



(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)



1-0027109

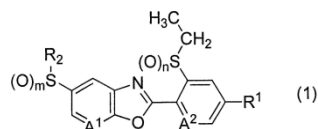
(51)⁷ C07D 263/57; C07D 498/04; A01N
43/76

(13) B

- (21) 1-2015-02615 (22) 26/12/2013
(86) PCT/JP2013/085339 26/12/2013 (87) WO 2014/104407 A1 03/07/2014
(30) 2012-284302 27/12/2012 JP; 2013-015197 30/01/2013 JP
(45) 25/01/2021 394 (43) 26/10/2015 331A
(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 Japan
(72) TAKAHASHI, Masaki (JP); TANABE, Takamasa (JP); ITO, Mai (JP); IWATA,
Atsushi (JP); NOKURA, Yoshihiko (JP).
(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG NGỪNG TỤ, TÁC NHÂN DIỆT TRỪ SINH VẬT GÂY
HẠI CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP DIỆT TRỪ SINH VẬT GÂY
HẠI SỬ DỤNG HỢP CHẤT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (1):



trong đó A^1 là $N(O)_p$ hoặc CH ; A^2 là $N(O)_q$; R^1 là nhóm triflometyl, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro; R^2 là nhóm C1-C3 perfluoralkyl, p là 0 hoặc 1; q là 0 hoặc 1; n là 0, 1 hoặc 2; và m là 0, 1 hoặc 2, có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại rất tốt. Sáng chế cũng đề cập đến tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại chứa hợp chất này và phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại sử dụng hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất dị vòng ngưng tụ và phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại sử dụng hợp chất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Để diệt trừ sinh vật gây hại, các hợp chất khác nhau đã được phát triển và được sử dụng trong thực tiễn.

Ngoài ra, một số hợp chất dị vòng ngưng tụ là đã biết (xem tài liệu sáng chế 1).

Danh mục tài liệu

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: JP 2004-34438 A

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề kỹ thuật

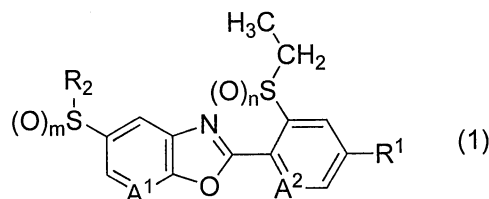
Mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại rất tốt và phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại bằng cách sử dụng hợp chất này.

Cách thức giải quyết vấn đề

Các tác giả sáng chế đã nghiên cứu kỹ và kết quả là họ đã phát hiện ra rằng hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức (1) sau đây có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại rất tốt. Do vậy, sáng chế đã được hoàn thành.

Sáng chế gồm có các giải pháp kỹ thuật sau đây:

[1] Hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức (1):



trong đó:

A¹ là N(O)_p hoặc CH,

A^2 là $N(O)_q$,

R^1 là nhóm triflometyl, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro,

R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl,

p là 0 hoặc 1,

q là 0 hoặc 1,

n là 0, 1 hoặc 2,

m là 0, 1 hoặc 2,

với điều kiện là khi A^1 là NO và/hoặc A^2 là NO, n là 2 và m là 2.

(sau đây được gọi là “hợp chất này”).

[2] Hợp chất theo mục [1] nêu trên, trong đó A^1 là CH.

[3] Hợp chất theo mục [1] nêu trên, trong đó A^1 là N.

[4] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên, trong đó R^1 là nguyên tử hydro.

[5] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên, trong đó R^1 là nhóm triflometyl.

[6] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [5] nêu trên, trong đó R^2 là nhóm triflometyl.

[7] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] nêu trên, trong đó p là 0 và q là 0.

[8] Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại chứa hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên và chất mang trợ.

[9] Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo mục [8] nêu trên, trong đó chất mang trợ là nước và hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên được phân tán trong nước chứa chất hoạt động bề mặt.

[10] Phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun một lượng hữu hiệu hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên.

[11] Phương pháp theo mục [10] nêu trên, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun một lượng hữu hiệu hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên lên cuống và lá của cây hoặc đất nơi cây phát triển.

[12] Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo mục [8] nêu trên, trong đó chất mang trợ là chất mang ăn.

[13] Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo mục [8] nêu trên, trong đó chất mang trợ là dung môi và khí đẩy.

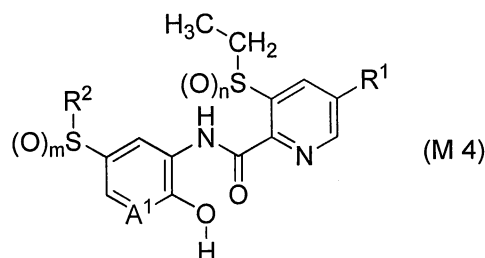
[14] Phương pháp theo mục [10] nêu trên, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo mục [13] nêu trên lên sinh vật gây hại và/hoặc chỗ sinh vật gây hại trú ngụ.

[15] Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo mục [8] nêu trên, trong đó chất mang trợ là tác nhân tạo khí.

[16] Phương pháp theo mục [10] nêu trên, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên lên bề mặt thân của động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại.

[17] Phương pháp theo mục [10] nêu trên, trong đó phương pháp này bao gồm bước cho động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại dùng qua đường miệng hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7] nêu trên.

[18] Hợp chất có công thức (M4):



trong đó:

A¹ là N hoặc CH,

R¹ là nhóm triflometyl, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro,

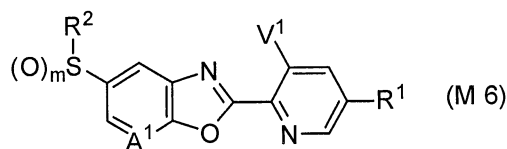
R² là nhóm C1-C3 perfluoralkyl,

n là 0, 1 hoặc 2,

m là 0, 1 hoặc 2.

(sau đây được gọi là “hợp chất trung gian (có công thức M4)”).

[19] Hợp chất có công thức (M6):



trong đó:

A¹ là N hoặc CH,

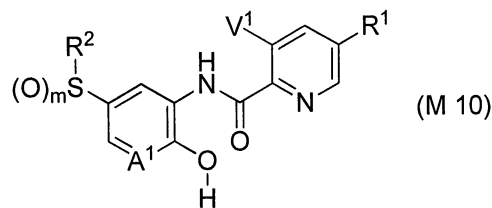
V¹ là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

R² là nhóm C1-C3 perfluoralkyl,

m là 0, 1 hoặc 2.

(sau đây được gọi là “hợp chất trung gian (có công thức M6)”).

[20] Hợp chất có công thức (M10):



trong đó:

A^1 là N hoặc CH,

V^1 là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

R^2 là nhóm C1-C3 perfluoroalkyl,

m là 0, 1 hoặc 2.

(sau đây được gọi là “hợp chất trung gian (có công thức M10)”).

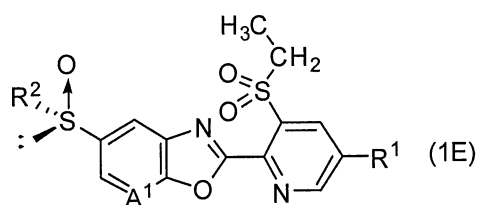
Hiệu quả của sáng chế

Hợp chất này có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại rất tốt và do đó hữu dụng làm thành phần hoạt tính của tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại.

Hợp chất có công thức (1) trong đó n là 1 và/hoặc m là 1 gồm có các chất đồng phân lập thể. Mỗi chất đồng phân lập thể có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại rất tốt.

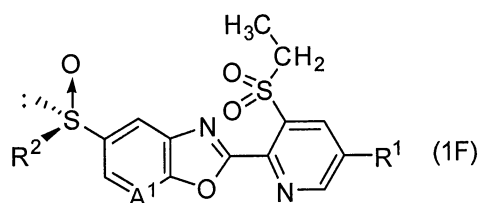
Các ví dụ về các chất đồng phân lập thể này gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (1E):



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất có công thức (1F):



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phương thức để thực hiện sáng chế

Các nhóm được sử dụng ở đây sẽ được minh họa chi tiết bằng các ví dụ.

“Nguyên tử halogen” trong hợp chất này gồm có nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom và nguyên tử iot.

“Ca-Cb perfloalkyl” được sử dụng ở đây là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có a-b nguyên tử cacbon, mà tất cả các nguyên tử hydro gắn vào được thế bằng các nguyên tử flo.

Các ví dụ về “nhóm C1-C3 perfloalkyl” gồm có nhóm triflometyl, nhóm pentafloetyl, nhóm heptaflopropyl và nhóm heptafloisopropyl.

Các ví dụ về hợp chất này gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^2 là N;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nguyên tử flo;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nguyên tử clo;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nguyên tử brom;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nguyên tử iot;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nguyên tử hydro;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^2 là nhóm pentafloetyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^2 là nhóm heptaflopropyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó R^2 là nhóm heptafloisopropyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó n là 0;

Hợp chất có công thức (1) trong đó n là 1;

Hợp chất có công thức (1) trong đó n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó m là 0;

Hợp chất có công thức (1) trong đó m là 1;

Hợp chất có công thức (1) trong đó m là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl và

R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl, R^2 là nhóm triflometyl và n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo, R^2 là nhóm triflometyl và n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom, R^2 là nhóm triflometyl và n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro, R^2 là nhóm triflometyl và n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl, R^2 là nhóm triflometyl và n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là N, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

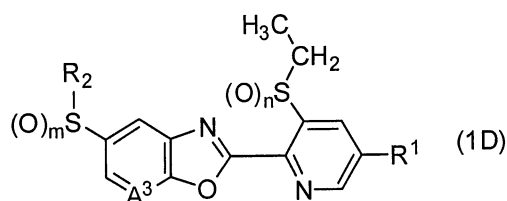
Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nhóm triflometyl, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử clo, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử brom, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, A^2 là N, R^1 là nguyên tử hydro, R^2 là nhóm triflometyl, n là 2 và m là 1 hoặc 2;

Các ví dụ cụ thể về hợp chất này trong đó p là 0 và q là 0 gồm có hợp chất có công thức (1D) (sau đây được gọi là “hợp chất (có công thức 1D)”):



trong đó A^3 là N hoặc CH và R^1 , R^2 , n và m là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là CH;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nguyên tử flo;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nguyên tử clo;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nguyên tử brom;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nguyên tử iot;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^1 là nguyên tử hydro;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^2 là nhóm pentafloropropyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^2 là nhóm heptafloropropyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó R^2 là nhóm heptaflorisopropyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N hoặc CH, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl và R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N hoặc CH, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

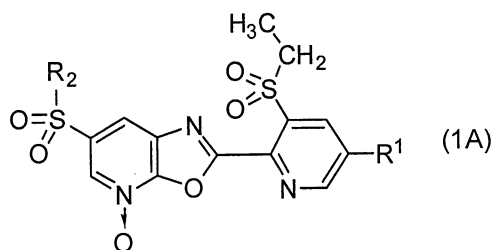
Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl, R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl, m là 0 hoặc 1 và n là 0 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là N, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl, R^2 là nhóm triflometyl, m là 0 hoặc 1 và n là 0 hoặc 2;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là CH, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl và R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl;

Hợp chất có công thức (1D) trong đó A^3 là CH, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Các ví dụ cụ thể về hợp chất này trong đó p là 1 và q là 0 gồm có hợp chất có công thức (1A) (sau đây được gọi là “hợp chất (có công thức 1A)”):



trong đó R^1 và R^2 là như được định nghĩa trong công thức (1).

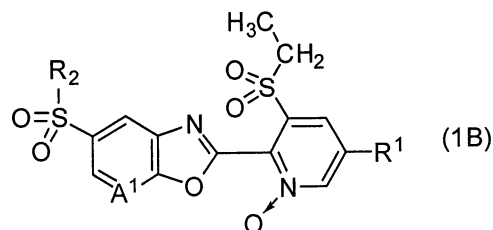
Hợp chất có công thức (1A) trong đó R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1A) trong đó R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1A) trong đó R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1A) trong đó R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Các ví dụ cụ thể về hợp chất này trong đó p là 0 và q là 1 gồm có hợp chất có công thức (1B) (sau đây được gọi là “hợp chất (1B)”):



trong đó A^1 là N hoặc CH và R^1 và R^2 là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

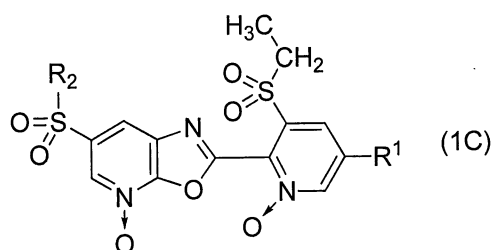
Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1B) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Các ví dụ cụ thể về hợp chất này trong đó p là 1 và q là 1 gồm có hợp chất có công thức (1C) (sau đây được gọi là “hợp chất (có công thức 1C)”):



trong đó R^1 và R^2 là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1C) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro hoặc nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (1) trong đó A^2 là NO, n là 2 và m là 2;

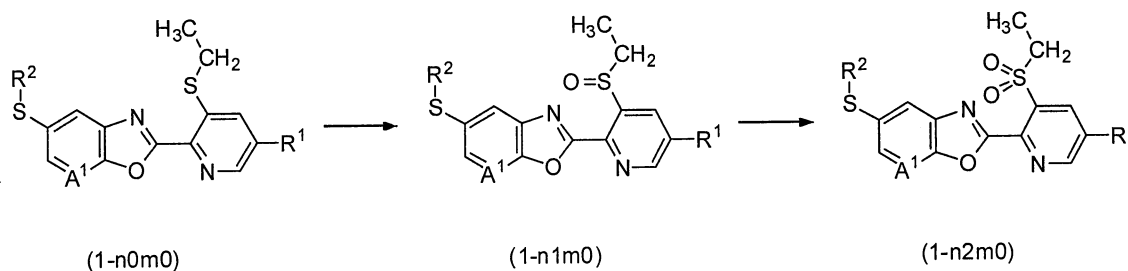
Mô tả chi tiết sáng chế

Các quy trình điều chế các hợp chất được mô tả dưới đây.

Hợp chất này và hợp chất trung gian của nó có thể được điều chế, ví dụ, bằng (quy trình điều chế 1) đến (quy trình điều chế 17) sau đây.

(Quy trình điều chế 1)

Hợp chất này có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 1 hoặc 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất này trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 0.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất (có công thức $1-n1m0$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức $1-n0m0$) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 0.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có natri periodat và axit m-cloperbenzoic.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n0m0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 1 đến 1,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n0m0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -50°C đến 50°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n1m0$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức $1-n1m0$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (có công thức $1-n2m0$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 2 có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất (có công thức $1-n1m0$) phản ứng trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 1 có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamat, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 4mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_1m_0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_1m_0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_1m_0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_1m_0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -50°C đến 100°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 2 có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$) phản ứng trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, m là 0 và n là 0 có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 2 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 2 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$).

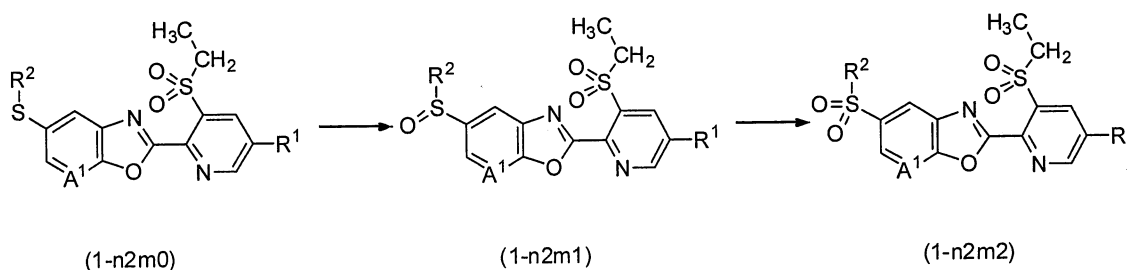
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến

120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức 1-n2m0) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức 1-n2m0) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

(Quy trình điều chế 2)

Các hợp chất (có công thức 1-n2m1) và/hoặc (có công thức 1-n2m2) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 1 hoặc 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n2m0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 0.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất (có công thức 1-n2m1) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n2m0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 0.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có natri periodat, axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-

$n2m0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 1 đến 1,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -50°C đến 100°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n2m1$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ, tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức $1-n2m1$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (có công thức $1-n2m2$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 2 có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất (có công thức $1-n2m1$) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 1 có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 4mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m1$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m1$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m1$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n2m1$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -50°C

đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n_2m_2$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất (có công thức $1-n_2m_2$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (có công thức $1-n_2m_2$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 2 có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 0 phản ứng có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 2 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 2 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_2m_0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

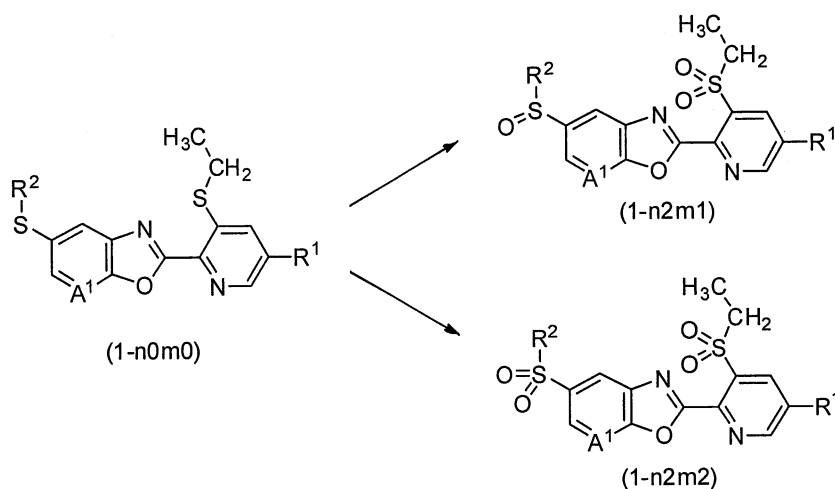
Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n_2m_2$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức $1-n_2m_2$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và

tương tự.

Trong quy trình điều chế của hợp chất (có công thức 1-n2m2) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 2, các hợp chất (có công thức 1A) và/hoặc (1B) và/hoặc (1C) cũng có thể được điều chế.

(Quy trình điều chế 3)

Các hợp chất (có công thức 1-n2m1) và/hoặc (có công thức 1-n2m2) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 1 hoặc 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n0m0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 0 và m là 0.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất (có công thức 1-n2m1) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 1 có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất (có công thức 1-n0m0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 0 và m là 0 phản ứng có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocarbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm

trong khoảng từ 3 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 3 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức $1-n_2m_1$) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức $1-n_2m_1$) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (có công thức $1-n_2m_2$) có công thức (1) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 2 có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 0 và m là 0 phản ứng có mặt chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 4 đến 15mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 4 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức $1-n_0m_0$).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến

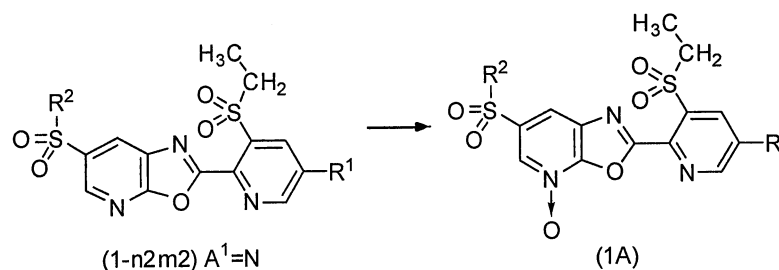
120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức 1-n2m2) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (có công thức 1-n2m2) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong quy trình điều chế của hợp chất (có công thức 1-n2m2) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N, n là 2 và m là 2, các hợp chất (1A) và/hoặc (1B) và/hoặc (1C) cũng có thể được điều chế.

(Quy trình điều chế 4-1)

Hợp chất (có công thức 1A) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n2m2) trong đó A^1 là N, A^2 là N, n là 2 và m là 2.



trong đó các ký hiệu là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocarbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 2 đến 5mol tương ứng

với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2).

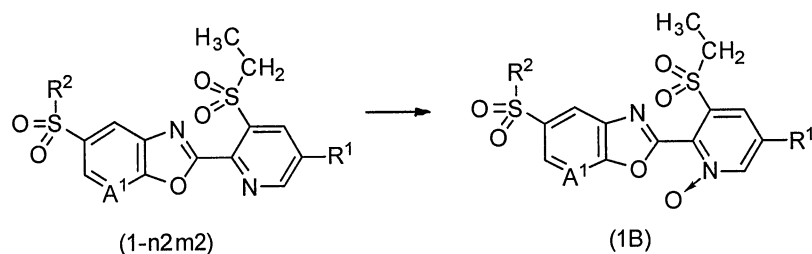
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 20°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 48 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1A) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (1A) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong quy trình điều chế của hợp chất (1A), các hợp chất (1B) và/hoặc (1C) cũng có thể được điều chế.

(Quy trình điều chế 4-2)

Hợp chất (1B) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n2m2) trong đó A¹ là N hoặc CH, A² là N, n là 2 và m là 2.



trong đó A¹ là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm

trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 2 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-n2m2).

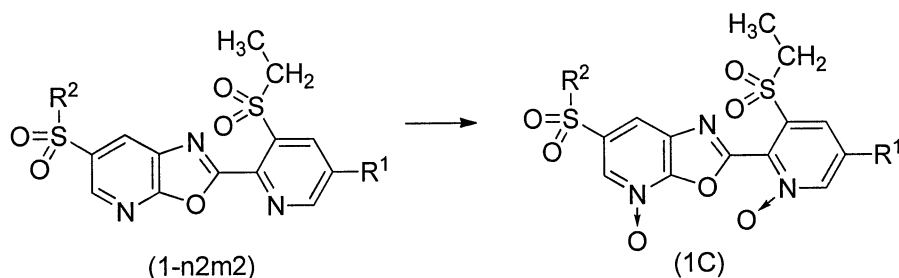
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 20°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 48 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1B) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (1B) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong quy trình điều chế của hợp chất (1B), các hợp chất (1A) và/hoặc (1C) cũng có thể được điều chế.

(Quy trình điều chế 4-3)

Hợp chất (1C) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất (có công thức 1-n2m2) trong đó A¹ là N, A² là N, n là 2 và m là 2.



trong đó các ký hiệu là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; axit axetic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit m-cloperbenzoic, dung dịch hydro peroxit và Oxone®.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit vonfamic, natri vonfamat và kali vonfamat.

Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 2 đến 20mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1-

$n2m2$). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1- $n2m2$). Lượng chất oxy hóa tốt hơn nằm trong khoảng từ 3 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1- $n2m2$). Lượng chất xúc tác tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,2mol tương ứng với 1mol hợp chất (có công thức 1- $n2m2$).

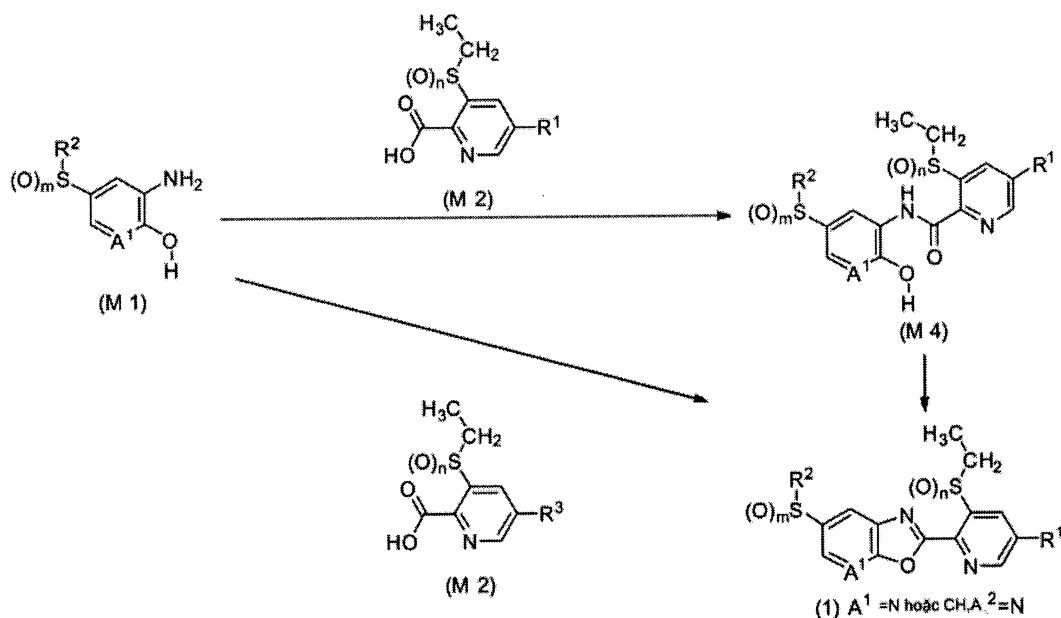
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 50°C đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 48 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1C) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ, rửa lớp hữu cơ tùy ý bằng dung dịch trong nước của tác nhân khử (ví dụ natri sulfit và natri thiosulfat), sau đó là dung dịch trong nước của bazơ (ví dụ natri hydro cacbonat) và sau đó làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất tách ra (1C) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong quy trình điều chế của hợp chất (có công thức 1C), các hợp chất (có công thức 1A) và/hoặc (1B) cũng có thể được điều chế.

(Quy trình điều chế 5-1)

Hợp chất này trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M2) phản ứng để thu được hợp chất trung gian (có công thức M4) và sau đó cho hợp chất trung gian (có công thức M4) thu được ngưng tụ nội phân tử.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M4) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M2) phản ứng có mặt tác nhân ngưng tụ.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi. Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như 1,4-dioxan, dietyl ete, tetrahydrofuran (sau đây được gọi là “THF”) và tert-butylmetyl ete; hydrocacbon halogen hóa như diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan và clobenzen; các hydrocacbon thơm như toluen, benzen và xylene; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như N,N-dimetylformamit (sau đây được gọi là “DMF”), N-metylpyrrolidon (sau đây được gọi là “NMP”), 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và dimetylsulfoxit (sau đây được gọi là “DMSO”); các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và quinolin; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các carbodiimit như 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)carbodiimit hydroclorua (sau đây được gọi là “EDCI hydroclorua”) và 1,3-dixyclohexyl carbodiimit.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có 1-hydroxybenzotriazol (sau đây được gọi là “HOBt”).

Lượng hợp chất trung gian (có công thức M2) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,5 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng tác nhân ngưng tụ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M4) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và cô lớp hữu cơ; rót nước vào hỗn hợp phản ứng và thu gom chất rắn bằng cách lọc; hoặc thu gom chất rắn được tạo ra trong hỗn hợp phản ứng bằng cách lọc. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M4) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M4) ngưng tụ nội phân tử.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi. Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như 1,4-dioxan, diethyl ete, THF và tert-butylmetyl ete; hydrocacbon halogen hóa như diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan và clobenzen; các hydrocacbon thơm như toluen, benzen và xilen; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và DMSO; các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và quinolin; và các hỗn hợp gồm chúng.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt tác nhân ngưng tụ, axit, bazơ hoặc tác nhân clo hóa.

Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có anhydrit của axit axetic, anhydrit của trifloaxit axetic, EDCI hydroclorua, hỗn hợp gồm triphenyl phosphin, bazơ và cacbon tetraclorea hoặc cacbon tetrabromua, hỗn hợp gồm triphenyl phosphin và các azodiester như diethyl azodicarboxylat.

Các ví dụ về axit cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các axit sulfonic như axit para-toluensulfonic và axit metansulfonic; các axit carboxylic như axit axetic; axit sulfuric; axit phosphoric; axit polyphosphoric; và tương tự.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hợp chất dị vòng chứa nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undecen (sau đây được gọi là "DBU") và 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-5-nonen; các amin bậc ba như triethylamin và N,N-diisopropyletylamin; các bazơ vô cơ như trikali phosphat, kali cacbonat và natri hydrit.

Các ví dụ về tác nhân clo hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có phospho oxyclorea; và tương tự.

Khi tác nhân ngưng tụ được sử dụng trong phản ứng, lượng tác nhân ngưng tụ nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M4). Khi axit được sử dụng trong phản ứng, lượng axit nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M4). Khi bazơ được sử dụng trong phản ứng, lượng bazơ nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M4). Khi tác nhân clo hóa được sử dụng trong phản ứng, lượng tác nhân clo hóa nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M4).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 200°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1

đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và cô lớp hữu cơ; rót nước vào hỗn hợp phản ứng và thu gom chất rắn bằng cách lọc; hoặc thu gom chất rắn được tạo ra trong hỗn hợp phản ứng bằng cách lọc. Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tinh chế tiếp bằng cách tái kết tinh, sắc ký và tương tự.

Hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N cũng có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M2) có mặt tác nhân ngưng tụ.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi. Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như 1,4-dioxan, dietyl ete, THF và tert-butylmetyl ete; hydrocacbon halogen hóa như diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan và clobenzen; các hydrocacbon thơm như toluen, benzen và xylen; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và DMSO; các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và quinolin; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ khử hydro cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các carbodiimit như EDCI hydroclorua, 1,3-dixyclohexyl carbodiimit và axit boric.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt chất xúc tác.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có 1-hydroxybenzotriazol.

Lượng hợp chất trung gian (có công thức M2) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,5 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng tác nhân ngưng tụ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1).

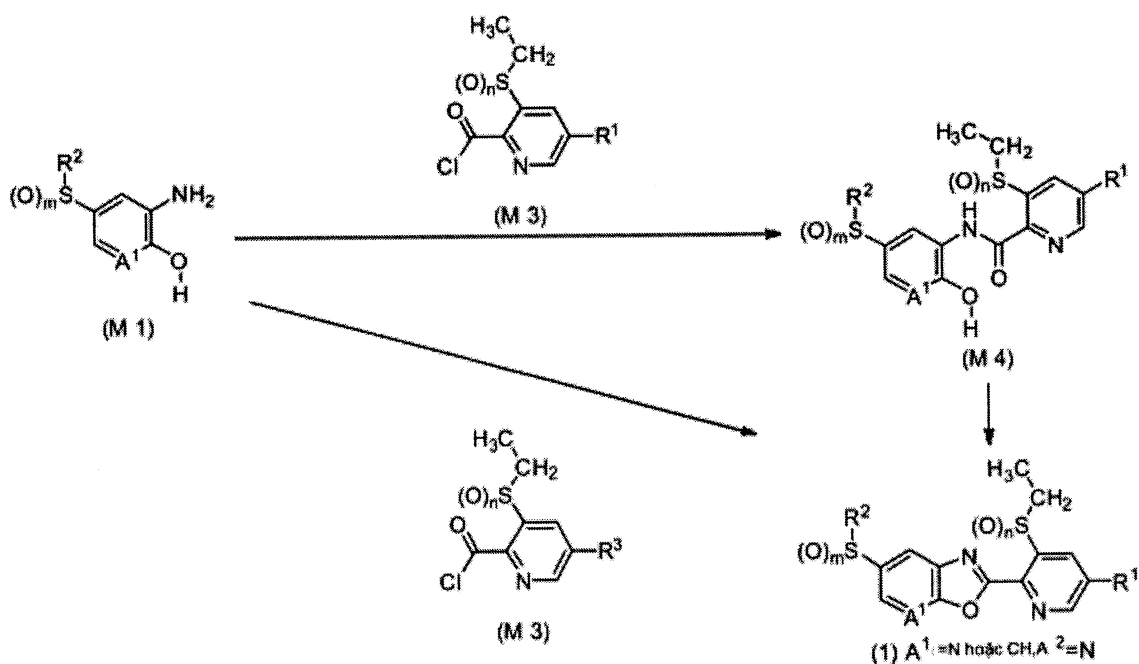
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 200°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và

A^2 là N có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và cô lập hữu cơ; rót nước vào hỗn hợp phản ứng và thu gom chất rắn bằng cách lọc; hoặc thu gom chất rắn được tạo ra trong hỗn hợp phản ứng bằng cách lọc. Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tinh chế tiếp bằng cách tái kết tinh, sắc ký và tương tự.

(Quy trình điều chế 5-2)

Hợp chất này trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M3) thu được hợp chất trung gian (có công thức M4), sau đó cho hợp chất trung gian thu được (M4) ngưng tụ nội phân tử.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M4) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M3) phản ứng.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon béo như hexan, heptan và octan; các hydrocacbon thơm như toluen và xylen; hydrocacbon halogen hóa như clobenzen; các este như etyl axetat và

butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt bazơ.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các cacbonat kim loại kiềm như natri cacbonat và kali cacbonat; các amin bậc ba như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và 4-dimetylaminopyridin.

Lượng hợp chất trung gian (có công thức M3) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -20°C đến 100°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M4) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M4) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M4) ngưng tụ nội phân tử theo quy trình điều chế 5-1.

Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N cũng có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M3) có mặt tác nhân ngưng tụ.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt hoặc không có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon béo như hexan, heptan và octan; các hydrocacbon thơm như toluen và xilen; hydrocacbon halogen hóa như clobenzen; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt bazơ.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các cacbonat kim loại kiềm như natri cacbonat và kali cacbonat; các amin bậc ba

như triethylamin và N,N-diisopropyletylamin; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và 4-dimetylaminopyridin.

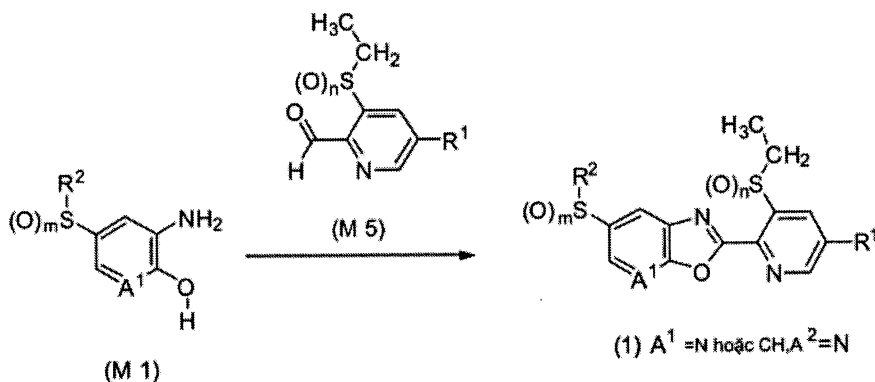
Lượng hợp chất trung gian (có công thức M3) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 20°C đến 200°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

(Quy trình điều chế 6)

Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N cũng có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M5) có mặt chất oxy hóa.



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi. Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các rượu như rượu metylic và rượu etylic; các ete như 1,4-dioxan, dietyl ete, THF và tert-butylmetyl ete; hydrocacbon halogen hóa như diclometan, cloroform, cacbon tetracolorua, 1,2-dicloetan và clobenzen; các hydrocacbon thơm như toluen, benzen và xylen; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và DMSO; các hợp

chất thơm chứa nitơ như pyridin và quinolin; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có oxygen, đồng (II) clorua, 2,3-diclo-5,6-dixyanobenzoquinon (sau đây được gọi là “DDQ”); và tương tự.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt axit.

Các ví dụ về axit cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các axit sulfonic như axit para-toluensulfonic; các axit carboxylic như axit axetic; axit polyphosphoric; và tương tự.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt sulfit.

Các ví dụ về sulfit cần được sử dụng trong phản ứng gồm có natri hydro sulfit và dinatri sulfit.

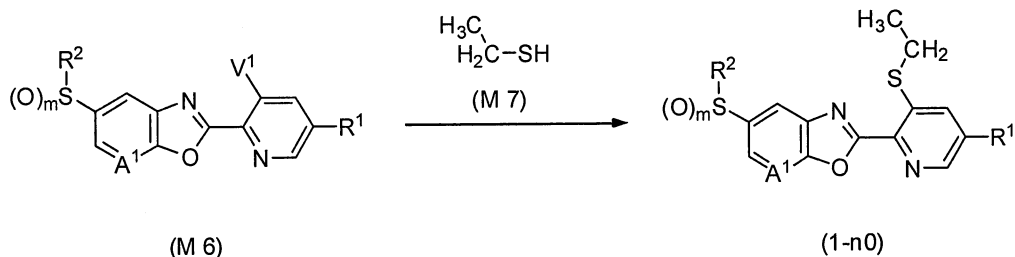
Lượng hợp chất trung gian (có công thức M5) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng axit cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1). Lượng sulfit cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M1).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 200°C.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và cô lớp hữu cơ; rót nước vào hỗn hợp phản ứng và thu gom chất rắn bằng cách lọc; hoặc thu gom chất rắn được tạo ra trong hỗn hợp phản ứng bằng cách lọc. Hợp chất tách ra (1) trong đó A^1 là N hoặc CH và A^2 là N có thể được tinh chế tiếp bằng cách tái kết tinh, sắc ký và tương tự.

(Quy trình điều chế 7)

Hợp chất (có công thức 1-n0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N và n là 0 cũng có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M6) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M7) có mặt bazơ.



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon thơm như toluen và xylene; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các cacbonat kim loại kiềm như natri cacbonat và kali cacbonat; và các hydrit kim loại kiềm như natri hydrit.

Lượng hợp chất trung gian (có công thức M7) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M6). Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M6).

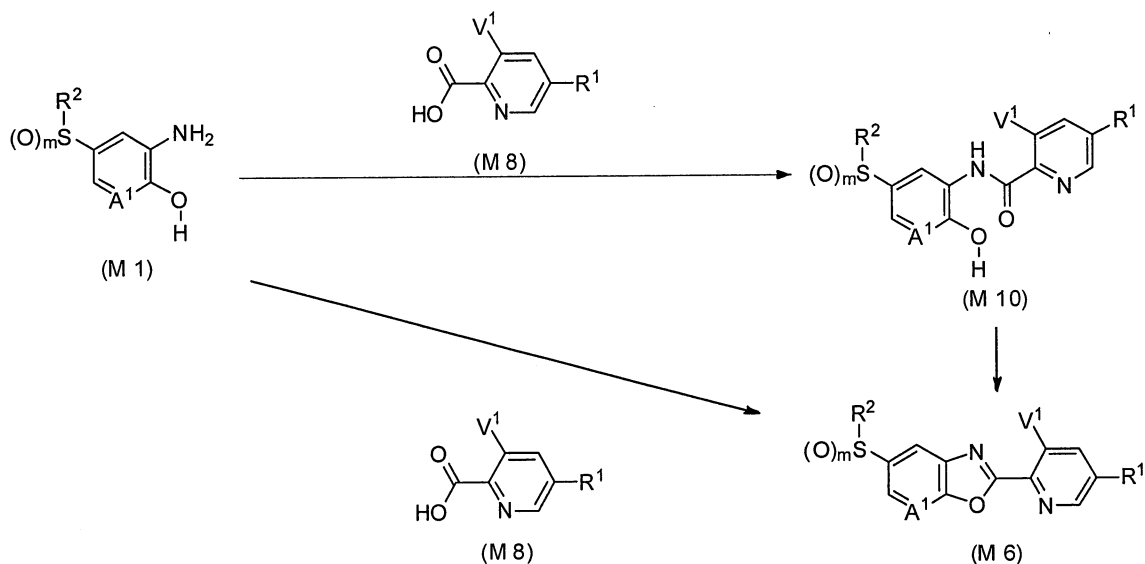
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -50°C đến 100°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 12 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức 1-n0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N và n là 0 có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất tách ra (1-n0) trong đó A^1 là N hoặc CH, A^2 là N và n là 0 có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo.

(Quy trình điều chế 8-1)

Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M1) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M8) thu được hợp chất trung gian (có công thức M10) và sau đó cho hợp chất trung gian (có công thức M10) thu được ngưng tụ nội phân tử.



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M10) có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 5-1 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M8) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M2).

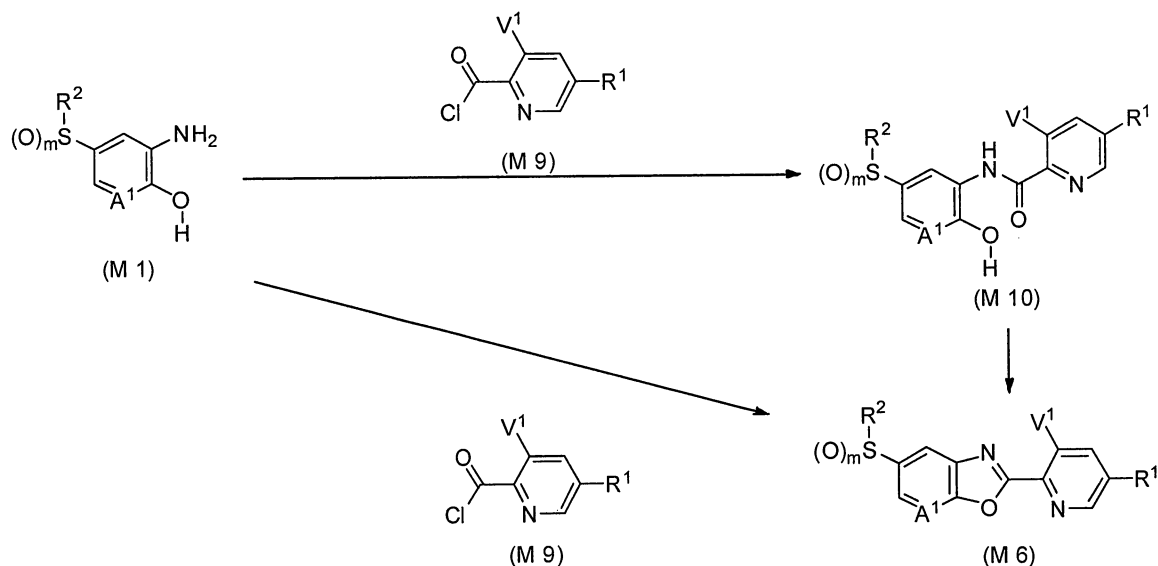
Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 5-1 hoặc 5-2 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M10) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M4).

Hợp chất trung gian (có công thức M6) cũng có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) theo quy trình điều chế 5-1 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M8) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M2).

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo.

(Quy trình điều chế 8-2)

Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M9) thu được hợp chất trung gian (có công thức M10) và sau đó cho hợp chất trung gian (có công thức M10) thu được ngưng tụ nội phân tử.



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M10) có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 5-2 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M9) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M3).

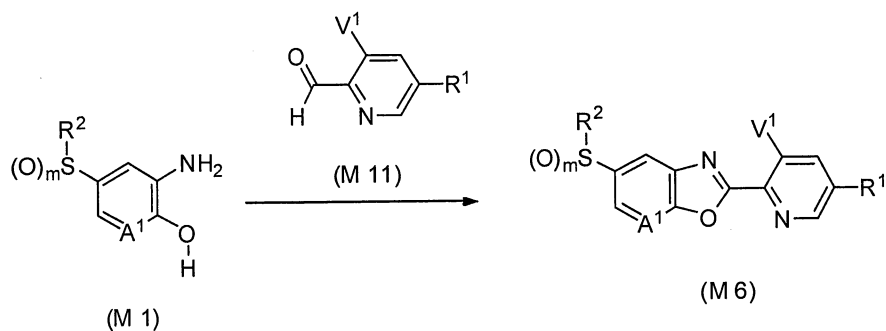
Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 5-1 hoặc 5-2 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M10) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M4).

Hợp chất trung gian (có công thức M6) cũng có thể được điều chế theo một công đoạn (một mẻ) theo quy trình điều chế 5-2 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M9) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M2).

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo.

(Quy trình điều chế 9)

Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất trung gian (có công thức M1) và hợp chất trung gian (có công thức M11).

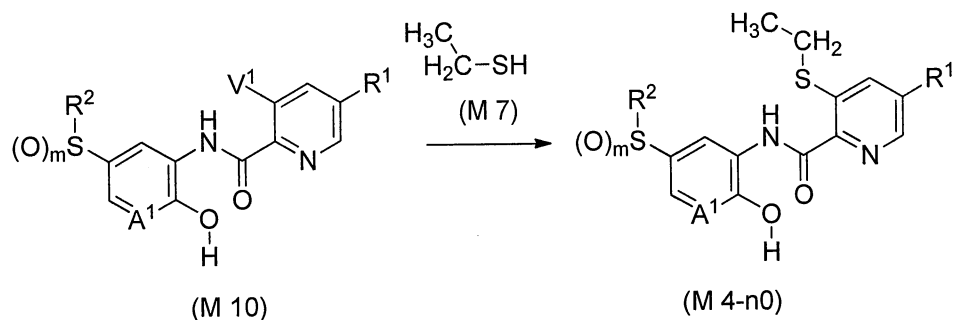


trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M6) có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 6 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M11) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M5).

