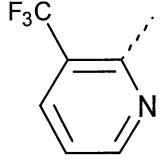
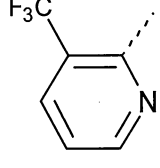
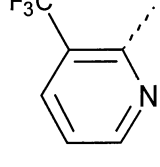
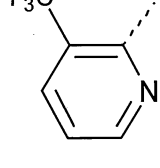
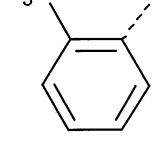
Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
74	CH2	2,4-Cl2	
75	CH2	2,4-Cl2	
76	CH2	2,4-Cl2	
77	CH2	2,4-Cl2	
78	CH2	2,4-Cl2	
79	CH2	2,4-Cl2	
80	CH2	2,4-Cl2	
81	CH2	2,4-Cl2	

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
82	CH2	2,4-Cl2	
83	CH2	2,4-Cl2	
84	CH2	2,4-Cl2	
85	CH2	2,4-Cl2	
86	CH2	2,4-Cl2	
87	CH2	2,4-Cl2	
88	CH2	2,4-Cl2	
89	CH2	2,4-Cl2	

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
90	CH2	2,4-Cl2	
91	CH2	4-Cl	
92	CH2	4-Cl	
93	CH2	4-Cl	
94	CH2	4-Cl	
95	CH2	4-Cl	
96	CH2	4-Cl	

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
97	CH2	4-Cl	
98	CH2	4-Cl	
99	CH2	4-Cl	
100	CH2	4-Cl	
101	CH2	4-Cl	
102	CH2	4-Cl	
103	CH2	4-Cl	
104	CH2	4-Cl	

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
105	CH2	4-Cl	
106	CH2	4-Cl	
107	CH2	4-Cl	
108	CH2	4-Cl	
109	CH2	4-Cl	
110	CH2	4-Cl	
111	CH2	4-Cl	
112	CH2	2-Cl, 4-F	

Hợp chất số	Y	R9a,R9b, R9c*	A
113	CH2	2-Cl, 4-F	
114	CH2	2-Cl, 4-Br	
115	CH2	2,4-F2	
116	CH2	4-OCF3	
117	CH2	2-F, 4-Cl	
118	CH2	2-Cl, 4-F	

và trong đó bất kỳ trong số R9a, R9b và R9c là hydro trừ khi có quy định khác; hoặc chất hỗ biến hoặc chất đồng phân lập thể của các hợp chất này.

8. Hợp chất, hoặc muối hoặc N-oxit của nó, theo điểm 1 được chọn từ ;
 N-[(1,2 cis)-2-(4-clophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2,6-diflobenzamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamit;

N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diflophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diflophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diflophenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyrazine-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-clo-4-(triflometyl)phenyl]cyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-clo-4-(triflometyl)phenyl]cyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-clo-4-(triflometyl)phenyl]cyclobutyl]-3-(triflometyl)pyrazin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-flo-4-(triflometyl)phenyl]xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-flo-4-(triflometyl)phenyl]xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-flo-4-(triflometyl)phenyl]xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-[2-flo-4-(triflometyl)phenyl]xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyrazin-2-carboxamit;
 2-(triflometyl)-N-[(2,3 cis)-2-(2,4,6-triflophenyl)oxetan-3-yl]benzamit;
 2,6-diflo-N-[(2,3 cis)-2-(2,4,6-triflophenyl)oxetan-3-yl]benzamit;
 N-[(2,3 cis)-2-(2,4-diflophenyl)oxetan-3-yl]-2-(triflometyl)benzamit;
 N-[(2,3 cis)-2-(2,4-diflophenyl)oxetan-3-yl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 3-clo-N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]pyrazin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 3-clo-N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2-metylpyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-3-metylpyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diflophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 2-clo-N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diclo-phenyl)-xyclobutyl]-nicotinamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2-clo-4-flo-phenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)pyridin-3-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2-clo-4-flo-phenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2cis)-2-(4-bromo-2-clo-phenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(2,4-diflophenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;

N-[(1,2 cis)-2-(4-metoxyphenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit;
 N-[(1,2 cis)-2-(4-clo-2-flo-phenyl)xyclobutyl]-3-(triflometyl)pyridin-2-carboxamit; và
 N-[(1,2 cis)-2-(2-clo-4-flo-phenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)benzamit;
 hoặc chất hồ biến hoặc đồng phân lập thể của các hợp chất này.

9. Chế phẩm diệt loài gây hại, trong đó, ngoài chất phụ gia bào chế, chế phẩm này còn chứa lượng hiệu quả diệt loài gây hại của hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8.