(Quy trình điều chế 10)

Hợp chất trung gian (có công thức M4-n0) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất trung gian (có công thức M10) và hợp chất trung gian (có công thức M7).



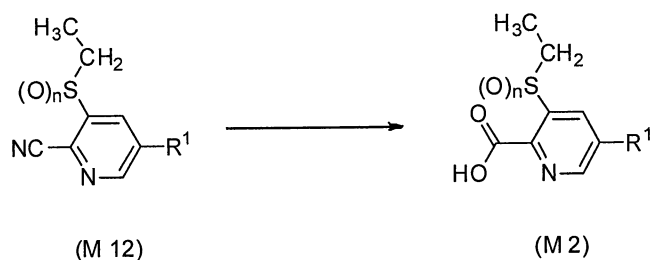
trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M4-n0) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 7 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M10) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M6).

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo.

(Quy trình điều chế 11)

Hợp chất trung gian (có công thức M2) có thể được điều chế bằng cách thủy phân hợp chất trung gian (có công thức M12).



trong đó các ký hiệu là như được định nghĩa trong công thức (1).

Khi sự thủy phân được tiến hành bằng cách sử dụng axit, dung dịch trong nước của axit nói chung được sử dụng làm dung môi trong phản ứng.

Các ví dụ về axit cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các axit

khoáng như axit clohydric, axit nitric, axit phosphoric và axit sulfuric; và các axit carboxylic như axit axetic và trifloaxit axetic.

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M2) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M2) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Khi sự thủy phân được tiến hành bằng cách sử dụng bazơ, phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydroxit kim loại kiềm như natri hydroxit và kali hydroxit.

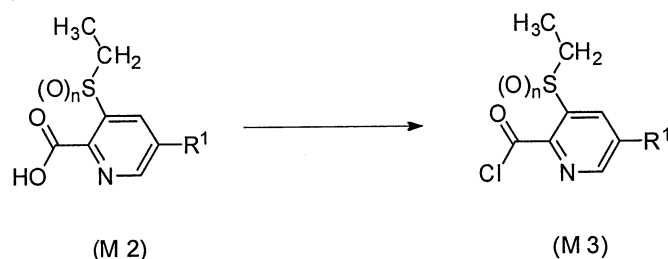
Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M12).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M2) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, axit hóa dung dịch phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M2) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

(Quy trình điều chế 12)

Hợp chất trung gian (có công thức M3) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M2) phản ứng với tác nhân clo hóa.



trong đó các ký hiệu là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon thơm như toluen và xylen; các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân clo hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có thionyl clorua, oxalyl diclorua, phospho oxycloclorua; và tương tự.

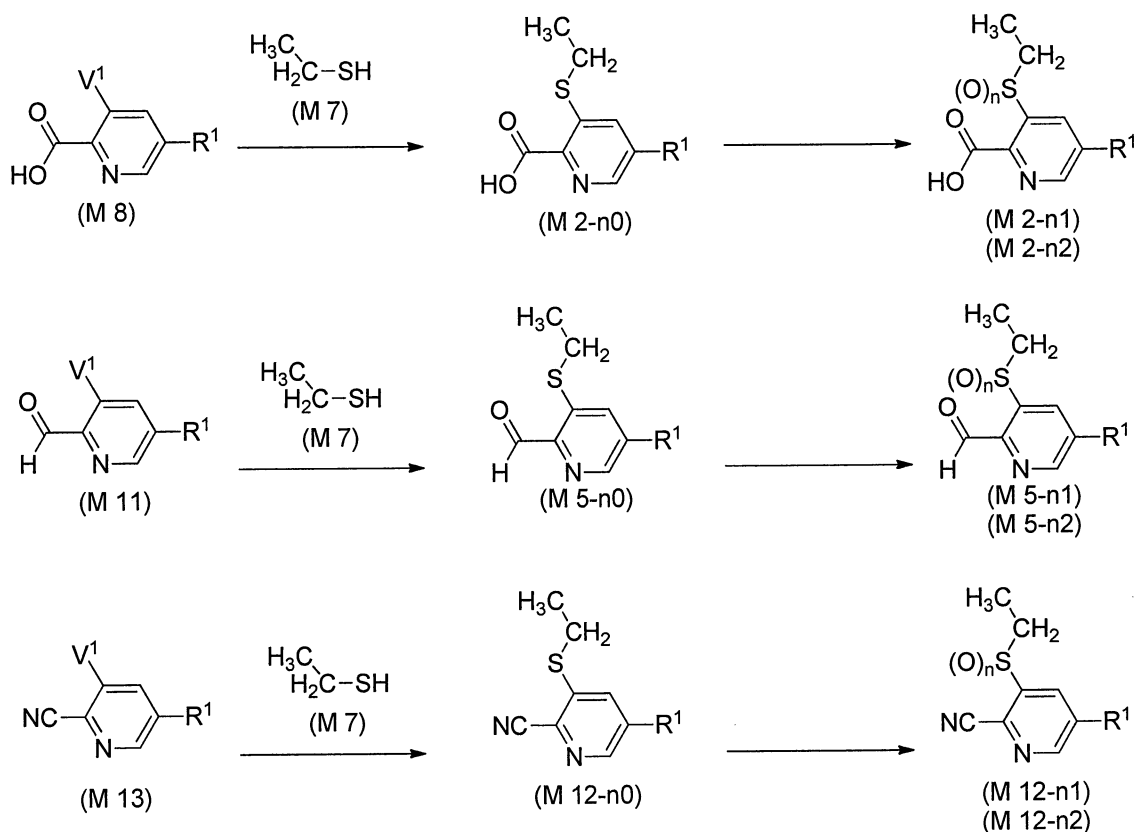
Lượng tác nhân clo hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M2).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M3) có thể được cô bằng cách loại bỏ dung môi khỏi hỗn hợp phản ứng.

(Quy trình điều chế 13)

Hợp chất trung gian (có công thức M2), hợp chất trung gian (có công thức M5) hoặc hợp chất trung gian (có công thức M12) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M7) phản ứng tương ứng với hợp chất trung gian (có công thức M8), hợp chất trung gian (có công thức M11) hoặc hợp chất trung gian (có công thức M13) và tùy ý oxy hóa hợp chất thu được.



trong đó V¹ là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M2) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 7 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M8) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M6).

Hợp chất trung gian (có công thức M5) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 7 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M11) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M6).

Hợp chất trung gian (có công thức M12) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 7 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M13) thay cho hợp chất trung gian (có công thức M6).

Hợp chất trung gian (có công thức M2-n1) trong đó n là 1 hoặc hợp chất trung gian (có công thức M2-n2) trong đó n là 2 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 1 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M2) trong đó n là 0 thay cho hợp chất (1) trong đó n là 0.

Hợp chất trung gian (có công thức M5-n1) trong đó n là 1 hoặc hợp chất trung gian (có công thức M5-n2) trong đó n là 2 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 1 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M5) trong đó n là 0 thay cho hợp chất (1) trong đó n là 0.

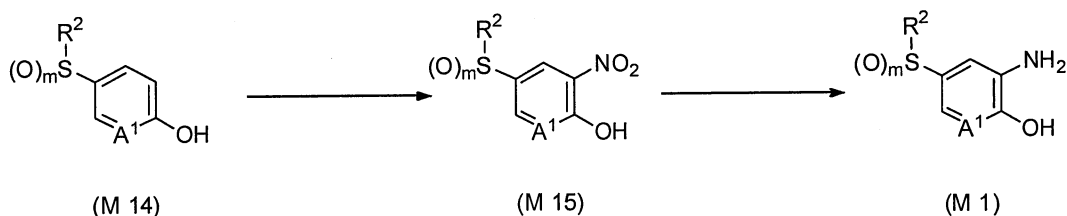
Hợp chất trung gian (có công thức M12-n1) trong đó n là 1 hoặc hợp

chất trung gian (có công thức M12-n2) trong đó n là 2 có thể được điều chế theo cùng cách như trong quy trình điều chế 1 bằng cách sử dụng hợp chất trung gian (có công thức M12) trong đó n là 0 thay cho hợp chất (1) trong đó n là 0.

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo.

(Quy trình điều chế 14)

Hợp chất trung gian (có công thức M1) có thể được điều chế bằng cách nitorat hóa hợp chất trung gian (có công thức M14) thu được hợp chất trung gian (có công thức M15) và khử hợp chất trung gian thu được (M15).



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M15) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M14) phản ứng với tác nhân nitorat hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; axit axetic, axit sulfuric đậm đặc, axit nitric đậm đặc, nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân nitorat hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit nitric đậm đặc; và tương tự.

Lượng tác nhân nitorat hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 3mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M14).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -10°C đến 100°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M15) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M15) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất trung gian (có công thức M1) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M15) phản ứng với hydro có mặt chất xúc

tác hydro hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi dưới khí quyển hydro từ 1 đến 100 atm.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các este như etyl axetat và butyl axetat; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất xúc tác hydro hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hợp chất của kim loại chuyển tiếp như paladi cacbon, paladi hydroxit, Raney niken và oxit bạch kim.

Lượng hydro cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 3mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M15). Lượng chất xúc tác hydro hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,001 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M15).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -20°C đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M1) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, lọc hỗn hợp phản ứng, tùy ý chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M1) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Hợp chất trung gian (có công thức M1) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M15) phản ứng với chất khử.

Phản ứng khử có thể được tiến hành có mặt, ví dụ, chất khử; các axit như axit clohydric và axit axetic; và nước.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các este như etyl axetat và butyl axetat; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất khử cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các bột kim loại như các bột sắt, các bột kẽm và các bột thiếc diclorua.

Lượng chất khử cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong

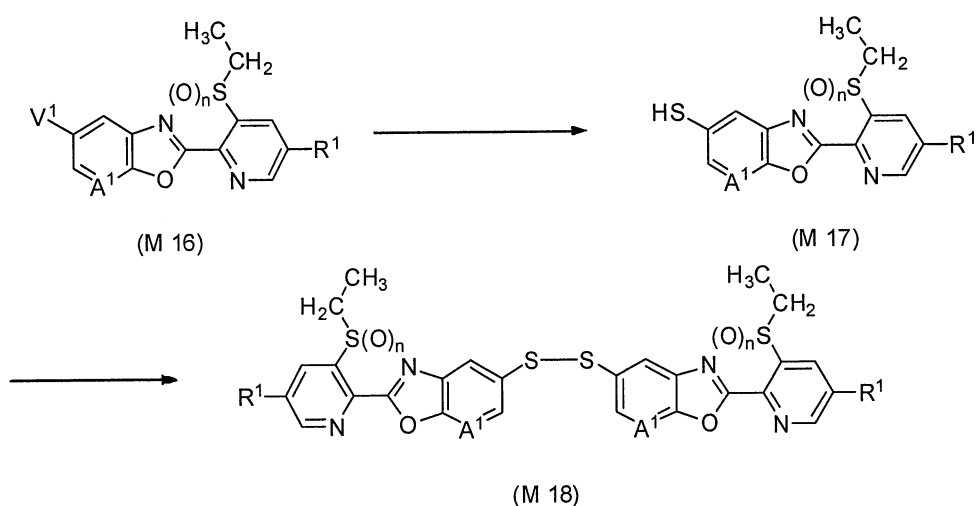
khoảng từ 3 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M15). Lượng axit cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M15). Lượng nước cần được sử dụng trong phản ứng nói chung là 3mol hoặc cao hơn tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M15).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M1) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, rót nước vào hỗn hợp phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M1) cũng có thể được tinh chế bằng cách sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

(Quy trình điều chế 15)

Hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M16) phản ứng tác nhân sulfit hóa. Hợp chất trung gian (có công thức M18), mà là disulfit của hợp chất trung gian (có công thức M17), có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hai phân tử của hợp chất trung gian (có công thức M17).



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M16) phản ứng có mặt tác nhân sulfit hóa và chất xúc tác.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các

hydrocacbon thơm như toluen và xylen; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân sulfit hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có natri sulfit, natri sulfit 9-hydrat và thioure.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có đồng (I) clorua, đồng (I) bromua và đồng (I) iodua.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt phối tử.

Các ví dụ về phối tử cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axetylaxeton, salen, phenanthrolin; và tương tự.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt bazơ.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các bazơ vô cơ như kali cacbonat, xesi cacbonat và trikali phosphat; và các bazơ hữu cơ trietylamin.

Lượng tác nhân sulfit hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng phối tử cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 50°C đến 200°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,5 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M17) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong phản ứng, V¹ tốt hơn là nguyên tử brom và nguyên tử iot.

Trong phản ứng, phản ứng từ hợp chất trung gian (có công thức M17) thành hợp chất trung gian (có công thức M18) dễ dàng tiến triển và hợp chất trung gian (có công thức M18) có thể được điều chế trong khi tổng hợp hợp chất (M17).

Hợp chất trung gian (có công thức M18) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hai phân tử của hợp chất trung gian (có công thức M17) có mặt

chất oxy hóa.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có nước; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon thơm như toluen và xylen; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; các axit carboxylic như axit axetic; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có oxy, iot, dung dịch hydro peroxit, kali ferixyanua và tương tự.

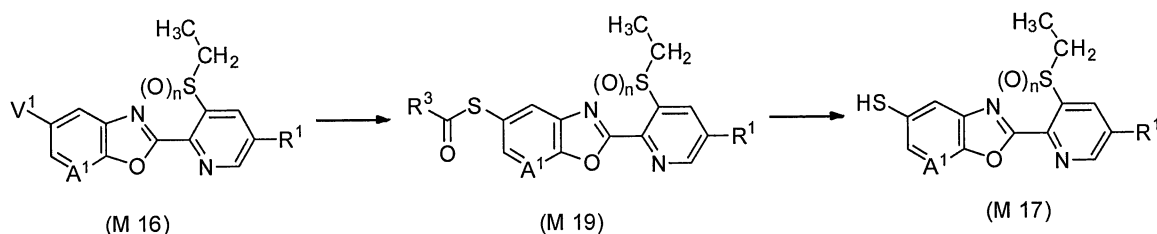
Lượng chất oxy hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,5 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M17).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0 đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M18) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M18) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

(Quy trình điều chế 16)

Hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được điều chế bằng cách thioeste hóa hợp chất trung gian (có công thức M16) thu được hợp chất trung gian (có công thức M19) và sau đó thủy phân hợp chất trung gian (có công thức M19) thu được.



trong đó A^1 là N hoặc CH, R^3 là phenyl có một hoặc nhiều nguyên tử halogen và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Hợp chất trung gian (có công thức M19) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất trung gian (có công thức M16) có mặt tác nhân thioeste hóa, bazơ và chất xúc tác.

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các

hydrocacbon thơm như toluen và xylen; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về tác nhân thioeste hóa cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axit thiobenzoic.

Các ví dụ về chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng gồm có đồng (I) clorua, đồng (I) bromua và đồng (I) iodua.

Phản ứng có thể được tiến hành có mặt phối tử.

Các ví dụ về phối tử cần được sử dụng trong phản ứng gồm có axetylaxeton, salen, phenanthrolin; và tương tự.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các bazơ vô cơ như kali cacbonat, xesi cacbonat và trikali phosphat; và các bazơ hữu cơ trietylamin.

Lượng tác nhân thioeste hóa cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng chất xúc tác cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng phối tử cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16). Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 2mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M16).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 50°C đến 200°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,5 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M19) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M19) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong phản ứng, V^1 tốt hơn là nguyên tử brom và nguyên tử iot.

Hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được điều chế bằng cách thủy phân hợp chất trung gian (có công thức M19).

Khi sự thủy phân được tiến hành bằng cách sử dụng axit, dung dịch trong nước của axit nói chung được sử dụng làm dung môi trong phản ứng.

Các ví dụ về axit cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các axit khoáng như axit clohydric, axit nitric, axit phosphoric và axit sulfuric; và các axit carboxylic như axit axetic và trifloaxit axetic.

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M17) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Khi sự thủy phân được tiến hành bằng cách sử dụng bazơ, phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các rượu như rượu metylic và rượu etylic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về bazơ cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các hydroxit kim loại kiềm như natri hydroxit và kali hydroxit.

Lượng bazơ cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M19).

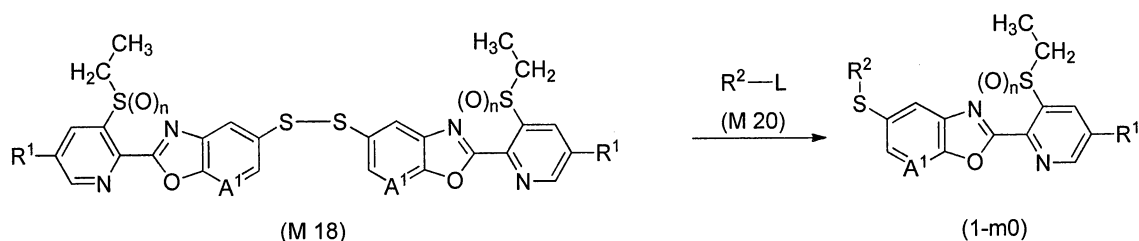
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0°C đến 120°C. Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất trung gian (có công thức M17) có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, axit hóa dung dịch phản ứng, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lớp hữu cơ. Hợp chất trung gian được cô (có công thức M17) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

Trong phản ứng, phản ứng từ hợp chất trung gian (có công thức M17) thành hợp chất trung gian (có công thức M18) dễ dàng tiến triển và hợp chất trung gian (có công thức M18) có thể được điều chế trong khi tổng hợp hợp chất (M17).

(Quy trình điều chế 17)

Hợp chất (có công thức 1-m0) trong đó m là 0 có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian (có công thức M18) phản ứng với hợp chất trung gian (có công thức M20) có mặt chất khử.



trong đó A^1 là N hoặc CH, L là nguyên tử brom hoặc nguyên tử iot và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Phản ứng nói chung được tiến hành có mặt dung môi.

Các ví dụ về dung môi cần được sử dụng trong phản ứng gồm có các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các hydrocacbon thơm như toluen và xylene; các nitril như axetonitril; các dung môi phân cực aprotic như DMF, NMP và DMSO; và các hỗn hợp gồm chúng.

Các ví dụ về chất khử cần được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrakis(dimethylamino)etylen, hydrazin, hydrazin monohydrat và tương tự.

Các ví dụ về hợp chất trung gian (có công thức M20) cần được sử dụng trong phản ứng gồm có triflometan iodua, pentafloritan iodua, heptaflor-2-iodopropan và tương tự.

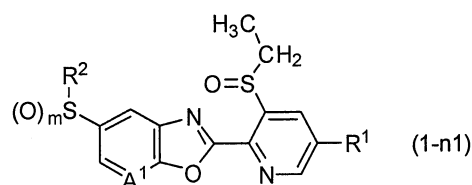
Lượng hợp chất trung gian (có công thức M20) cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 2 đến 10mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M18). Lượng chất khử cần được sử dụng trong phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol tương ứng với 1mol hợp chất trung gian (có công thức M18).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ -80°C đến 50°C . Thời gian phản ứng của phản ứng nói chung nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, hợp chất (có công thức 1-m0) trong đó m là 0 có thể được tách ra bằng cách xử lý sau, ví dụ, chiết tách hỗn hợp phản ứng bằng dung môi hữu cơ và làm khô và cô lập hữu cơ. Hợp chất tách ra (1-m0) có thể được tinh chế tiếp bằng sắc ký, tái kết tinh và tương tự.

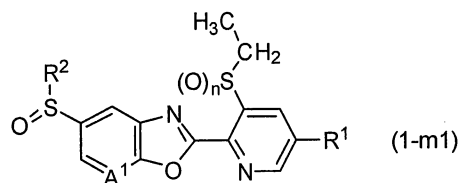
(Quy trình điều chế 18)

Hợp chất có công thức (1-n1):



trong đó m là 0 hoặc 2 và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công

thức (1) và hợp chất có công thức (1-m1):



trong đó n là 0 hoặc 2 và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1) gồm có các chất đồng phân lập thể và các hợp chất này có thể được phân giải quang học để thu được các isome quang của chúng.

Cụ thể, hợp chất có công thức (1-n1) hoặc (1-m1) có thể được chia thành (+)-isome quang và (-)-isome quang bằng sách ký lỏng hiệu năng cao (HPLC) để sử dụng cột phân giải quang học.

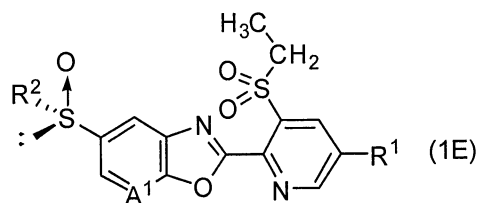
Các ví dụ về cột để phân giải quang học gồm có các hợp chất có bán trên thị trường, ví dụ, CHIRALPAK IC® và CHIRALPAK AD® do Daicel Corporation sản xuất.

Các ví dụ về pha động cần được sử dụng trong khi phân giải quang học gồm có các hydrocacbon béo như hexan, heptan và octan; các rượu như rượu metylic, rượu etylic và 2-propanol; các hydrocacbon halogen hóa béo như diclometan và cloroform; các ete như THF, etylen glycol dimetyl ete, tert-butylmetyl ete và 1,4-dioxan; các este như etyl axetat và butyl axetat; các nitril như axetonitril; các axit carboxylic như axit axetic và axit formic; nước; và các hỗn hợp gồm chúng.

Nhiệt độ của việc phân giải quang học nói chung nằm trong khoảng từ -20°C đến 60°C.

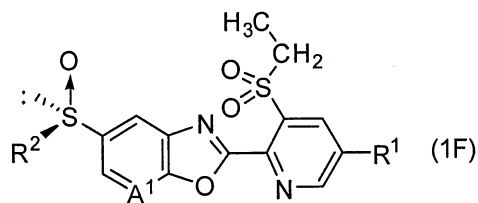
Các ví dụ về isome quang trong sáng chế gồm có hợp chất theo sáng chế (1E) và hợp chất theo sáng chế (1F) sau đây.

Hợp chất có công thức (1E):



trong đó A¹ là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

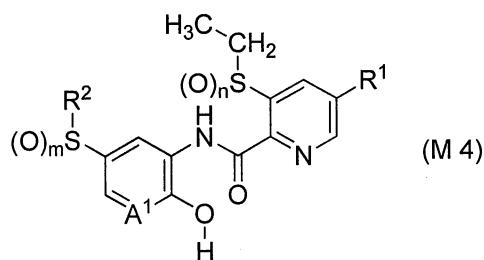
Hợp chất có công thức (1F):



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Các ví dụ về các hợp chất trung gian gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (M4):



trong đó A^1 là N hoặc CH và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Các ví dụ về hợp chất trung gian (có công thức M4) gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

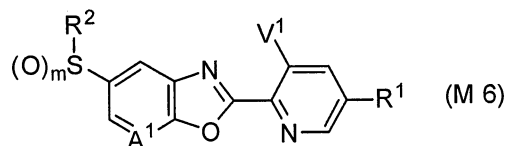
Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M4) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6):



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Các ví dụ về hợp chất trung gian (có công thức M6) gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (M6) trong đó V^1 là nguyên tử flo;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó V^1 là nguyên tử clo;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

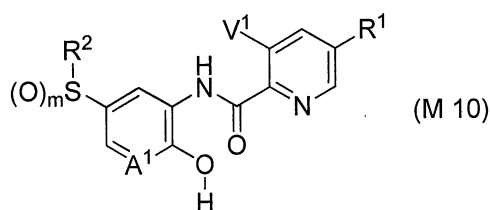
Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M6) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10):



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1).

Các ví dụ về hợp chất trung gian (có công thức M10) gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (M10) trong đó V^1 là nguyên tử flo;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó V^1 là nguyên tử clo;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là N, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là N, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

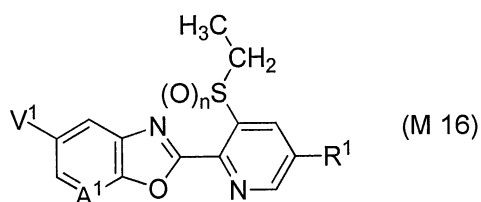
Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là CH, R^1 là nhóm triflometyl và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử clo và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử brom và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M10) trong đó A^1 là CH, R^1 là nguyên tử hydro và R^2 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M16):



trong đó A^1 là N hoặc CH, V^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử iot và các ký hiệu khác là như được định nghĩa trong công thức (1) (hợp chất trung gian (có công thức M16)).

Các ví dụ về hợp chất trung gian (có công thức M16) gồm có các hợp chất sau:

Hợp chất có công thức (M16) trong đó V^1 là nguyên tử brom;

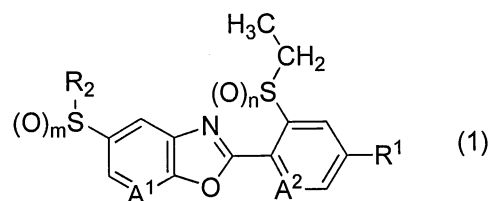
Hợp chất có công thức (M16) trong đó V^1 là nguyên tử iot;

Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là N và R^1 là nhóm triflometyl;

Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là N và R^1 nguyên tử clo;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là N và R^1 nguyên tử brom;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là N và R^1 nguyên tử hydro;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là CH và R^1 là nhóm triflometyl;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là CH và R^1 nguyên tử clo;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là CH và R^1 nguyên tử brom;
 Hợp chất có công thức (M16) trong đó A^1 là CH và R^1 nguyên tử hydro;

Tiếp theo, các ví dụ cụ thể về hợp chất này được mô tả dưới đây.

Hợp chất có công thức (1):



trong đó n là 0, m là 0, A^2 là N và R^1 , R^2 và A^1 là bất kỳ trong số các kết hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Bảng 1

R^1	R^2	A^1
H	CF ₃	N
H	CF ₃	CH
CF ₃	CF ₃	N
CF ₃	CF ₃	CH
F	CF ₃	N
F	CF ₃	CH
Cl	CF ₃	N
Cl	CF ₃	CH
Br	CF ₃	N
Br	CF ₃	CH
I	CF ₃	N
I	CF ₃	CH
H	CF ₂ CF ₃	N
H	CF ₂ CF ₃	CH
CF ₃	CF ₂ CF ₃	N
CF ₃	CF ₂ CF ₃	CH
F	CF ₂ CF ₃	N
F	CF ₂ CF ₃	CH
Cl	CF ₂ CF ₃	N
Cl	CF ₂ CF ₃	CH
Br	CF ₂ CF ₃	N
Br	CF ₂ CF ₃	CH
I	CF ₂ CF ₃	N
I	CF ₂ CF ₃	CH

Bảng 2

R^1	R^2	A^1
H	$CF(CF_3)_2$	N
H	$CF(CF_3)_2$	CH
CF_3	$CF(CF_3)_2$	N
CF_3	$CF(CF_3)_2$	CH
F	$CF(CF_3)_2$	N
F	$CF(CF_3)_2$	CH
Cl	$CF(CF_3)_2$	N
Cl	$CF(CF_3)_2$	CH
Br	$CF(CF_3)_2$	N
Br	$CF(CF_3)_2$	CH
I	$CF(CF_3)_2$	N
I	$CF(CF_3)_2$	CH
H	$CF_2CF_2CF_3$	N
H	$CF_2CF_2CF_3$	CH
CF_3	$CF_2CF_2CF_3$	N
CF_3	$CF_2CF_2CF_3$	CH
F	$CF_2CF_2CF_3$	N
F	$CF_2CF_2CF_3$	CH
Cl	$CF_2CF_2CF_3$	N
Cl	$CF_2CF_2CF_3$	CH
Br	$CF_2CF_2CF_3$	N
Br	$CF_2CF_2CF_3$	CH
I	$CF_2CF_2CF_3$	N
I	$CF_2CF_2CF_3$	CH

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 1, m là 0, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 2, m là 0, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 0, m is 1, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 1, m is 1, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

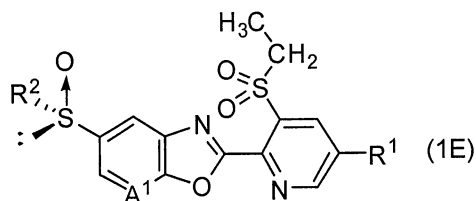
Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 2, m is 1, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 0, m là 2, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 1, m là 2, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

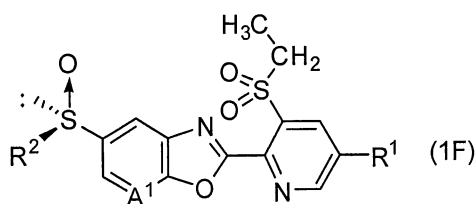
Hợp chất này có công thức (1) trong đó n là 2, m là 2, A^2 là N và R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1E):



trong đó R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Hợp chất này có công thức (1F):



trong đó R^1, R^2 và A^1 là một trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 1 đến 2.

Các ví dụ về các sinh vật gây hại mà hợp chất này thể hiện tác dụng diệt trừ trên đó gồm có các động vật chân đốt như các côn trùng gây hại và các ve

bét gây hại và các giun tròn. Cụ thể hơn là các sinh vật gây hại sau đây.

Bộ cánh nửa (Hemiptera): rầy nâu (Delphacidae) như *Laodelphax striatella*, *Nilaparvata lugens* và *Sogatella furcifera*; rầy xanh đuôi đen (Deltocephalidae) như *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix virescens* và *Empoasca onukii*; rầy mềm Aphididae như *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis spiraecola*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus* và *Hyalopterus pruni*; bộ xít (Pentatomidae) như *Nezara antennata*, *Eysarcoris parvus* và *Halyomorpha mista*; bộ xít dài Alydidae như *Riptortus clavetus*, *Leptocoris chinensis*; bộ xít xanh vai nhọn (Kirkaldy) như *Trigonotylus caelestialium*, *Stenotus rubrovittatus*; Aleyrodidae như *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*; bộ hung (Coccidea) như *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens*, *Icerya purchasi*, *Planococcus kraunhiae*, *Pseudococcus longispinis* và *Pseudaulacaspis pentagona*; rầy chổng cánh (Psyllidae) như *Diaphorina citri*, *Psylla pyrisuga* và *Bactericerca cockerelli*; bộ xít lưới (Tingidae) như *Stephanitis nasi*; họ rệp (Cimicidae) như *Cimex lectularius*.

Bộ cánh vẩy (Lepidoptera): bướm đêm (Pyralidae) như *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis* và *Pediasia teterrellus*; bướm đêm (Noctuidae) như *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Trichoplusia* spp., *Heliothis* spp. và *Helicoverpa* spp.; bướm phàn (Pieridae) như *Pieris rapae*; Tornhư *Adoxophyes* spp., *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus* và *Cydia pomonella*; bướm đêm (Gracillariidae) như *Caloptilia theivora* và *Phyllonorycter ringoneella*; bướm đêm (họ Carposinidae) như *Carposina niponensis*; bướm đêm (họ Lyonetiidae) như *Lyonetia* spp.; bướm đêm (họ Lymantriidae) như *Lymantria* spp. và *Euproctis* spp.; bướm đêm (họ Yponomeutidae) như *Plutella xylostella*; Gelechiidae như *Pectinophora gossypiella* và *Phthorimaea operculella*; Arctiidae như *Hyphantria cunea*; và Tineidae như *Tinea translucens* và *Tineola bisselliella*.

Bộ cánh viên (Thysanoptera): bộ trĩ (Thripidae) như *Frankliniella occidentalis*, *Thrips parvi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci* và *Frankliniella intonsa*.

Bộ hai cánh (Diptera): Culices như *Culex pipiens pallens*, *Culex tritaeniorhynchus* và *Culex quinquefasciatus*; muỗi truyền bệnh (*Aedes* spp.) như *Aedes aegypti* và *Aedes albopictus*; muỗi (*Anopheles* spp.) như *Anopheles sinensis*; Chironomidae; họ ruồi nhà (Muscidae) như *Musca domestica* và

Muscina stabulans; ruồi nhặng (*Calliphoridae*); ruồi xám (*Sarcophagidae*); *Fanniidae*; *Anthomyiidae* như *Delia platura* và *Delia antiqua*; ruồi đục lá (*Agromyzidae*) như *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii* và *Chromatomyia horticola*; *Clopidae* như *Clops oryzae*; ruồi hại (họ *Tephritidae*) như *Dacus cucurbitae* và *Ceratitis capitata*; ruồi giấm (*Drosophilidae*); ruồi *Phoridae* như *Megaselia spiracularis*; ruồi cống (*Psychodidae*) như *Clogmia albipunctata*; ruồi đen (*Simuliidae*); ruồi trâu (*Tabanidae*) như *Tabanus trigonus*; *Hippoboscidae*; và *Stomoxyni*.

Bộ cánh cứng (*Coleoptera*): *Diabrotica* spp. như *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Oulema oryzae*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata* và *Leptinotarsa decemlineata*; bộ hung (*Scarabaeidae*) như *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea* và *Popillia japonica*; *Sitophilini* như *Sitophilus zeamais*, *Echinocnemus squameus*, *Lissorhoptrus oryzophilus* và *Sphenophorus venatus*; bộ *Curculionoidea* như *Anthonomus grandis*; *Bruchinae* như *Callosobruchus chienensis*; *Heteromera* như *Tenebrio molitor* và *Tribolium castaneum*; *Dermestidae* như *Anthrenus verbasci*) và *Dermestes maculatus*; *Anobiidae* như *Lasioderma serricorne*; bộ rùa ăn lá (*Epilachna*) như *Epilachna vigintioctopunctata*; một đục quả (*Scolytidae*) như *Lyctus brunneus* và *Tomicus piniperda*; *Bostrychidae*; *Ptinidae*; *Cerambycidae* như *Anoplophora malasiaca*; *Agriotes* spp. như *Agriotes ogurae fuscicollis*; và *Staphylinidae* như *Paederus fuscipes*.

Bộ cánh thẳng (*Orthoptera*): châu chấu (*Locusta migratori*), dế trũi (*Gryllotalpa africana*), cào cào lúa (*Oxya yezoensis*), *Oxya japonica* và dế mèn (*Gryllidae*).

Bộ chét (*Siphonaptera*): bộ chét trên mèo (*Ctenocephalides felis*), bộ chét chó (*Ctenocephalides canis*), bộ chét trên người (*Pulex irritans*), bộ chét trên chuột nhắt đốm (*Xenopsylla cheopis*) và tương tự.

Chấy (*Anoplura*): chấy rận do *Pediculus humanus corporis*, chấy rận do *Pediculus humanus humanus*, rận mu *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Dalmalinia ovis*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus* và tương tự.

Bông lau dẹt đỏ (*Mallophaga*): *Dalmalinia ovis*, *Dalmalinia bovis*, *Menopon gallinae*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostrata* và tương tự.

Bộ cánh màng (*Hymenoptera*): *Formicidae* như *Monomorium pharaonis*, *Formica fusca japonica*, *Ochetellus glaber*, *Pristomyrmex pungens*, *Pheidole noda*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp. và *Linepithema humile*; *Vespidae*, *Bethylidae* và *Symphyla* như *Athalia rosae* và *Athalia japonica*.

Giun tròn (*Nematoda*): *Aphelenchoides besseyi*, *Nothotylenchus acris*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera*

glycines, *Globodera rostochiensis*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* và tương tự.

Gián (Blattodea): gián Đức (*Blattella germanica*), gián xám (*Periplaneta fuliginosa*), gián Mỹ (*Periplaneta Americana*), gián nâu (*Periplaneta brunnea*), gián phương Đông (*Blatta orientalis*) và tương tự.

Mối (Termitidae): *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*, *Incisitermes minor*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes satsumensis*, *Glyptotermes nakajimai*, *Glyptotermes fuscus*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes kushimensis*, *Hodotermopsis japonica*, *Coptotermes guangzhouensis*, *Reticulitermes miyatakei*, *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Reticulitermes* sp., *Nasutitermes takasagoensis*, *Pericapritermes nitobei*, *Sinocapritermes mushae* và tương tự.

Ve bét (Acari): nhện đỏ Tetranychidae như *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi* và *Oligonychus* spp.; Eriophyidae như *Aculops pelekassi*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculops lycopersici*, *Calacarus carinatus*, *Acaphylla theavagrans*, *Eriophyes chibaensis* và *Aculus schlehtendali*; nhện Tarsonemidae như *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae như *Brevipalpus phoenicis*; Tuckerellidae; ve Ixodidae như *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Dermacentor variabilis*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Amblyomma americanum*, *Boophilus microplus* và *Rhipicephalus sanguineus*; nhện Acaridae như *Tyrophagus putrescentiae* và *Tyrophagus similis*; mạt thuộc họ Pyroglyphidae như *Dermatophagoides farinae* và *Dermatophagoides pteronyssus*; Cheyletidae như *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis*, *Cheyletus moorei* và *Cheyletiella yasguri*; ghẻ Sarcoptidae như *Octodectes cynotis* và *Sarcoptes scabiei*; rệp Demodex như *Demodex canis*; Lirophoridae; Oribatida; Dermanyssidae như *Ornithonyssus bacoti*, *Ornithonyssus sylvarum* và *Dermanyssus gallinae*; và Trombiculidae như *Leptotrombidium akamushi*.

Nhện (Araneae): Opisthothelae như *Chiracanthium japonicum* và *Latrodectus hasseltii*; và tương tự.

Rết (Chilopoda): *Thereuonema hilgendorfi* và *Scolopendra subspinipes*.

Cuốn chiếu (Diplopoda): *Oxidus gracilis*, *Nedyopus tambanus* và tương tự.

Bộ chân đều (Isopoda): rận gỗ *Armadillidium vulgare* và tương tự.

Động vật thân mềm (Gastropoda): *Limax marginatus*, *Limax flavus* và tương tự.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế chứa hợp chất này và

chất mang trợ. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế nói chung chứa hợp chất này kết hợp với chất mang rắn, chất mang lỏng và/hoặc chất mang khí và nếu cần, chất hoạt động bề mặt hoặc các chất phụ gia phối trộn và có dạng chất cô có thể tạo nhũ, dung dịch dầu, bụi, hạt, bột có thể thấm ướt, chất cô dạng huyền phù, vi hạt, sol khí, tác nhân tạo khí, bả độc, phối chế nhựa, chế phẩm dạng nước gội đầu, bột nhào, bột, chế phẩm khí cacbon dioxit, viên nén hoặc tương tự. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế có thể được xử lý thành cuộn hương muỗi, thảm chống muỗi chạy điện, dịch lỏng chống muỗi dùng điện, tác nhân tạo khói, thuốc xông khói, tắm, thuốc trừ sâu đặt đúng chỗ, hoặc thuốc trừ sâu dùng qua đường miệng và sau đó được sử dụng.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế nói chung chứa hợp chất này với lượng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 95% trọng lượng.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 và chất mang trợ, trong đó chất mang trợ là nước và hợp chất được phân tán trong nước chứa chất hoạt động bề mặt, nói chung có thể được sản xuất bằng cách trộn hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98, chất hoạt động bề mặt và nước, tùy ý bổ sung các chất phụ gia phối trộn vào hỗn hợp, để tạo ra chế phẩm như chất cô dạng huyền phù hoặc các vi nang.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế này nói chung chứa các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 này với lượng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 5% trọng lượng.

Tình huống là “hợp chất được phân tán trong nước” được sử dụng ở đây gồm có các hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 trong nước hoặc tạo huyền phù trong nước.

Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt gồm có các chất hoạt động bề mặt không ion và/hoặc các chất hoạt động bề mặt anion. Các ví dụ về các chất hoạt động bề mặt không ion gồm có polyoxyalkylen alkyl ete, polyoxyalkylen alkyl aryl ete, các este của axit béo polyetylen glycol và tương tự. Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt anion gồm có các alkylsulfonat, các alkylbenzen sulfonat, các alkyl sulfat, các polyoxyalkylen aryl phenyl ete sulfat, polyoxyalkylen aryl phenyl ete phosphat và tương tự.

Các ví dụ về các chất phụ gia phối trộn gồm có tác nhân trộn, chất phân tán, chất tạo màu, chất làm đặc, chất bảo quản, chất khử bọt, chất chống đông và chất làm ổn định và tương tự và các ví dụ cụ thể gồm có casein, gelatin, tinh bột, gôm arabic, chất dẫn xuất xenluloza, axit alginic, chất dẫn xuất lignin, polymer tan được trong nước tổng hợp (polyvinyl rượu, polyvinylpyrrolidon, các axit polyacrylic, v.v.), PAP (acidic isopropyl phosphate), BHT (2,6-di-tert-butyl-4-

metylphenol) và BHA (hỗn hợp gồm 2-tert-butyl-4-metoxypheol và 3-tert-butyl-4-metoxypheol).

Phương pháp để diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế trong nông nghiệp gồm có phương pháp bao gồm bước phun một lượng hữu hiệu của hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 lên cuống và lá của cây hoặc đất nơi cây phát triển, cụ thể, ví dụ, phun lên cuống và lá của cây như phun lên phiến lá và phun lên diện tích mà cây phát triển như phun lên đất và xử lý đất phun ngập. Việc phun nói chung được thực hiện một hoặc nhiều lần.

Các ví dụ cụ thể về việc phun lên cuống và lá của cây gồm có phun lên bề mặt của cây như phun lên phiến lá và rắc lên thân.

Các ví dụ cụ thể về phun lên đất gồm có phun lên đất, trộn vào đất, rắc tác nhân lên đất (tưới tác nhân lỏng, phun lên đất, làm ngập tác nhân lỏng). Các ví dụ về chỗ cần được phun gồm lỗ trồng cây, luống, ngoại vi của lỗ trồng cây, ngoại vi của luống trồng cây, toàn bộ bề mặt của diện tích cây phát triển, các phần giữa đất và cây, diện tích giữa các gốc, diện tích dưới thân, luống chính, đất phát triển của cây, hộp nuôi dưỡng cây con, khay nuôi dưỡng cây con và nền hạt. Các ví dụ về sự định thời phun gồm có trước khi gieo, tại thời điểm gieo, ngay sau khi gieo, trong giai đoạn cây con phát triển, trước khi trồng, tại thời điểm trồng và thời gian phát triển sau khi trồng.

Các ví dụ về phun ngập gồm có phun lên các phương tiện tưới (ống tưới, ống mềm để tưới, bình tưới nước, v.v.), trộn vào dịch lỏng ngập giữa các luống và trộn vào môi trường nuôi cấy bằng nước.

Trong phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế, hợp chất này điển hình được áp dụng làm tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế.

Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được sử dụng để diệt trừ sinh vật gây hại trong đất nông nghiệp, lượng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10.000g tính theo hợp chất này trên 10.000 m². Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được phối chế vào chất cô có thể tạo nhũ, bột có thể thấm ướt, chế phẩm có thể chảy và v.v., tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại thường được phun sau khi pha loãng bằng nước sao cho nồng độ của thành phần hoạt tính trở thành từ 0,01 đến 10.000 ppm và hạt hoặc bụi thường được sử dụng một mình.

Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được sử dụng để diệt trừ sinh vật gây hại trên đồng lúa nước, lượng này thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10g tính theo hợp chất này trên hộp cây con phát triển. Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được phối chế thành chất cô có thể tạo nhũ, bột có thể thấm ướt, chế phẩm có thể chảy được và v.v., tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại thường được phun sau khi pha loãng bằng nước sao cho nồng độ của

thành phần hoạt tính nằm trong khoảng từ 0,01 đến 10.000 ppm và hạt hoặc bụi thường được áp dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1 đến 500g theo bản thân nó.

Các chế phẩm này hoặc các chất pha loãng nước của các chế phẩm có thể được phun trực tiếp lên sinh vật gây hại hoặc cây hoặc cây mùa màng cần được bảo vệ khỏi côn trùng, hoặc có thể được sử dụng trong xử lý đất để diệt trừ sinh vật gây hại trú ngụ ở đất của đất canh tác.

Việc phun này cũng được tiến hành bằng phương pháp quần trực tiếp chế phẩm nhựa được tạo thành chế phẩm dạng tấm, dạng dây quần quanh cây, đặt chế phẩm ở vùng lân cận của cây, hoặc rải chế phẩm lên bề mặt đất ở gốc cây.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 và chất mang ăn (sau đây được gọi là “bả độc theo sáng chế”) nói chung có thể được sản xuất bằng cách trộn hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 với chất mang ăn (ví dụ, nước hoặc chất dinh dưỡng như các carbohydrat, các protein, các lipid, v.v.).