10. Chế phẩm theo điểm 9, trong đó chế phẩm này còn chứa một hoặc nhiều chất có hoạt tính diệt côn trùng, ve bét, giun tròn và/ hoặc nấm khác.

11. Phương pháp kiểm soát thiệt hại và/ hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/ hoặc nấm, trong đó phương pháp này bao gồm việc sử dụng cho loài gây hại, hoặc cho thực vật dễ bị tấn công bởi loài gây hại và/ hoặc nấm, hoặc cho nơi cư trú của chúng, hoặc cho vật liệu nhân giống thực vật lượng hiệu quả hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8 hoặc chế phẩm theo điểm 9 hoặc 10.

12. Phương pháp bảo vệ vật liệu nhân giống thực vật khỏi thiệt hại và/ hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại và/ hoặc nấm, trong đó phương pháp này bao gồm sử dụng cho vật liệu nhân giống thực vật hoặc địa điểm, nơi vật liệu nhân giống được trồng, lượng có hiệu quả của hợp chất như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8 hoặc chế phẩm xác định theo điểm 9 hoặc 10.

13. Phương pháp theo điểm 11 hoặc điểm 12, trong đó thiệt hại hoặc thất thu gây ra bởi loài gây hại là giun tròn.

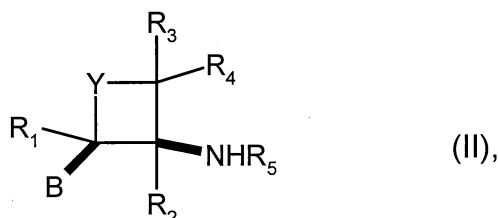
14. Vật liệu nhân giống thực vật được bao, trong đó lớp bao của vật liệu nhân giống thực vật chứa hợp chất như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8.

15. Dược phẩm để kiểm soát giun sán, động vật thuộc lớp nhện hoặc vật ký sinh bên trong hoặc bên ngoài chân khớp chứa hợp chất như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8, chất mang sinh lý dụng và tùy ý một hoặc nhiều chất phụ gia bào chế thông thường.

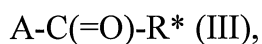
16. Dược phẩm chứa hợp chất được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8, chất mang sinh lý dụng, và tùy ý một hoặc nhiều chất phụ gia bào chế thông thường để phòng ngừa nhiễm bệnh truyền nhiễm do giun sán, động vật thuộc lớp nhện hoặc vật ký sinh bên trong hoặc bên ngoài chân khớp.

17. Dược phẩm theo điểm 15 hoặc 16, trong đó dược phẩm này còn chứa một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính sinh học khác.

18. Quy trình điều chế hợp chất có công thức I theo điểm 1, bao gồm cho hợp chất có công thức II

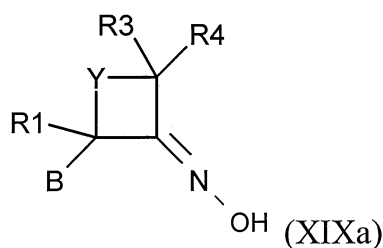


trong đó B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ và R₅ là như được xác định theo điểm 1, phản ứng với chất axyl hóa có công thức III

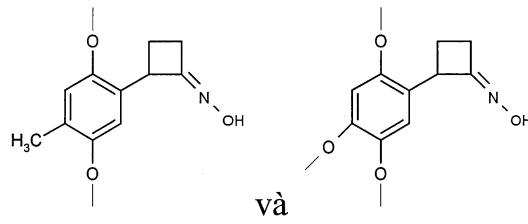


trong đó A là như được xác định theo điểm 1, và R* là halogen, hydroxyl hoặc C₁₋₆alkoxy, với sự có mặt của bazơ.

19. Hợp chất có công thức (XIXa)

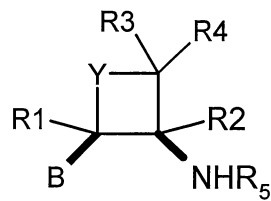


trong đó B, Y, R1, R3 và R4 là như được xác định theo điểm 1, trong đó các hợp chất có công thức



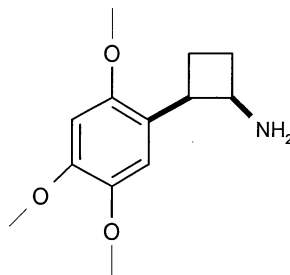
bị loại trừ.

20. Hợp chất có công thức (II)



(II)

trong đó B, Y, R1, R2, R3, R4 và R5 là như được xác định theo điểm 1, trong đó hợp chất có công thức



bị loại trừ.