Các ví dụ về chất mang ăn gồm có các đường như sucroza, glucoza, đường hạt, fructoza, lactoza, maltoza, đường muscovado, đường nâu, đường nâu mềm, dextrin, arabinoza, galactoza, sorbitoza, rỉ mật, mật ong, v.v.; các sản phẩm sữa như váng sữa, sữa khô không béo, pho mát, tinh bột ngô, khoai tây, khoai lang, v.v.; các bột ngũ cốc như bột mỳ, bột gạo, bột ngô, bột khoai tây v.v.; các bột cho động vật hoặc các bột cho côn trùng như bò, lợn, cá và tôm, côn trùng, v.v.; các dầu thực vật như dầu cọ, dầu cacao, dầu ngô, dầu vừng, dầu lạc và dầu salad; các dầu động vật như mỡ cơ thể (dầu động vật có vú), mỡ bơ, các dầu từ chim, bò sát, động vật lưỡng cư, côn trùng, v.v.; các chất gia vị như nước sốt, nước tương, v.v. Bả độc theo sáng chế có thể còn chứa các chất chống oxy hóa như dibutylhydroxytoluen, axit nordihydroguaiaretic, v.v.; các chất bảo quản như dehydroaxit axetic; các chất ngăn ngừa tình cờ nuốt phải bởi trẻ em hoặc vật nuôi như ớt bột; các tác nhân thu hút côn trùng gây hại như hương vị pho mát, hương vị hành, dầu đậu phộng, v.v.; và tương tự.

Dạng của thành phần bả độc theo sáng chế không được giới hạn cụ thể, nhưng gồm có, ví dụ, hạt, keo tụ, viên nén, dịch lỏng, bột nhão, gel, v.v..

Phương pháp để diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế trong việc phòng ngừa dịch bao gồm (1) rải thành phần bả độc theo sáng chế có dạng chất rắn như bột, hạt, keo tụ và viên nén lên chỗ mà sinh vật gây hại rất có thể tụ tập, hoặc cho hỗn hợp vào một hộp mở và sau đó đặt hộp vào chỗ mà sinh vật gây hại rất có thể tụ tập, (2) phun hỗn hợp bả độc theo sáng chế có dạng dịch lỏng lên chỗ mà sinh vật gây hại rất có thể tụ tập, hoặc (3) phết hoặc gắn hỗn hợp bả độc theo sáng chế có dạng gel hoặc bột nhão lên khe mà sinh vật gây hại rất có thể tụ tập

bằng cách sử dụng súng bắn, v.v. để sinh vật gây hại ăn hỗn hợp.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98, dung môi và khí đẩy (sau đây được gọi là “sol khí theo sáng chế”) nói chung có thể được sản xuất bằng cách đưa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 và dung môi vào hộp sol khí, lắp van sol khí vào đó, nạp khí đẩy vào và sau đó lắp bộ kích hoạt vào đó.

Các ví dụ về dung môi gồm có nước, các rượu (rượu metylic, rượu etylic, rượu isopropylic, rượu butylic, hexanol, rượu benzylic, etylen glycol, propylen glycol, phenoxyetanol, v.v.), các keton (axeton, metyl etyl keton, xyclohexanon, v.v.), các hydrocacbon thơm (toluen, xylen, etylbenzen, dodecylbenzen, phenylxylyletan, metylnaphtalen, v.v.), các hydrocacbon béo (hexan, xyclohexan, dầu lửa, dầu khí, v.v.), các este (etyl axetat, butyl axetat, isopropyl myristat, etyl oleat, diisopropyl adipat, diisobutyl adipat, propylen glycol monometyl ete axetat, v.v.), các nitril (axetonitril, isobutyronitril, v.v.), các ete (diisopropyl ete, 1,4-dioxan, etylen glycol dimetyl ete, dietylen glycol dimetyl ete, dietylen glycol monometyl ete, propylen glycol monometyl ete, dipropylen glycol monometyl ete, 3-metoxi-3-metyl-1-butanol, v.v.), các amit của axit (N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit, v.v.), hydrocacbon halogen hóa (diclometan, tricloetan, cacbon tetraclorea, v.v.), các sulfoxit (dimetyl sulfoxit, v.v.), propylen cacbonat và các dầu thực vật (dầu đậu nành, dầu hạt bông, v.v.).

Các ví dụ về khí đẩy gồm có các flocarbon, khí butan, khí dầu mỏ hóa lỏng LPG (liquefied petroleum gas), dimetyl ete và cacbon dioxit.

Van sol khí không được giới hạn cụ thể, nhưng gồm có, ví dụ, các van sol khí loại đẩy xuống.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 và tác nhân tạo khí (sau đây được gọi là “tác nhân tạo khí theo sáng chế”) nói chung có thể được sản xuất bằng cách trộn hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 và tác nhân tạo khí.

Các ví dụ về tác nhân tạo khí gồm có azodicarbonamit, 4,4'-oxybis(benzensulfonylhydrazit), dinitrosopentametylentetramin, 2,2'-azobis-isobutyronitril, p-toluensulfonylhydrazit và tương tự.

Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được sử dụng để phòng trừ dịch, lượng phun nói chung nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1.000mg khi hợp chất này trên 1m² trong trường hợp phun lên bề mặt cây và 0,01 đến 500mg khi hợp chất này trên 1m³ trong trường hợp phun vào khoảng trống. Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế là chế phẩm nhũ, bột có thể thấm ướt hoặc bột có thể chảy được, các loại này thường được phun sau khi pha loãng với nước để có nồng độ thành phần hoạt tính từ 0,1 đến 10.000 ppm. Khi tác

nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế là chế phẩm dung dịch dầu, sol khí, tác nhân tạo khói và bả độc, các chất này được sử dụng một mình. Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được phun lên sinh vật gây hại hoặc môi trường sống của sinh vật gây hại, lượng phun thường nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1.000mg khi hợp chất này trên 1m² trong trường hợp phun lên bề mặt cây và từ 0,01 đến 500mg khi hợp chất này trên 1m³ trong trường hợp phun vào khoảng trống.

Khi tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế được sử dụng để phòng trừ dịch, tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại có thể được phun lên bề mặt thân của động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại, hoặc cho động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại dùng qua đường miệng. Cụ thể, tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại có thể được sử dụng để kiểm soát ký sinh trong vật nuôi như trâu bò, ngựa, lợn, cừu, dê và gà hoặc động vật nhỏ như chó, mèo, chuột và chuột nhắt bằng phương pháp đã biết trong lĩnh vực thú y. Cụ thể, khi việc kiểm soát hệ thống trong động vật được dự định, tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại được cho động vật sử dụng dưới dạng viên nén, hỗn hợp với thức ăn hoặc thuốc đạn, hoặc bằng cách tiêm (bao gồm tiêm bắp, tiêm dưới da, tiêm trong màng bụng và tĩnh mạch). Mặt khác, khi việc kiểm soát không có hệ thống được dự định, tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại được phun lên động vật bằng cách phun dung dịch dầu hoặc dung dịch nước, xử lý đồ lên hoặc đặt đúng chỗ, hoặc tắm động vật bằng chế phẩm gội, hoặc cho động vật đeo vòng hoặc thẻ ở tai được tạo ra từ hợp phần đồ mồ hôi nhựa. Khi cho sử dụng lên bề mặt thân động vật, lượng hợp chất này thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 1.000mg trên 1kg thể trọng của động vật. Khi cho động vật dùng qua đường miệng, lượng hợp chất này thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 1.000mg trên 1kg thể trọng của động vật.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế có thể được sử dụng ở các cánh đồng trên đó “các cây” được nêu dưới đây được nuôi cấy.

Các cây trồng: ngô, gạo, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, lúa miến, bông, đậu tương, lạc, kiều mạch, củ cải đường, hạt cải dầu, hướng dương, cây mía, thuốc lá, v.v.;

Các rau quả: các rau quả họ cà (cà tím, cà chua, ớt xanh, ớt, khoai tây, v.v.), các rau quả họ bầu bí (dưa chuột, bí đỏ, bí xanh, dưa hấu, dưa, v.v.), Rau họ cải (củ cải Nhật Bản, củ cải, cải ngựa, su hào, cải thảo, cải bắp, cải nâu, bông cải xanh, súp lơ, v.v.), cây họ cúc (Compositae) (cây ngưu bàng, hoa cúc vòng, atisô, rau diếp, v.v.), các loại rau họ loa kèn (hành tây xứ Wales, hành tây, tỏi, măng tây), cây họ cà rốt (cà rốt, rau mùi tây, cần tây, củ cải, v.v.), cây rau muống (Chenopodiaceae) (rau bina, củ cải Thụy Sĩ, v.v.), cây hoa môi (Labiatae) (basil Nhật Bản, bạc hà, húng quế, v.v.), dâu tây, khoai lang, khoai lang, cây ráy, v.v.;

Cây ăn quả : Cây họ táo (táo, lê thường, lê Nhật Bản, mận qua Trung

Quốc, mộc qua, v.v.), trái cây nhiều thịt (đào, mận, quả xuân đào, mận Nhật Bản, anh đào, mơ, mận, v.v.), cây có múi (quýt Satsuma, cam, chanh, chanh tây, bưởi, v.v.), các loại hạt (hạt dẻ, quả óc chó, hạt dẻ hạt, hạnh nhân, hạt dẻ cười, hạt điều, hạt macadamia v.v.), quả mọng (quả việt quất, nam việt quất, mâm xôi, v.v.), nho, hồng, ô liu, cây tỳ bà (Loquat), chuối, cà phê, chà là, dứa, cọ dầu, v.v.;

Các cây khác cây ăn quả: chè, dâu tằm, cây ra hoa (hoa đỗ quyên, hoa trà, tú cầu, trà mai (*sasanqua*), hoa hồng Nhật Bản, anh đào, cây tulip, hoa tường vi (*crape myrtle*), hoa mộc (*cam osmanthus*), v.v.), cây xanh đường phố (cây tro, bạch dương, dương đào, bạch đàn, bạch quả, đinh hương, cây phong, sồi, bạch dương, cây chi tử kinh (*cercis*), cây gỗ gôm Trung Quốc, cây tiêu huyền, cây du, cây tùng bách Nhật Bản, cây linh sam, cây độc cần Nhật Bản, cây bách xù kim, cây thông, vân sam, thủy tùng, cây du, hạt dẻ ngựa, v.v.), cây san hô, cây thông la hán, tuyết tùng, cây bách Nhật Bản, cây chi ba đậu (*Croton*), cây thủy lạp (*euonymus japonicus*), cây sến (*Photinia glabra*), v.v.;

Cỏ: cỏ nhung *zoysia* (*zoysiagrass*, *zoysia matrella*, v.v.), cỏ Bermuda (*Cynodon dactylon*, v.v.), cỏ Bent Grass (*Agrostis alba*, *creeping bent grass*, *Hiland bent*, v.v.), cỏ blueglasses (đồng cỏ, cỏ chim, v.v.), cỏ đuôi trâu (cỏ đuôi trâu cao, cỏ đuôi trâu *chewings*, cỏ đuôi trâu đỏ *creeping red*, v.v.), bãi cỏ hoang *ryegrasses* (cỏ lòng, cỏ lúa mạch đen, v.v.), cỏ vườn cây ăn quả, cỏ timothy, v.v.;

Các loại khác: các cây hoa (hoa hồng, hoa cẩm chướng, hoa cúc, cỏ cây khô sâm, hoa baby, hoa đồng tiền, cúc vạn thọ, hoa xô đỏ, cây dã yên thảo, cỏ roi ngựa, tulip, cây cúc tây, cây long đóm, hoa huệ tây, hoa, giống anh thảo, hoa lan, hoa quân anh, hoa oải hương, cây hoàng anh, bắp cải trang trí, cây báo xuân, cây trạng nguyên, hoa lay ơn, cây báo xuân, cây cúc, cây lan kiếm *cymbidium*, thu hải đường, v.v.), cây nhiên liệu sinh học (cây dầu mè, dầu cây rum, cây *camelina*, cỏ *switchgrass*, cỏ chè vè (*Miscanthus*), cỏ sậy chim hoàng yến, cỏ sậy khổng lồ, cây đay (*kenaf*), sắn, cây liễu, v.v.), cây cảnh, v.v..

“Cây trồng” gồm có các cây trồng biến đổi gen.

Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo sáng chế có thể được sử dụng dưới dạng hỗn hợp như hỗn hợp với hoặc cùng với các thuốc trừ sâu khác, các thuốc diệt ve bét, các thuốc diệt giun tròn, các thuốc diệt nấm, các chất kích thích sinh trưởng cây trồng, các thuốc trừ sâu và các chất tổng hợp. Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ và các chất tổng hợp được thể hiện dưới đây

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các thuốc trừ sâu gồm có:

(1) Các hợp chất phospho hữu cơ:

Axephat, nhôm phosphit, butathiofos, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, xyanophos: CYAP, diazinon, DCIP(diclodiiisopropyl ete, dichlofenthion: ECP, dichlorvos: DDVP, dimetoat, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimfos, fenthion: MPP, fenitrothion: MEP, fosthiazat, formothion, Hydro phosphit, isofenphos, isoxathion, malathion, mesulfenfos, methidathion: DMTP, monocrotophos, naled: BRP, oxydeprofos: ESP, parathion, phosalon, phosmet: PMP, pirimiphos-metyl, pyridafenthion, quinalphos, phenthoat: PAP, profenofos, propaphos, prothiofos, pyraclorfos, salithion, sulprofos, tebupirimfos, temephos, tetrachlorvinphos, terbufos, thiometon, trichlorphon: DEP, vamidothion và phorat.

(2) Các hợp chất carbamat:

Alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, cloethocarb, ethiofencarb, fenobucarb, fenothiocarb, fenoxycarb, furathiocarb, isoprocab: MIPC, metolcarb, methomyl, methiocarb, NAC, oxamyl, pirimicarb, propoxur: PHC, XMC, thiodicarb, xylylcarb và aldicarb.

(3) Các hợp chất pyrethroit:

Acrinathrin, alethrin, benfluthrin, beta-cyfluthrin, bifenthrin, xycloprothrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cypermethrin, deltamethrin, esfenvalerat, ethofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flufenoprox, flumethrin, fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, permethrin, pralethrin, pyrethrins, resmethrin, sigma-cypermethrin, silafluofen, tefluthrin, tralomethrin, transfluthrin, tetramethrin, phenothrin, cyphenothrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, furamethrin, tau-fluvalinate, metofluthrin, profluthrin, dimefluthrin, 2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)benzyl (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetyl-3-prop-1-enyl-xyclopropanecarboxylat, 2,3,5,6-tetraflo-4-metylbenzyl (EZ)-(1RS,3RS;1RS, 3SR)-2,2-dimetyl-3-prop-1-enylxyclopropanecarboxylat và 2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)benzyl (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetyl-3-(2-metyl-1-propenyl)-xyclopropanecarboxylat, 2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)benzyl (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetyl-3-(2-xyano-1-propenyl)xyclopropanecarboxylat.

(4) Các hợp chất Nereistoxin:

Cartap, bensultap, thiocyclam, monosultap và bisultap.

(5) Các hợp chất neonicotinoit:

Imidacloprid, nitenpyram, acetamiprid, thiamethoxam, thiacloprid, dinotefuran và clothianidin.

(6) Các hợp chất benzoylure:

Chlorfluazuron, bistrifluron, diafenthiuron, diflubenzuron, fluazuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron và triazuron.

(7) Các hợp chất phenylpyrazol:

Axetoprol, ethiprol, fipronil, vaniliprol, pyriprol và pyrafluprol.

(8) Các độc tố Bt:

Các bào tử sống có nguồn gốc từ và các độc tố tinh thể sản xuất từ *Bacillus thuringiensis* và hỗn hợp gồm chúng;

(9) Các hợp chất hydrazin:

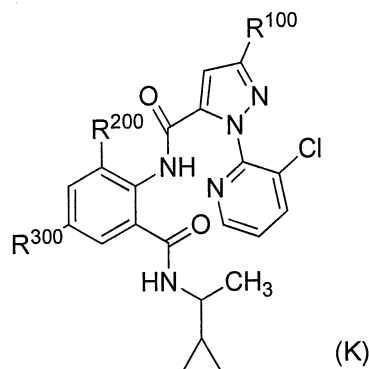
Chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit và tebufenozit.

(10) Các hợp chất clo hữu cơ:

Aldrin, dieldrin, dienochlor, endosulfan và metoxychlor.

(11) Các thuốc trừ sâu khác:

Dầu máy, nicotin-sulfat; avermectin-B, bromopropylat, buprofezin, chlorphenapyr, cyromazin, D-D(1,3-Diclopropen), emamectin-benzoat, fenazaquin, flupyrzofos, hydropren, methopren, indoxacarb, metoxadiazon, milbemycin-A, pymetrozin, pyridalyl, pyriproxyfen, spinosad, sulfluramid, tolfenpyrad, triazamat, lepimectin, axit Arsenic, benclonthiaz, Canxi xyanamit, Canxi polysulfit, chlordan, DDT, DSP, flufenerim, flonicamid, flurimfen, formetanat, metam-amoni, metam-natri, Metyl bromua, Kali oleat, protrifenbute, spiromesifen, sulfoxaflor, lưu huỳnh, metaflumizon, spirotetramat, pyrifluquinazon, spinetoram, tralopyril, flupyradifuron, chlorantraniliprol, cyantraniliprol, flubendiamit, hợp chất có công thức (K):



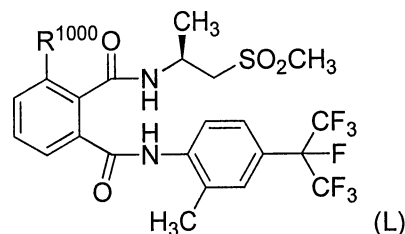
trong đó:

R^{100} là clo, brom hoặc nhóm triflometyl,

R^{200} là clo, brom hoặc nhóm metyl, và

R^{300} là clo, brom hoặc nhóm xyano và

hợp chất có công thức (L):



trong đó:

R^{1000} là clo, brom hoặc iot.

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các thuốc diệt ve bét gồm có: acequinocyl, amitraz, benzoximat, bifenaat, bromopropylat, chinomethionat, clobenzilat, CPCBS(chlorfenson), clofentezin, cyflumetofen, dicofol, etoxazol, fenbutatin oxit, fenothiocarb, fenpyroximat, fluacrypyrim, fluproxyfen, hexythiazox, propargit: BPPS, polynactins, pyridaben, Pyrimidifen, tebufenpyrad, tetradifon, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, amidoflumet và cyenopyrafen.

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các thuốc diệt giun tròn gồm có: DCIP, fosthiazat, levamisol, methyisothioxyanat, morantel tartarat và imicyafos.

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các thuốc diệt nấm gồm có:

(1) Các hợp chất azol:

Triforin, imazalil, pefurazoat, prochloraz, triflumizol, bitertanol, bromuconazol, cyproconazol, difenoconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, prothioconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimenol, triticonazol và tương tự;

(2) Các hợp chất strobilurin:

Azoxystrobin, kresoxim-metyl, metominostrobin, trifloxystrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, enestrobin, dimoxystrobin, orysastrobin, fluoxastrobin, famoxadon, fenamidon, pyribencarb và tương tự;

(3) Các thành phần hoạt tính khác của các thuốc diệt nấm:

Carbendezim, benomyl, thiabendazol, thiophanat-metyl, zoxamit, diethofencarb, pencycuron, fluopicolit, carboxin, frutolanil, frametpyr, thifluzamit, boscalid, penthiopyrad, fluopyram, bixafen, isopyrazam, penflufen, sedaxan, fluxapyroxad, fluazinam, ferimzon, silthiofam, procymidon, iprodion, vinclozolin, metalaxyl, benalaxyl, pyrimethanil, mepanipyrim, cyprodinil,

quinoxifen, proquinazid, fenpiclonil, fludioxonil, fenhexamid, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamin, thiuram, ziram, mancozeb, clothalonil, dichlofluanid, captan, folpet, iminoctadin, ethaboxam, metrafenon, dodin, fthalit, tricyclazol, pyroquilon, carpropamid, diclocymet, fenoxanil, dimethomorph, iprovalicarb, benthiavalicarb, mandipropamit, tolclofos-metyl, quintozen, cyazofamit, amisulbrom, ametoctradin, cyflufenamid, validamycin A, polyoxin B, blastocidin-S, kasugamycin, axit oxolinic và tương tự;

(4) Các hợp chất kích thích đề kháng:

Acibenzolar-S-metyl, probenazol, isotianil và tiadinil.

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các thuốc diệt cỏ gồm có:

(1) Các hợp chất diệt cỏ axit phenoxyfatty:

2,4-PA, MCP, MCPB, phenothiol, mecoprop, fluroxypyr, triclopyr, clomeprop và naproanilit.

(2) Các hợp chất diệt cỏ axit benzoic:

2,3,6-TBA, dicamba, clopyralit, picloram, aminopyralit, quinclorac và quinmerac.

(3) Các hợp chất diệt cỏ ure:

Diuron, linuron, chlortoluron, isoproturon, fluometuron, isouron, tebuthiuron, methabenzthiazuron, cumyluron, daimuron và metyl-daimuron.

(4) Các hợp chất diệt cỏ triazin:

Atrazin, ametryn, cyanazin, simazin, propazin, simetryn, dimethametryn, prometryn, metribuzin, triaziflam và indaziflam.

(5) Các hợp chất diệt cỏ bipyridini:

Paraquat và diquat.

(6) Các hợp chất diệt cỏ hydroxybenzonitril:

Bromoxynil và ioxynil.

(7) Các hợp chất diệt cỏ dinitroanilin:

Pendimethalin, prodiamin và trifluralin.

(8) Các hợp chất diệt cỏ phospho hữu cơ:

Amiprofos-metyl, butamifos, bensulit, piperophos, anilofos, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P và bialaphos.

(9) Các hợp chất diệt cỏ cacbamat:

Di-alat, tri-alat, EPTC, butylat, benthocarb, esprocarb, molinat,

dimepiperat, swep, chlorpropham, phenmedipham, phenisopham, pyributicarb và asulam.

(10) Các hợp chất diệt cỏ amit của axit:

Propanil, propyzamit, bromobutit và etobenzanid.

(11) Các hợp chất diệt cỏ cloaxetanilit:

Axetochlor, alachlor, butachlor, dimetenamit, propachlor, metazachlor, metolachlor, pretilachlor, thenylchlor và pethoxamit.

(12) Các hợp chất diệt cỏ diphenylete:

Acifluorfen-natri, bifenox, oxyfluorfen, lactofen, fomesafen, chlometoxynil và aclonifen.

(13) Các hợp chất diệt cỏ imit vòng:

Oxadiazon, cinidon-etyl, carfentrazon-etyl, surfentrazon, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, pyraflufen-etyl, oxadiargyl, pentoxazon, fluthiacet-metyl, butafenacil, benzfendizon, bencarbazon và saflufenaxil.

(14) Các hợp chất diệt cỏ pyrazol:

Benzofenap, pyrazolat, pyrazoxyfen, topramezon và pyrasulfotol.

(15) Các hợp chất diệt cỏ triketon:

Isoxaflutol, benzobixyclon, sulcotrion, mesotrion, tembotrion và tefuryltrion.

(16) Các hợp chất diệt cỏ axit aryloxyphenoxypropionic:

Clodinafop-propargyl, cyhalofop-butyl, diclofop-metyl, fenoxaprop-etyl, fluazifop-butyl, haloxyfop-metyl và quizalofop-etyl, metamifop.

(17) Các hợp chất diệt cỏ trioneoxim:

Aloxydim-natri, setoxydim, butroxydim, clethodim, cloproxydim, xycloxydim, tepraloxym, tralkoxydim và profoxydim.

(18) Các hợp chất diệt cỏ sulfonylure:

Chlorsulfuron, sulfometuron-metyl, metsulfuron-metyl, chlorimuron-etyl, tribenuron-metyl, triasulfuron, bensulfuron-metyl, thifensulfuron-metyl, pyrazosulfuron-etyl, primisulfuron-metyl, nicosulfuron, amidosulfuron, cinosulfuron, imazosulfuron, rimsulfuron, halosulfuron-metyl, prosulfuron, ethametsulfuron-metyl, triflusulfuron-metyl, flazasulfuron, xyclosulfamuron, flupyrasulfuron, sulfosulfuron, azimsulfuron, etoxysulfuron, oxasulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, foramsulfuron, mesosulfuron-metyl, trifloxysulfuron, tritosulfuron, orthosulfamuron, flucetosulfuron và propyrisulfuron.

(19) Các hợp chất diệt cỏ imidazolinon:

Imazamethabenz-metyl, imazamethapyr, imazamox, imazapyr, imazaquin và imazethapyr.

(20) Các hợp chất diệt cỏ sulfonamid:

Flumetsulam, metosulam, diclosulam, florasulam, cloransulam-metyl, penoxsulam và pyroxsulam.

(21) Các hợp chất diệt cỏ axit pyrimidinyloxybenzoic:

Pyrithiobac-natri, bispyribac-natri, pyriminobac-metyl, pyribenzoxim, pyriftalid và pyrimisulfan.

(22) Các hợp chất diệt cỏ khác

Bentazon, bromaxil, terbaxil, chlorthiamid, isoxaben, dinoseb, amitrol, cinmetylin, tridiphan, dalapon, diflufenzopyr-natri, dithiopyr, thiazopyr, flucarbazon-natri, propoxycarbazon-natri, mefenacet, flufenacet, fentrazamit, cafenstrol, indanofan, oxaziclomefon, benfuresat, ACN, pyridat, chloridazon, norflurazon, flurtamon, diflufenican, picolinafen, beflubutamid, clomazon, amicarbazon, pinoxaden, pyraclonil, pyroxasulfon, thiencarbazon-metyl, aminoxyclopyrachlor, ipfencarbazon và methiozolin.

Các ví dụ về các thành phần hoạt tính của các chất tổng hợp gồm có: piperonyl butoxit, sesamex, sulfoxit, N-(2-ethylhexyl)-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-dicarboximit (MGK 264), N-decylimidazol, WARF-antiresistant, TBPT, TPP, IBP, PSCP, metyl iodua (CH_3I), t-phenylbutenon, dietylmaleat, DMC, FDMC, ETP và ETN.

Ví dụ thực hiện sáng chế

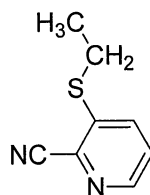
Sau đây, sáng chế sẽ được mô tả một cách chi tiết hơn dựa vào các ví dụ điều chế, các ví dụ phối chế và các ví dụ thử nghiệm, nhưng không được giới hạn ở đó.

Trước tiên, các ví dụ điều chế về hợp chất này được mô tả dưới đây.

Ví dụ điều chế 1(1)

Bổ sung natri hydrit (60%, dầu) (0,52g) vào hỗn hợp gồm 3-clo-2-xyanopyridin (1,39g), etyl mercaptan (0,9ml) và DMF (10ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian một giờ ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ thu được được rửa bằng dung dịch natri bicarbonat trong nước bão hòa, sau đó nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-xyano-3-etylsulfanylpýridin (1,52g).

2-xyano-3-etylsulfanylpyridin:

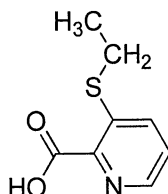


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,49(1H,dd), 7,75(1H,dd), 7,43(1H,dd), 3,06(2H,q), 1,38(3H,t).

Ví dụ điều chế 1(2)

Bổ sung 2-xyano-3-etylsulfanylpyridin (1,4g) vào hỗn hợp gồm axit sulfuric đậm đặc (15ml) và nước (5ml) và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 130°C trong thời gian 2 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung dung dịch kali hydroxit trong nước vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Bổ sung axit clohydric đậm đặc vào lớp nước thu được và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm thu được axit 3-etylsulfanylpicolinic (1,15g).

Axit 3-etylsulfanylpicolinic:

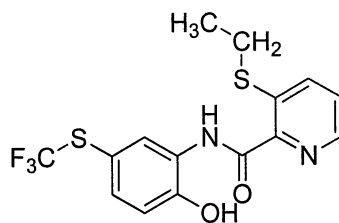


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,31(1H,d), 7,75(1H,d), 7,49(1H,dd), 2,97(2H,q), 1,44(3H,t).

Ví dụ điều chế 1(3)

Hỗn hợp gồm 2-amino-4-(triflometylsulfanyl)phenol (1,0g), hỗn hợp này được tổng hợp bằng quy trình được mô tả trong WO2009-131237, axit 3-etylsulfanylpicolinic (0,87g), EDCI hydroclorua (1,10g) và cloroform (10ml) được khuấy trong thời gian 30 phút ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước muối bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và sau đó cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 3-etylsulfanyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfanyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-6”)(1,32g).

Hợp chất trung gian M4-6:

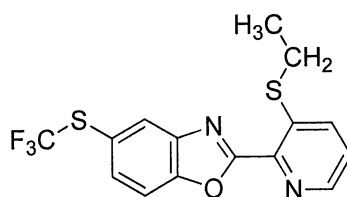


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,40(1H,brs), 9,63(1H,s), 8,36(1H,dd), 7,75(1H,dd), 7,53(1H,d), 7,45(1H,dd), 7,41(1H,dd), 7,08(1H,d), 2,97(2H,q), 1,44(3H,t).

Ví dụ điều chế 1(4)

Hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M4-6 (1,23g), di-2-metoxietyl azodicarboxylat (sau đây được gọi là “DMEAD”)(1,28g), triphenylphosphin (1,39g) và THF (30ml) được khuấy trong thời gian một giờ ở nhiệt độ trong phòng sau đó là một giờ ở nhiệt độ 50°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm. Nước được rót vào hỗn hợp và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lốp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước muối bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và sau đó cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanylpiperidin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfanylpiperidin-2-yl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-6”) (1,21g).

Hợp chất 1-6:

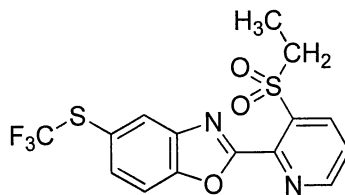


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,59(1H,dd), 8,27(1H,s), 7,78(1H,dd), 7,75-7,69(2H,m), 7,42(1H,dd), 3,07(2H,q), 1,47(3H,t).

Ví dụ điều chế 2

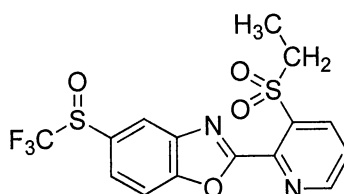
Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 1,47g) vào vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-6 (1,06g) và cloroform (30ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 6 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lốp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanylpiperidin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfanylpiperidin-2-yl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-8”) (0,87g) và 2-(3-ethylsulfanylpiperidin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfanylpiperidin-2-yl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-9”) (0,17g).

Hợp chất 1-8:



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,03(1H,dd), 8,60(1H,dd), 8,19(1H,d), 7,80-7,71(3H,m), 4,02(2H,q), 1,43(3H,t).

Hợp chất 1-9:

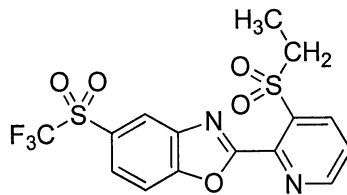


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,04(1H,dd), 8,61(1H,dd), 8,35(1H,d), 7,96-7,86(2H,m), 7,77(1H,dd), 4,01(2H,q), 1,44(3H,t).

Ví dụ điều chế 3

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,43g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-8 (0,35g) và cloroform (8ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 40°C trong thời gian 6 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và sau đó cô dưới áp suất giảm. Bổ sung axetonitril (4ml), natri vonfamat dihydrat (30mg) và dung dịch hydro peroxit 30% (4ml) vào cặn thu được và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 80°C trong thời gian 6 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc. Sau đó, bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào chất rắn kết tủa và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfonyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-10”) (0,35g).

Hợp chất 1-10:

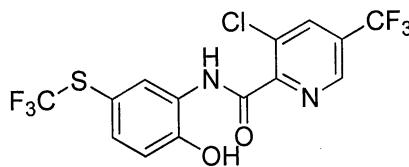


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,05(1H,dd), 8,61(1H,dd), 8,59(1H,d), 8,17(1H,dd), 7,96(1H,d), 7,80(1H,dd), 3,98(2H,q), 1,45(3H,t).

Ví dụ điều chế 4(1)

Hỗn hợp gồm 2-amino-4-(triflometylsulfanyl)phenol (1,0g), axit 3-clo-5-triflometylpicolinic (1,08g), EDCI hydroclorua (1,10g) và cloroform (10ml) được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian một giờ. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lốp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, nước và nước muối bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm thu được 3-clo-5-triflometyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfanyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M10-40”) (1,94g).

Hợp chất trung gian M10-40:

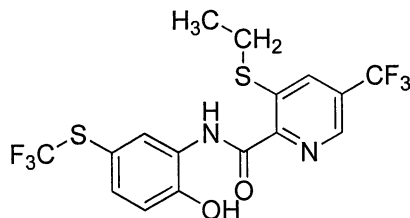


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,78(1H,d), 8,15(1H,d), 8,09(1H,d), 7,37(1H,dd), 7,04(1H,d).

Ví dụ điều chế 4(2)

Bổ sung kali tert-butoxit (0,62g) vào hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M10-40 (1,93g), DMF (6ml), THF (1ml) và etyl mercaptan (0,38ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lốp hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 3-ethylsulfanyl-5-triflometyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfanyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-16”) (1,45g).

Hợp chất trung gian M4-16

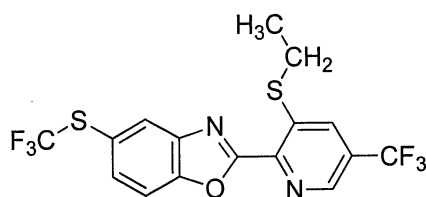


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,31(1H,s), 8,96(1H,brs), 8,58(1H,d), 7,91(1H,d), 7,70(1H,d), 7,43(1H,dd), 7,07(1H,d), 3,00(2H,q), 1,47(3H,t).

Ví dụ điều chế 4(3)

Hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M4-16 (1,45g), DMEAD (1,19g), triphenylphosphin (1,29g) và THF (30ml) được khuấy trong thời gian một giờ ở nhiệt độ trong phòng sau đó là một giờ ở nhiệt độ 50°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm và bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau đó, hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước muối bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-5-(triflometylsulfanyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-16”) (1,31g).

Hợp chất 1-16

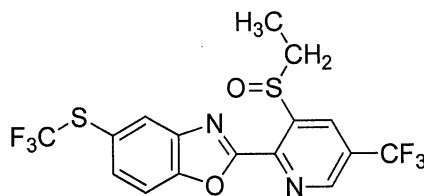


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,78(1H,d), 8,30(1H,s), 7,94(1H,d), 7,77-7,75(2H,m), 3,11(2H,q), 1,51(3H,t).

Ví dụ điều chế 5

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,56g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-16 (1,13g) và cloroform (25ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 40 phút ở nhiệt độ 0°C. Bổ sung natri sunfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-5-(triflometylsulfanyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-17”) (1,01g).

Hợp chất 1-17

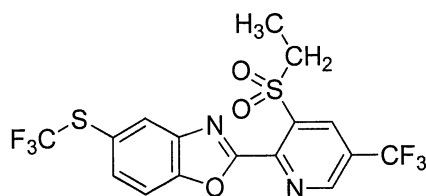


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,13(1H,d), 8,91(1H,d), 8,25(1H,s), 7,85-7,79(2H,m), 3,60-3,49(1H,m), 3,13-3,02(1H,m), 1,44(3H,t).

Ví dụ điều chế 6

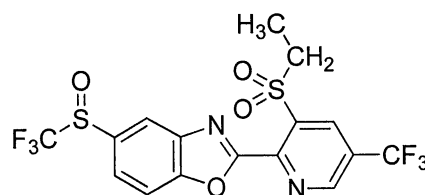
Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,56g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-17 (1,01g) và cloroform (20ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 6 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Ngoài ra, bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,20g) vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lốp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-5-(triflometylsulfanyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-18”) (0,53g) và 2-(3-ethylsulfonyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-5-(triflometylsulfinyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-19”) (0,48g).

Hợp chất 1-18:



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,25(1H,d), 8,84(1H,d), 8,22(1H,d), 7,82(1H,dd), 7,77(1H,d), 4,11(2H,q), 1,47(3H,t).

Hợp chất 1-19:

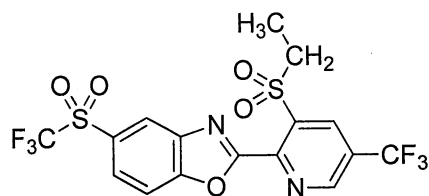


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,27(1H,d), 8,85(1H,d), 8,39(1H,s), 7,96(1H,d), 7,92(1H,d), 4,09(2H,q), 1,48(3H,t).

Ví dụ điều chế 7

Hỗn hợp gồm hợp chất 1-19(0,26g), axetonitril (4ml), natri vonfamat dihydrat (18mg) và dung dịch hydro peroxit 30% (3,5ml) được khuấy trong thời gian 5 giờ ở nhiệt độ 85°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung dung dịch hydro peroxit 30% (0,5ml) vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ 85°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào chất rắn và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lọc hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-5-(triflometylsulfonyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-20”) (0,24g).

Hợp chất 1-20:

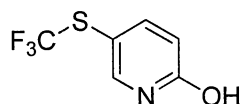


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,28(1H,d), 8,84(1H,d), 8,62(1H,d), 8,21(1H,dd), 8,00(1H,d), 4,05(2H,q), 1,49(3H,t).

Ví dụ điều chế 8(1)

Hỗn hợp gồm tert-butanol (27ml) và kali hydroxit (3,15g) được khuấy trong thời gian một giờ dưới hồi lưu có đun nóng. Bổ sung 2-clo-5-triflometylsulfanylpýridin (6,0g) vào hỗn hợp, hỗn hợp này được tổng hợp bằng quy trình được mô tả trong WO2012-086848 và tert-butanol (3ml) bằng phễu nhỏ giọt. Hỗn hợp được khuấy trong thời gian 5 giờ dưới hồi lưu có đun nóng. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung axit clohydric đậm đặc vào hỗn hợp phản ứng. Chất rắn kết tủa được lọc và rửa bằng rượu etylic. Dịch lọc thu được được cô dưới áp suất giảm và bổ sung axit clohydric 1N vào hỗn hợp. Sau đó, chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc, rửa bằng nước, sau đó là hexan và sau đó làm khô thu được 2-hydroxy-5-triflometylsulfanylpýridin (4,42g).

2-hydroxy-5-triflometylsulfanylpýridin:

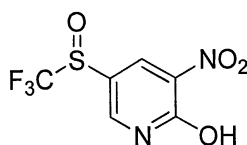


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 7,73(1H,d), 7,62(1H,dd), 6,61(1H,d).

Ví dụ điều chế 8 (2)

Bổ sung axit nitric khối (0,74ml) vào hỗn hợp gồm 2-hydroxy-5-triflometylsulfanylpyridin (2g) và axit sulfuric đậm đặc (10ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 60°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được rót vào nước đá (50ml) và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được rửa bằng tert-butylmetylete thu được 2-hydroxy-3-nitro-5-triflometylsulfinylpyridin (2,13g).

2-hydroxy-3-nitro-5-triflometylsulfinylpyridin:

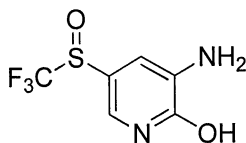


$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-D}_6)$ δ : 8,67(1H,brs), 8,59(1H,brs).

Ví dụ điều chế 8(3)

Hỗn hợp gồm bột sắt (4,6g), axit axetic (0,5ml), rượu etylic (20ml) và nước (15ml) được khuấy ở nhiệt độ 70°C và sau đó bổ sung 2-hydroxy-3-nitro-5-triflometylsulfinylpyridin (2g) vào hỗn hợp và hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 70°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được lọc qua Celite®. Dịch lọc thu được được cô dưới áp suất giảm, dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa được bổ sung vào hỗn hợp và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được rửa bằng tert-butylmetylete thu được 3-amino-2-hydroxy-5-triflometylsulfinylpyridin (1,45g).

3-amino-2-hydroxy-5-triflometylsulfinylpyridin:



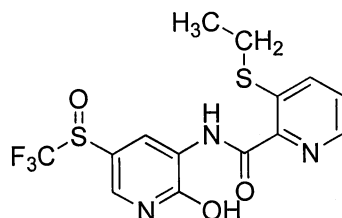
$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-D}_6)$ δ : 12,23(1H,brs), 7,49(1H,s), 6,68(1H,s), 5,72(2H,brs).

Ví dụ điều chế 8(4)

Hỗn hợp gồm 3-amino-2-hydroxy-5-triflometylsulfinylpyridin (0,63g), axit 3-ethylsulfanylpicolinic (0,55g), EDCI hydroclorua (0,68g) và pyridin (20ml)

được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Nước được rót vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được khuấy trong thời gian 30 phút ở nhiệt độ trong phòng. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc và làm khô dưới áp suất giảm thu được 3-ethylsulfanyl-N-[2-hydroxy-5-(triflormethylsulfinyl)pyridin-3-yl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-61”)(0,73g).

Hợp chất trung gian M4-61:

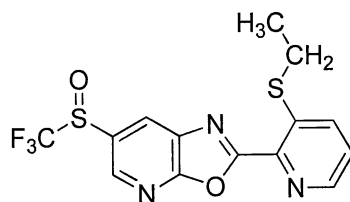


$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-D}_6)$ δ : 10,83(1H,s), 8,71(1H,s), 8,48(1H,dd), 8,09(1H,d), 7,98(1H,d), 7,65(1H,dd), 2,99(2H,q), 1,31(3H,t).

Ví dụ điều chế 8(5)

Hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M4-61 (0,67g), DMEAD (0,64g), triphenylphosphin (0,68g) và THF (40ml) được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ 50°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm và bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau đó, hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch amoni clorua trong nước bão hòa và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanylpicridin-2-yl)-6-(triflormethylsulfinyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-61”)(0,59g).

Hợp chất 1-61:



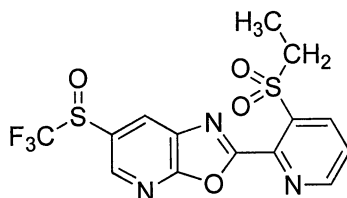
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,76(1H,d), 8,70(1H,d), 8,64(1H,dd), 7,82(1H,dd), 7,47(1H,dd), 3,09(2H,q), 1,47(3H,q).

Ví dụ điều chế 9

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,53g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-61 (0,43g) và cloroform (30ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 5 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung

dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl)-6-(triflometylsulfinyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-4”)(0,34g).

Hợp chất 1-4:

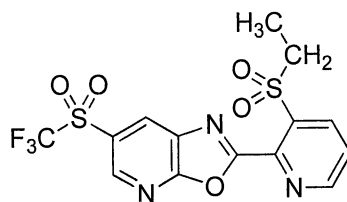


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,08(1H,dd), 8,80(1H,d), 8,69(1H,d), 8,60(1H,dd), 7,81(1H,dd), 3,91(2H,q), 1,45(3H,t).

Ví dụ điều chế 10

Hỗn hợp gồm hợp chất 1-4 (0,17g), axetonitril (4ml), natri vonfamat dihydrat (14mg) và dung dịch hydro peroxit 30% (4ml) được khuấy trong thời gian 4 giờ ở nhiệt độ 80°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc và natri sulfit trong nước 10% được bổ sung vào chất rắn. Sau đó, hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lóp hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl)-6-(triflometylsulfonyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-5”)(0,09g).

Hợp chất 1-5:



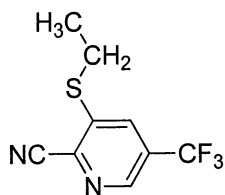
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,13(1H,d), 9,09(1H,dd), 8,79(1H,d), 8,60(1H,dd), 7,83(1H,dd), 3,88(2H,q), 1,46(3H,t).

Ví dụ điều chế 11(1)

Bổ sung natri hydrit (60%, dầu) (2,53g) vào hỗn hợp gồm 3-clo-2-xyano-5-triflometylpyridin (10,0g), etyl mercaptan (4,38ml) và DMF (40ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lóp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan

và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-xyano-3-etylsulfanyl-5-triflometylpyridin (9,25g).

2-xyano-3-etylsulfanyl-5-triflometylpyridin:

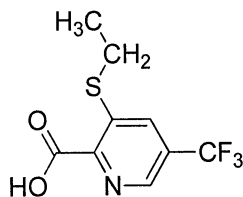


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,68(1H,s), 7,88(1H,s), 3,13(2H,q), 1,44(3H,t).

Ví dụ điều chế 11(2)

Bổ sung 2-xyano-3-etylsulfanyl-5-triflometylpyridin (6,0g) vào hỗn hợp gồm axit sulfuric đậm đặc (30ml) và nước (10ml) và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 130°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh bằng nước đá, bổ sung nước (200ml) vào hỗn hợp và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 30 phút ở nhiệt độ trong phòng. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc, rửa bằng nước và làm khô dưới áp suất giảm thu được axit 3-etylsulfanyl-5-triflometylpicolinic (6,74g).

Axit 3-etylsulfanyl-5-triflometylpicolinic:

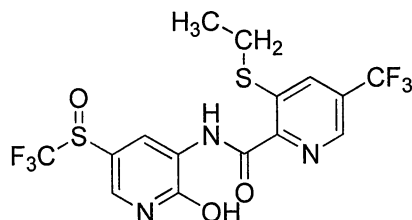


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,55(1H,s), 7,92(1H,s), 3,02(2H,d), 1,47(3H,t).

Ví dụ điều chế 11(3)

Hỗn hợp gồm 3-amino-2-hydroxy-5-triflometylsulfanylpyridin (0,67g), axit 3-etylsulfanyl-5-triflometylpicolinic (0,75g), EDCI hydroclorua (0,68g) và pyridin (20ml) được khuấy trong thời gian 1,5 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Nước được rót vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 15 phút ở nhiệt độ trong phòng. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc và làm khô dưới áp suất giảm thu được 3-etylsulfanyl-5-triflometyl-N-[2-hydroxy-5-triflometylsulfanylpyridin-3-yl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-65”)(1,28g).

Hợp chất trung gian M4-65:

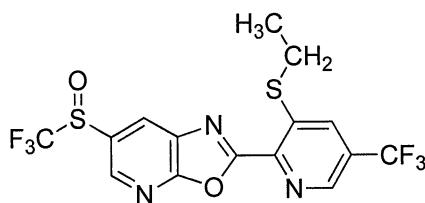


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,99(1H,s), 8,90(1H,s), 8,68(1H,s), 7,91(1H,s), 7,81(1H,s), 3,02(2H,q), 1,48(3H,t).

Ví dụ điều chế 11(4)

Hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M4-65 (1,24g), DMEAD (1,01g), triphenylphosphin (1,06g) và THF (40ml) được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ 50°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm và bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau đó, hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch amoni clorua trong nước bão hòa và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-6-(triflometylsulfinyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-65”) (0,94g).

Hợp chất 1-65:

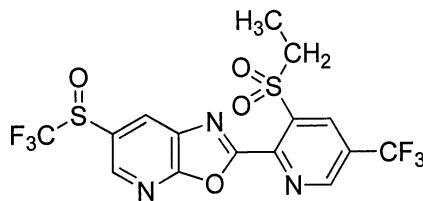


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,83(1H,d), 8,81(1H,d), 8,75(1H,d), 7,97(1H,d), 3,13(2H,q), 1,51(3H,t).

Ví dụ điều chế 12

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 0,77g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-65 (0,74g) và cloroform (30ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 4 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-6-(triflometylsulfinyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-14”) (0,75g).

Hợp chất 1-14:

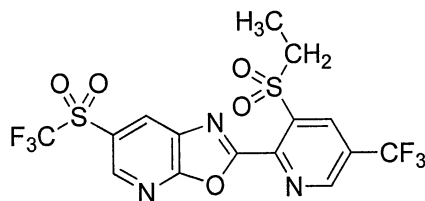


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,31(1H,d), 8,84-8,81(2H,m), 8,73(1H,d), 3,98(2H,q), 1,49(3H,t).

Ví dụ điều chế 13

Hỗn hợp gồm hợp chất 1-14 (0,38g), axetonitril (4ml), natri vonfamat dihydrat (27mg) và dung dịch hydro peroxit 30% (4ml) được khuấy trong thời gian 4,5 giờ ở nhiệt độ 80°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau đó, chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc, bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonyl-5-trifluoromethylpyridin-2-yl)-6-(trifluoromethylsulfonyl)oxazolo[5,4-b]pyridin (sau đây được gọi là “hợp chất 1-15”) (0,21g).

Hợp chất 1-15:

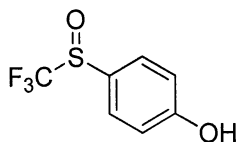


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,32(1H,d), 9,17(1H,d), 8,85-8,82(2H,m), 3,95(2H,q), 1,50(3H,t).

Ví dụ điều chế 14(1)

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 6,33g) vào hỗn hợp gồm 4-(trifluoromethylsulfonyl)phenol (4,85g) và cloroform (100ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 4 giờ dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá. Bổ sung natri sulfit trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được thu gom bằng cách lọc, rửa bằng hexan thu được 4-(trifluoromethylsulfonyl)phenol (5,16g).

4-(trifluoromethylsulfonyl)phenol:



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 7,70(2H,d), 7,06(2H,d).

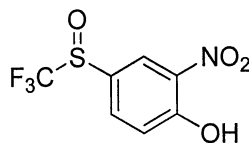
4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol cũng có thể được điều chế bằng phương pháp sau đây:

Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (1,26g) vào hỗn hợp gồm 4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol (5,0g) và 50% axit sulfuric (10,1g) ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ 70°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (0,50g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ 70°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (0,26g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ 70°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (0,6g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 30 phút ở nhiệt độ 70°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung dung dịch natri bicacbonat vào hỗn hợp, và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat và làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được thu gom bằng cách lọc, rửa bằng hexan thu được 4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol (4,62g, độ tinh khiết: 93,6% được tính bởi phần trăm diện tích của LC).

Ví dụ điều chế 14(2)

Bổ sung axit nitric (0,29g) và cô axit sulfuric (160 μ l) vào hỗn hợp gồm 4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol (0,42g) và axit axetic (4ml) và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 8 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Rót nước đá vào hỗn hợp phản ứng và chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc. Chất rắn được rửa bằng nước và làm khô dưới áp suất giảm thu được 2-nitro-4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol (0,28g).

2-nitro-4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol:



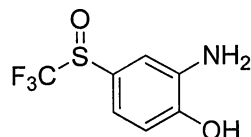
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,97(1H,s), 8,59(1H,d), 8,00(1H,dd), 7,45(1H,d).

Ví dụ điều chế 14(3)

Hỗn hợp gồm 2-nitro-4-(trifluoromethylsulfinyl)phenol (5,0g), paladi cacbon (Pd 5%)(0,50g) và rượu etylic (65ml) được khuấy trong thời gian 6 giờ ở nhiệt

độ 35°C dưới khí quyển hydro. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được lọc qua Celite®. Bổ sung nước vào dịch lọc và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được rửa bằng cloroform thu được 2-amino-4-(triflometylsulfinyl)phenol (3,87g).

2-amino-4-(triflometylsulfinyl)phenol:

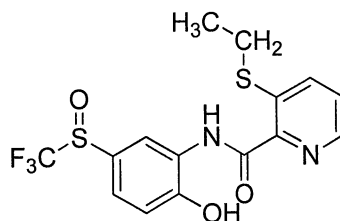


$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 10,30(1H,brs), 7,06(1H,d), 6,91(1H,dd), 6,87(1H,d), 5,18(2H,brs).

Ví dụ điều chế 14(4)

Bổ sung thionyl clorua (0,8ml) vào hỗn hợp gồm axit 3-etylsulfanylpicolinic (1,0g), toluen (12ml) và DMF (0,1ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 100°C trong thời gian 4 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm. Bổ sung THF (8ml) vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được bổ sung vào hỗn hợp gồm 2-amino-4-(triflometylsulfinyl)phenol (1,23g) và THF (12ml) và khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm thu được 3-etylsulfanyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfinyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-63”) (2,07g).

Hợp chất trung gian M4-63:



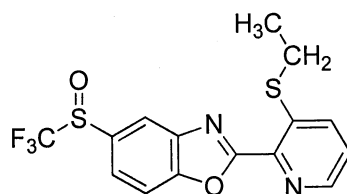
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 10,67(1H,s), 8,90(1H,d), 8,48(1H,dd), 7,97(1H,dd), 7,64(1H,dd), 7,52(1H,dd), 7,22(1H,d), 2,98(2H,q), 1,31(3H,t).

Ví dụ điều chế 14(5)

Hỗn hợp gồm hợp chất trung gian M4-63 (0,60g), DMEAD (0,52g), triphenylphosphin (0,56g) và THF (12ml) được khuấy ở nhiệt độ 50°C trong thời

gian 2,5 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm và bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau đó, hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch amoni clorua trong nước bão hòa và nước muối bão hòa, làm khô trên natri sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfanylpinyin-2-yl)-5-(triflometylsulfinyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-63”) (0,51g).

Hợp chất 1-63:

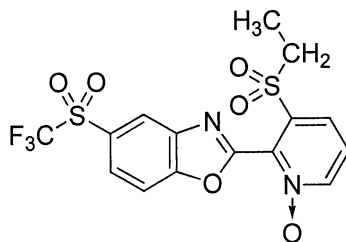


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,61(1H,dd), 8,39(1H,s), 7,93(1H,d), 7,88(1H,d), 7,81(1H,dd), 7,45(1H,dd), 3,08(2H,q), 1,48(3H,t).

Ví dụ điều chế 15

Bổ sung axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết: 65% hoặc cao hơn, 1,42g) vào hỗn hợp gồm hợp chất 1-8 (915mg) và cloroform (8,5ml) và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 4 ngày ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung dung dịch natri thiosulfat trong nước 10% vào hỗn hợp phản ứng và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 10 phút ở nhiệt độ trong phòng. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicarbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước và dung dịch natri clorua trong nước bão hòa, làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được 2-(3-ethylsulfonyloxypinyin-2-yl)-5-(triflometylsulfonyl)benzoxazol (sau đây được gọi là “hợp chất 1-76”)(117mg).

Hợp chất 1-76:

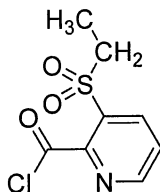


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,58(1H,d), 8,54(1H,dd), 8,18(1H,dd), 7,99-7,93(2H,m), 7,73(1H,dd), 3,56(2H,q), 1,38(3H,t).

Ví dụ điều chế 16(1)

Bổ sung DMF (0,003g) vào huyền phù của axit 3-ethylsulfonylpicolinic (1,00g) trong toluen (5ml) và sau đó bằng cách nhỏ giọt thionyl clorua (1,12g) vào hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó, hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 75°C trong thời gian một giờ và sau đó dung môi được loại bỏ bằng cách cho bay hơi thu được clorua của axit 3-ethylsulfonylpicolinic (1,06g).

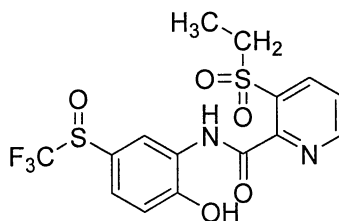
Clorua của axit 3-ethylsulfonylpicolinic:



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,94(1H,dd), 8,42(1H,dd), 7,73(1H,dd), 3,47(2H,q), 1,37(3H,t).

Bổ sung nhỏ giọt dung dịch clorua của axit 3-ethylsulfonylpicolinic trong THF (2ml) vào dung dịch gồm 2-amino-4-(triflometylsulfinyl)phenol (0,93g) trong THF (5ml) dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 18 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được dập tắt bằng nước, trung hòa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và sau đó chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa, sau đó là nước và nước muối bão hòa và sau đó hỗn hợp được làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn thu được được cho sắc ký cột silica gel thu được 3-ethylsulfonyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfinyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-9”)(1,50g).

Hợp chất trung gian M4-9:



$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-d}_6)$ δ : 10,29(1H,s), 8,95(1H,d), 8,67(1H,s), 8,44(1H,d), 7,87(1H,dd), 7,56(1H,d), 7,21(1H,d), 3,70(2H,q), 1,19(3H,t).

Ví dụ điều chế 16(2)

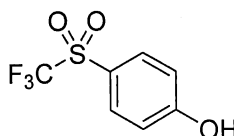
Bổ sung monohydrat của axit p-toluensulfonic (0,45g) vào huyền phù của hợp chất trung gian M4-9 (0,50g) trong xylen (5ml). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 8 giờ bằng cách sử dụng thiết bị Dean-Stark. Sau khi để nguội hỗn hợp phản ứng, bổ sung dung dịch natri bicacbonat trong nước

bảo hòa vào hỗn hợp và sau đó hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat trong nước bảo hòa, sau đó là nước và nước muối bảo hòa. Sau đó, hỗn hợp được làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn thu được được cho sắc ký cột silica gel thu được hợp chất 1-9 (0,38g).

Ví dụ điều chế 17(1)

Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (4,99g) vào hỗn hợp gồm 4-(triflometylsulfanyl)phenol (10,0g) và natri vonfamat dihydrat (0,86g) ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 30 phút ở nhiệt độ 70°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (5,0g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 70°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ 80°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (2,0g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 80°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ 80°C. Bổ sung dung dịch hydro peroxit 35% (1,0g) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 80°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 3 giờ ở nhiệt độ 80°C. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung dung dịch natri sulfit trong nước vào hỗn hợp. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc và cô dưới áp suất giảm thu được 4-(triflometylsulfonyl)phenol (10,81g).

4-(triflometylsulfonyl)phenol:

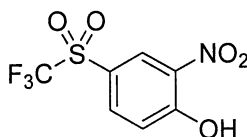


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 7,95-7,91(2H,m), 7,08-7,04(2H,m), 6,34(1H,s).

Ví dụ điều chế 17(2)

Bổ sung axit nitric 65% (1,90ml) ở nhiệt độ 50°C vào hỗn hợp gồm 4-(triflometylsulfonyl)phenol (5,0g) và axit axetic (20ml) và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 9 giờ ở nhiệt độ 50°C và khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 60°C. Bổ sung axit nitric 65% (1,26ml) vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 60°C và sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ 60°C và khuấy trong thời gian 8 giờ ở nhiệt độ 70°C. Nước đá được rót vào hỗn hợp phản ứng và chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc. Chất rắn được rửa bằng nước và làm khô dưới áp suất giảm thu được 2-nitro-4-(triflometylsulfonyl)phenol (4,98g).

2-nitro-4-(triflometylsulfonyl)phenol:

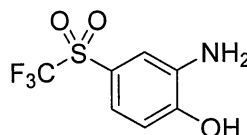


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 11,22(1H,s), 8,85(1H,d), 8,18(1H,dd), 7,47(1H,d).

Ví dụ điều chế 17(3)

Hỗn hợp gồm 2-nitro-4-(triflometylsulfonyl)phenol (4,5g), paladi cacbon (Pd 5%)(1,37g), axit axetic (0,05ml) và rượu etylic (45,6ml) được khuấy trong thời gian 9 giờ ở nhiệt độ 40°C dưới khí quyển hydro. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được lọc qua Celite® và dịch lọc được cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được rửa bằng toluen thu được 2-amino-4-(triflometylsulfonyl)phenol (3,78g).

2-amino-4-(triflometylsulfonyl)phenol:

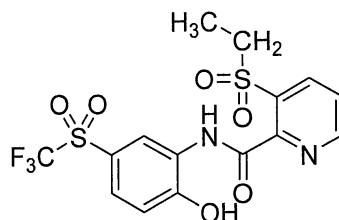


$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$ δ : 11,11(1H,brs), 7,25-7,14(2H,m), 6,98-6,93(1H,m), 5,38(2H,brs).

Ví dụ điều chế 17(4)

Hòa tan 2-amino-4-(triflometylsulfonyl)phenol (0,60g) vào THF (4,22g) và sau đó bổ sung nhỏ giọt clorua của axit 3-etylsulfonylpicolinic (0,59g) tan trong THF (3,63g) được vào hỗn hợp ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 25°C. Sau đó, hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó dung môi được loại bỏ bằng cách cho bay hơi. Chất rắn kết tủa được thu gom bằng cách lọc và làm khô dưới áp suất giảm thu được 3-etylsulfonyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfonyl)phenyl]picolinamit (sau đây được gọi là “hợp chất trung gian M4-10”)(1,09g, độ tinh khiết: 86% được tính bằng $^1\text{H-NMR}$).

Hợp chất trung gian M4-10:



$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$ δ : 12,35(1H,br.s), 10,44(1H,s), 8,96(1H,dd), 8,85(1H,d), 8,44(1H,dd), 7,87(1H,dd), 7,81(1H,dd), 7,31(1H,d), 3,68(2H,q), 1,19(3H,t).

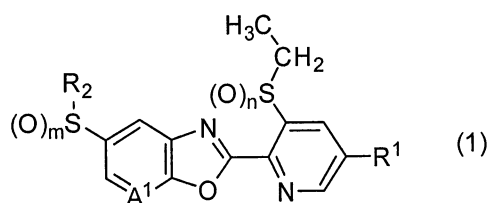
Ví dụ điều chế 17(5)

Bổ sung monoclobenzen (7,23g) và monohydrat của axit p-toluensulfonic (0,52g) vào hợp chất trung gian M4-10 (0,60g) và sau đó hỗn hợp được hồi lưu bằng cách gia nhiệt trong thời gian 17 giờ. Sau khi để hỗn hợp phản ứng nguội đến nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp. Bổ sung

ethyl axetat (40ml) vào hỗn hợp và sau đó lớp hữu cơ được rửa hai lần bằng nước, sau đó là dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hòa và nước muối bão hòa. Lớp hữu cơ được làm khô trên magie sulfat khan và cô dưới áp suất giảm. Cặn được cho sắc ký cột bằng silica gel thu được hợp chất 1-10 (0,35g).

Các hợp chất như được mô tả trong ví dụ điều chế và các hợp chất được điều chế theo cùng cách như trong các ví dụ điều chế được liệt kê trong các bảng được thể hiện dưới đây.

Hợp chất có công thức (1):



trong đó A^1 , R^1 , R^2 , n và m là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 3 đến 5.

Bảng 3

Hợp chất	A ¹	R ¹	R ²	n	m
1-1	N	H	CF ₃	0	0
1-2	N	H	CF ₃	1	0
1-3	N	H	CF ₃	2	0
1-4	N	H	CF ₃	2	1
1-5	N	H	CF ₃	2	2
1-6	CH	H	CF ₃	0	0
1-7	CH	H	CF ₃	1	0
1-8	CH	H	CF ₃	2	0
1-9	CH	H	CF ₃	2	1
1-10	CH	H	CF ₃	2	2
1-11	N	CF ₃	CF ₃	0	0
1-12	N	CF ₃	CF ₃	1	0
1-13	N	CF ₃	CF ₃	2	0
1-14	N	CF ₃	CF ₃	2	1
1-15	N	CF ₃	CF ₃	2	2
1-16	CH	CF ₃	CF ₃	0	0
1-17	CH	CF ₃	CF ₃	1	0
1-18	CH	CF ₃	CF ₃	2	0
1-19	CH	CF ₃	CF ₃	2	1
1-20	CH	CF ₃	CF ₃	2	2
1-21	N	Cl	CF ₃	0	0
1-22	N	Cl	CF ₃	1	0
1-23	N	Cl	CF ₃	2	0
1-24	N	Cl	CF ₃	2	1
1-25	N	Cl	CF ₃	2	2

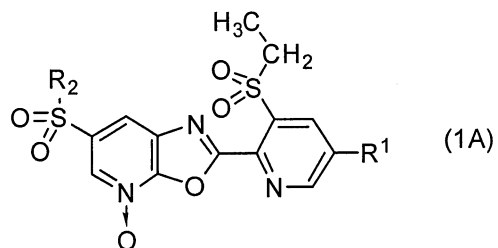
Bảng 4

Hợp chất	A ¹	R ¹	R ²	n	m
1-26	CH	Cl	CF ₃	0	0
1-27	CH	Cl	CF ₃	1	0
1-28	CH	Cl	CF ₃	2	0
1-29	CH	Cl	CF ₃	2	1
1-30	CH	Cl	CF ₃	2	2
1-31	N	Br	CF ₃	0	0
1-32	N	Br	CF ₃	1	0
1-33	N	Br	CF ₃	2	0
1-34	N	Br	CF ₃	2	1
1-35	N	Br	CF ₃	2	2
1-36	CH	Br	CF ₃	0	0
1-37	CH	Br	CF ₃	1	0
1-38	CH	Br	CF ₃	2	0
1-39	CH	Br	CF ₃	2	1
1-40	CH	Br	CF ₃	2	2
1-41	N	H	CF ₂ CF ₃	0	0
1-42	N	H	CF ₂ CF ₃	1	0
1-43	N	H	CF ₂ CF ₃	2	0
1-44	N	H	CF ₂ CF ₃	2	1
1-45	N	H	CF ₂ CF ₃	2	2
1-46	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	0
1-47	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	0
1-48	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	0
1-49	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	1
1-50	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	2

Bảng 5

Hợp chất	A ¹	R ¹	R ²	n	m
1-51	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	0	0
1-52	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	1	0
1-53	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	0
1-54	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	1
1-55	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	2
1-56	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	0	0
1-57	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	1	0
1-58	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	0
1-59	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	1
1-60	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	2
1-61	N	H	CF ₃	0	1
1-62	N	H	CF ₃	0	2
1-63	CH	H	CF ₃	0	1
1-64	CH	H	CF ₃	0	2
1-65	N	CF ₃	CF ₃	0	1
1-66	N	CF ₃	CF ₃	0	2
1-67	CH	CF ₃	CF ₃	0	1
1-68	CH	CF ₃	CF ₃	0	2
1-93	CH	Cl	CF ₃	1	1
1-94	CH	Cl	CF ₃	0	1
1-95	CH	F	CF ₃	0	0
1-96	CH	F	CF ₃	2	0
1-97	CH	F	CF ₃	2	2
1-98	CH	H	CF ₃	1	2

Hợp chất có công thức (1A):

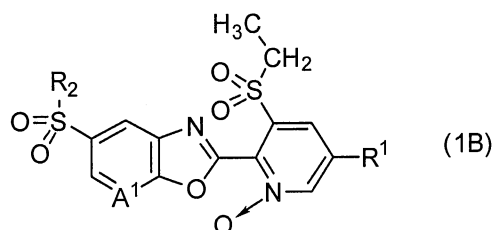


trong đó R^1 và R^2 là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong bảng 6.

Bảng 6

Hợp chất	R^1	R^2
1-69	H	CF_3
1-70	CF_3	CF_3
1-71	Cl	CF_3
1-72	Br	CF_3
1-73	H	CF_2CF_3
1-74	CF_3	CF_2CF_3

Hợp chất có công thức (1B):

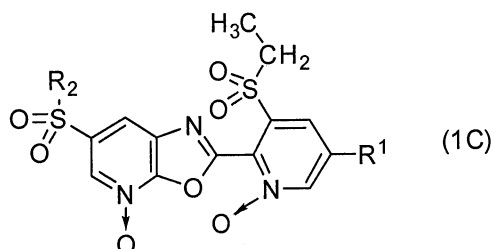


trong đó A^1 , R^1 và R^2 là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong bảng 7.

Bảng 7

Hợp chất	A ¹	R ¹	R ²
1-75	N	H	CF ₃
1-76	CH	H	CF ₃
1-77	N	CF ₃	CF ₃
1-78	CH	CF ₃	CF ₃
1-79	N	Cl	CF ₃
1-80	CH	Cl	CF ₃
1-81	N	Br	CF ₃
1-82	CH	Br	CF ₃
1-83	N	H	CF ₂ CF ₃
1-84	CH	H	CF ₂ CF ₃
1-85	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃
1-86	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃

Hợp chất có công thức (1C):



trong đó R¹ và R² là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong bảng 8.

Bảng 8

Hợp chất	R ¹	R ²
1-87	H	CF ₃
1-88	CF ₃	CF ₃
1-89	Cl	CF ₃
1-90	Br	CF ₃
1-91	H	CF ₂ CF ₃
1-92	CF ₃	CF ₂ CF ₃

Sau đây, Dữ liệu ¹H-NMR của các hợp chất này được liệt kê trong các bảng từ 3 đến 8 được thể hiện.

Hợp chất 1-26:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,50(1H,dd), 8,26(1H,s), 7,74-7,70(3H,m), 3,07(2H,q), 1,50(3H,t).

Hợp chất 1-28:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,96(1H,d), 8,59(1H,d), 8,19(1H,d), 7,79(1H,dd), 7,74(1H,d), 4,08(2H,q), 1,46(3H,t).

Hợp chất 1-29:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,97(1H,dd), 8,60(1H,dd), 8,36(1H,s), 7,94(1H,d), 7,89(1H,d), 4,07(2H,q), 1,47(3H,t).

Hợp chất 1-30:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,99(1H,d), 8,60(1H,d), 8,59(1H,d), 8,18(1H,dd), 7,98(1H,dd), 4,04(2H,q), 1,47(3H,t).

Hợp chất 1-46:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,59(1H,dd), 8,26(1H,d), 7,79(1H,dd), 7,74(1H,d), 7,70(1H,dd), 7,43(1H,dd), 3,07(2H,q), 1,48(3H,t).

Hợp chất 1-48:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 9,03(1H,dd), 8,61(1H,dd), 8,18(1H,s), 7,79-7,71(3H,m), 4,04(2H,q), 1,43(3H,t).

Hợp chất 1-49:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 9,05(1H,dd), 8,62(1H,dd), 8,36(1H,d), 7,94(1H,dd), 7,88(1H,d), 7,78(1H,dd), 4,02(2H,q), 1,44(3H,t).

Hợp chất 1-50:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 9,06(1H,dd), 8,62(1H,dd), 8,58(1H,d), 8,17(1H,dd), 7,97(1H,d), 7,80(1H,dd), 3,99(2H,q), 1,45(3H,t).

Hợp chất 1-64:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,66(1H,d), 8,61(1H,dd), 8,12(1H,dd), 7,98-7,92(1H,m), 7,82(1H,dd), 7,47(1H,dd), 3,09(2H,q), 1,49(3H,t).

Hợp chất 1-94:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,52(1H,d), 8,39(1H,d), 7,93(1H,d), 7,88(1H,dd), 7,74(1H,d), 3,08(2H,q), 1,51(3H,t).

Hợp chất 1-95:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,42(1H,d), 8,26(1H,s), 7,73-7,71(2H,m), 7,48(1H,dd), 3,05(2H,q), 1,50(3H,t).

Hợp chất 1-96:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,88(1H,d), 8,34(1H,dd), 8,19(1H,d), 7,78(1H,dd), 7,74(1H,d), 4,08(2H,q), 1,45(3H,t).

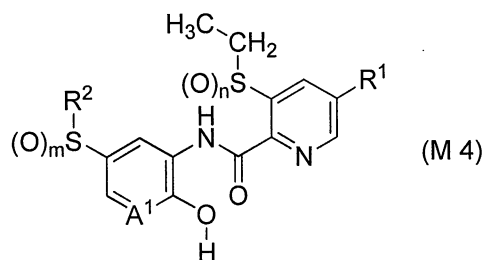
Hợp chất 1-97:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,90(1H,d), 8,59(1H,d), 8,35(1H,dd), 8,18(1H,dd), 7,97(1H,d), 4,04(2H,q), 1,47(3H,t).

Hợp chất 1-98:

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 8,96(1H,dd), 8,70(1H,dd), 8,61(1H,d), 8,18(1H,dd), 8,10-7,96(1H,m), 7,82(1H,dd), 3,62-3,45(1H,m), 3,17-2,99(1H,m), 1,43(3H,t).

Hợp chất có công thức (M4):



trong đó A^1, R^1, R^2, n và m là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 9 đến 11.

Bảng 9

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	n	m
M4-1	N	H	CF ₃	0	0
M4-2	N	H	CF ₃	1	0
M4-3	N	H	CF ₃	2	0
M4-4	N	H	CF ₃	2	1
M4-5	N	H	CF ₃	2	2
M4-6	CH	H	CF ₃	0	0
M4-7	CH	H	CF ₃	1	0
M4-8	CH	H	CF ₃	2	0
M4-9	CH	H	CF ₃	2	1
M4-10	CH	H	CF ₃	2	2
M4-11	N	CF ₃	CF ₃	0	0
M4-12	N	CF ₃	CF ₃	1	0
M4-13	N	CF ₃	CF ₃	2	0
M4-14	N	CF ₃	CF ₃	2	1
M4-15	N	CF ₃	CF ₃	2	2
M4-16	CH	CF ₃	CF ₃	0	0
M4-17	CH	CF ₃	CF ₃	1	0
M4-18	CH	CF ₃	CF ₃	2	0
M4-19	CH	CF ₃	CF ₃	2	1
M4-20	CH	CF ₃	CF ₃	2	2
M4-21	N	Cl	CF ₃	0	0
M4-22	N	Cl	CF ₃	1	0
M4-23	N	Cl	CF ₃	2	0
M4-24	N	Cl	CF ₃	2	1
M4-25	N	Cl	CF ₃	2	2

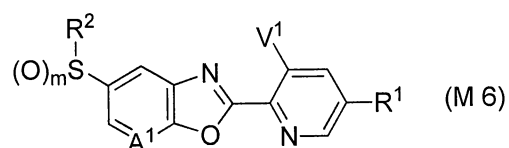
Bảng 10

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	n	m
M4-26	CH	Cl	CF ₃	0	0
M4-27	CH	Cl	CF ₃	1	0
M4-28	CH	Cl	CF ₃	2	0
M4-29	CH	Cl	CF ₃	2	1
M4-30	CH	Cl	CF ₃	2	2
M4-31	N	Br	CF ₃	0	0
M4-32	N	Br	CF ₃	1	0
M4-33	N	Br	CF ₃	2	0
M4-34	N	Br	CF ₃	2	1
M4-35	N	Br	CF ₃	2	2
M4-36	CH	Br	CF ₃	0	0
M4-37	CH	Br	CF ₃	1	0
M4-38	CH	Br	CF ₃	2	0
M4-39	CH	Br	CF ₃	2	1
M4-40	CH	Br	CF ₃	2	2
M4-41	N	H	CF ₂ CF ₃	0	0
M4-42	N	H	CF ₂ CF ₃	1	0
M4-43	N	H	CF ₂ CF ₃	2	0
M4-44	N	H	CF ₂ CF ₃	2	1
M4-45	N	H	CF ₂ CF ₃	2	2
M4-46	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	0
M4-47	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	0
M4-48	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	0
M4-49	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	1
M4-50	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	2

Bảng 11

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	n	m
M4-51	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	0	0
M4-52	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	1	0
M4-53	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	0
M4-54	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	1
M4-55	N	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	2
M4-56	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	0	0
M4-57	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	1	0
M4-58	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	0
M4-59	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	1
M4-60	CH	CF ₃	CF ₂ CF ₃	2	2
M4-61	N	H	CF ₃	0	1
M4-62	N	H	CF ₃	0	2
M4-63	CH	H	CF ₃	0	1
M4-64	CH	H	CF ₃	0	2
M4-65	N	CF ₃	CF ₃	0	1
M4-66	N	CF ₃	CF ₃	0	2
M4-67	CH	CF ₃	CF ₃	0	1
M4-68	CH	CF ₃	CF ₃	0	2

Hợp chất có công thức (M6):



trong đó A¹, R¹, R², m và V¹ là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 12 đến 14.

Bảng 12

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M6-1	N	H	CF ₃	0	F
M6-2	N	H	CF ₃	1	F
M6-3	N	H	CF ₃	2	F
M6-4	CH	H	CF ₃	0	F
M6-5	CH	H	CF ₃	1	F
M6-6	CH	H	CF ₃	2	F
M6-7	N	CF ₃	CF ₃	0	F
M6-8	N	CF ₃	CF ₃	1	F
M6-9	N	CF ₃	CF ₃	2	F
M6-10	CH	CF ₃	CF ₃	0	F
M6-11	CH	CF ₃	CF ₃	1	F
M6-12	CH	CF ₃	CF ₃	2	F
M6-13	N	Cl	CF ₃	0	F
M6-14	N	Cl	CF ₃	1	F
M6-15	N	Cl	CF ₃	2	F
M6-16	CH	Cl	CF ₃	0	F
M6-17	CH	Cl	CF ₃	1	F
M6-18	CH	Cl	CF ₃	2	F
M6-19	N	Br	CF ₃	0	F
M6-20	N	Br	CF ₃	1	F
M6-21	N	Br	CF ₃	2	F
M6-22	CH	Br	CF ₃	0	F
M6-23	CH	Br	CF ₃	1	F
M6-24	CH	Br	CF ₃	2	F
M6-25	N	H	CF ₂ CF ₃	0	F

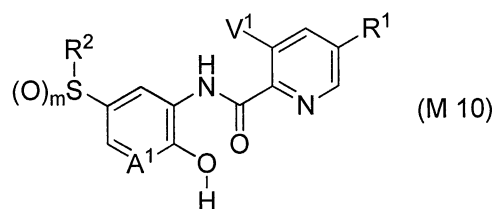
Bảng 13

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M6-26	N	H	CF ₂ CF ₃	1	F
M6-27	N	H	CF ₂ CF ₃	2	F
M6-28	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	F
M6-29	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	F
M6-30	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	F
M6-31	N	H	CF ₃	0	Cl
M6-32	N	H	CF ₃	1	Cl
M6-33	N	H	CF ₃	2	Cl
M6-34	CH	H	CF ₃	0	Cl
M6-35	CH	H	CF ₃	1	Cl
M6-36	CH	H	CF ₃	2	Cl
M6-37	N	CF ₃	CF ₃	0	Cl
M6-38	N	CF ₃	CF ₃	1	Cl
M6-39	N	CF ₃	CF ₃	2	Cl
M6-40	CH	CF ₃	CF ₃	0	Cl
M6-41	CH	CF ₃	CF ₃	1	Cl
M6-42	CH	CF ₃	CF ₃	2	Cl
M6-43	N	Cl	CF ₃	0	Cl
M6-44	N	Cl	CF ₃	1	Cl
M6-45	N	Cl	CF ₃	2	Cl
M6-46	CH	Cl	CF ₃	0	Cl
M6-47	CH	Cl	CF ₃	1	Cl
M6-48	CH	Cl	CF ₃	2	Cl
M6-49	N	Br	CF ₃	0	Cl
M6-50	N	Br	CF ₃	1	Cl

Bảng 14

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M6-51	N	Br	CF ₃	2	Cl
M6-52	CH	Br	CF ₃	0	Cl
M6-53	CH	Br	CF ₃	1	Cl
M6-54	CH	Br	CF ₃	2	Cl
M6-55	N	H	CF ₂ CF ₃	0	Cl
M6-56	N	H	CF ₂ CF ₃	1	Cl
M6-57	N	H	CF ₂ CF ₃	2	Cl
M6-58	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	Cl
M6-59	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	Cl
M6-60	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	Cl
M6-61	CH	F	CF ₃	0	F
M6-62	CH	F	CF ₃	2	F

Hợp chất có công thức (M10):



trong đó A¹, R¹, R², m và V¹ là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 15 đến 17.

Bảng 15

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M10-1	N	H	CF ₃	0	F
M10-2	N	H	CF ₃	1	F
M10-3	N	H	CF ₃	2	F
M10-4	CH	H	CF ₃	0	F
M10-5	CH	H	CF ₃	1	F
M10-6	CH	H	CF ₃	2	F
M10-7	N	CF ₃	CF ₃	0	F
M10-8	N	CF ₃	CF ₃	1	F
M10-9	N	CF ₃	CF ₃	2	F
M10-10	CH	CF ₃	CF ₃	0	F
M10-11	CH	CF ₃	CF ₃	1	F
M10-12	CH	CF ₃	CF ₃	2	F
M10-13	N	Cl	CF ₃	0	F
M10-14	N	Cl	CF ₃	1	F
M10-15	N	Cl	CF ₃	2	F
M10-16	CH	Cl	CF ₃	0	F
M10-17	CH	Cl	CF ₃	1	F
M10-18	CH	Cl	CF ₃	2	F
M10-19	N	Br	CF ₃	0	F
M10-20	N	Br	CF ₃	1	F
M10-21	N	Br	CF ₃	2	F
M10-22	CH	Br	CF ₃	0	F
M10-23	CH	Br	CF ₃	1	F
M10-24	CH	Br	CF ₃	2	F
M10-25	N	H	CF ₂ CF ₃	0	F

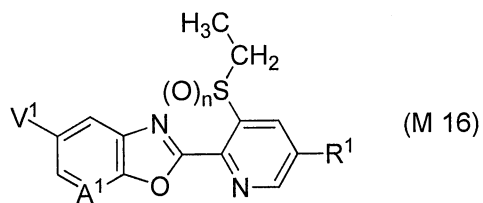
Bảng 16

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M10-26	N	H	CF ₂ CF ₃	1	F
M10-27	N	H	CF ₂ CF ₃	2	F
M10-28	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	F
M10-29	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	F
M10-30	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	F
M10-31	N	H	CF ₃	0	Cl
M10-32	N	H	CF ₃	1	Cl
M10-33	N	H	CF ₃	2	Cl
M10-34	CH	H	CF ₃	0	Cl
M10-35	CH	H	CF ₃	1	Cl
M10-36	CH	H	CF ₃	2	Cl
M10-37	N	CF ₃	CF ₃	0	Cl
M10-38	N	CF ₃	CF ₃	1	Cl
M10-39	N	CF ₃	CF ₃	2	Cl
M10-40	CH	CF ₃	CF ₃	0	Cl
M10-41	CH	CF ₃	CF ₃	1	Cl
M10-42	CH	CF ₃	CF ₃	2	Cl
M10-43	N	Cl	CF ₃	0	Cl
M10-44	N	Cl	CF ₃	1	Cl
M10-45	N	Cl	CF ₃	2	Cl
M10-46	CH	Cl	CF ₃	0	Cl
M10-47	CH	Cl	CF ₃	1	Cl
M10-48	CH	Cl	CF ₃	2	Cl
M10-49	N	Br	CF ₃	0	Cl
M10-50	N	Br	CF ₃	1	Cl

Bảng 17

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	R ²	m	V ¹
M10-51	N	Br	CF ₃	2	Cl
M10-52	CH	Br	CF ₃	0	Cl
M10-53	CH	Br	CF ₃	1	Cl
M10-54	CH	Br	CF ₃	2	Cl
M10-55	N	H	CF ₂ CF ₃	0	Cl
M10-56	N	H	CF ₂ CF ₃	1	Cl
M10-57	N	H	CF ₂ CF ₃	2	Cl
M10-58	CH	H	CF ₂ CF ₃	0	Cl
M10-59	CH	H	CF ₂ CF ₃	1	Cl
M10-60	CH	H	CF ₂ CF ₃	2	Cl
M10-61	CH	F	CF ₃	0	F
M10-62	CH	F	CF ₃	2	F

Hợp chất có công thức (M16):



trong đó A¹, R¹, n và V¹ là sự phối hợp bất kỳ trong số các phối hợp được liệt kê trong các bảng từ 18 đến 19.

Bảng 18

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	n	V ¹
M16-1	N	H	0	Br
M16-2	N	H	1	Br
M16-3	N	H	2	Br
M16-4	CH	H	0	Br
M16-5	CH	H	1	Br
M16-6	CH	H	2	Br
M16-7	N	CF ₃	0	Br
M16-8	N	CF ₃	1	Br
M16-9	N	CF ₃	2	Br
M16-10	CH	CF ₃	0	Br
M16-11	CH	CF ₃	1	Br
M16-12	CH	CF ₃	2	Br
M16-13	N	Cl	0	Br
M16-14	N	Cl	1	Br
M16-15	N	Cl	2	Br
M16-16	CH	Cl	0	Br
M16-17	CH	Cl	1	Br
M16-18	CH	Cl	2	Br
M16-19	N	Br	0	Br
M16-20	N	Br	1	Br
M16-21	N	Br	2	Br
M16-22	CH	Br	0	Br
M16-23	CH	Br	1	Br
M16-24	CH	Br	2	Br
M16-25	N	H	0	I

Bảng 19

Hợp chất trung gian	A ¹	R ¹	n	V ¹
M16-26	N	H	1	I
M16-27	N	H	2	I
M16-28	CH	H	0	I
M16-29	CH	H	1	I
M16-30	CH	H	2	I
M16-31	N	CF ₃	0	I
M16-32	N	CF ₃	1	I
M16-33	N	CF ₃	2	I
M16-34	CH	CF ₃	0	I
M16-35	CH	CF ₃	1	I
M16-36	CH	CF ₃	2	I
M16-37	N	Cl	0	I
M16-38	N	Cl	1	I
M16-39	N	Cl	2	I
M16-40	CH	Cl	0	I
M16-41	CH	Cl	1	I
M16-42	CH	Cl	2	I
M16-43	N	Br	0	I
M16-44	N	Br	1	I
M16-45	N	Br	2	I
M16-46	CH	Br	0	I
M16-47	CH	Br	1	I
M16-48	CH	Br	2	I

Sau đây, Dữ liệu ¹H-NMR của các hợp chất trung gian được liệt kê trong bảng 9 đến 19 được thể hiện.

M4-8

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}d_6)$ δ : 11,05(1H,s), 10,15(1H,s), 8,95(1H,d), 8,47(1H,s), 8,43(1H,d), 7,87(1H,dd), 7,38(1H,d), 7,06(1H,d), 3,71(2H,q), 1,19(3H,t).

M4-46

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,42(1H,s), 8,37(1H,dd), 7,75(1H,dd), 7,53(1H,d), 7,46(1H,dd), 7,40(1H,dd), 7,08(1H,d), 2,97(2H,q), 1,45(3H,t).

M4-64

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}d_6)$ δ : 12,54(1H,s), 10,69(1H,s), 9,07(1H,s), 8,48(1H,d), 7,98(1H,d), 7,77(1H,d), 7,65(1H,dd), 7,31(1H,d), 2,99(2H,q), 1,31(3H,t).

M6-34

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,77(1H,dd), 8,26(1H,s), 7,98(1H,dd), 7,77-7,72(2H,m), 7,47(1H,dd).

M6-35

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}D_6)$ δ : 8,82(1H,dd), 8,52(1H,s), 8,30-8,24(2H,m), 8,07(1H,d), 7,75(1H,dd).

M6-36

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,79(1H,dd), 8,65(1H,d), 8,16(1H,dd), 8,01(1H,dd), 7,97(1H,d), 7,53(1H,dd).

M6-46

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,71(1H,dd), 8,25(1H,s), 8,00(1H,dd), 7,79-7,72(2H,m).

M6-61

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,61(1H,d), 8,23(1H,s), 7,79-7,72(2H,m), 7,54-7,47(1H,m).

M10-34

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10,29(1H,s), 9,45(1H,brs), 8,58(1H,dd), 7,94(1H,dd), 7,54(1H,d), 7,51(1H,dd), 7,44(1H,dd), 7,10(1H,d).

M10-35

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}D_6)$ δ : 11,59(1H,s), 10,47(1H,s), 8,83(1H,d), 8,69(1H,dd), 8,15(1H,dd), 7,69(1H,dd), 7,55(1H,dd), 7,22(1H,d).

M10-36

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}d_6)$ δ : 12,48(1H,br.s), 10,56(1H,s), 9,01(1H,d), 8,70(1H,dd), 8,16(1H,dd), 7,79(1H,dd), 7,70(1H,dd), 7,31(1H,d).

M10-46

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-}D_6)$ δ : 11,64(1H,brs), 10,36(1H,s), 8,80-8,77(2H,m), 8,46(1H,d), 7,54(1H,d), 7,21(1H,d).

M10-61

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,91(1H,brs), 9,42(1H,s), 8,42(1H,d), 7,54(1H,d), 7,48-7,43(2H,m), 7,10(1H,d).

M16-25

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,63(1H,d), 8,61(1H,dd), 8,51(1H,d), 7,78(1H,dd), 7,43(1H,dd), 3,05(2H,q), 1,45(3H,t).

M16-28

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,57(1H,dd), 8,27(1H,d), 7,77(1H,dd), 7,71(1H,dd), 7,46(1H,d), 7,40(1H,dd), 3,05(2H,q), 1,46(3H,t).

M16-29

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,91(1H,d), 8,64(1H,d), 8,26-8,20(1H,m), 7,80-7,70(2H,m), 7,50(1H,d), 3,53-3,42(1H,m), 3,06-2,96(1H,m), 1,41(3H,t).

M16-30

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9,02(1H,dd), 8,59(1H,dd), 8,20(1H,d), 7,76(1H,dd), 7,72(1H,dd), 7,47(1H,d), 4,02(2H,q), 1,42(3H,t).

M16-31

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 8,80(1H,s), 8,67(1H,d), 8,56(1H,d), 7,93(1H,s), 3,10(2H,q), 1,49(3H,t).

Tiếp theo, các ví dụ phối chế sẽ được mô tả. Ở đây, các thuật ngữ “(các phần)” có nghĩa là “(các) phần trọng lượng”.

Ví dụ phối chế 1

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10 phần) được hòa tan trong hỗn hợp gồm xylen (35 phần) và N,N-dimetylformamit (35 phần) và bổ sung polyoxyetylen styryl phenyl ete (14 phần) và canxi dodexylbenzen-sulfonat (6 phần) vào hỗn hợp và khuấy thu được chất cô có thể tạo nhũ của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 2

Natri lauryl sulfat (4 phần), canxi lignin sulfonat (2 phần), bột mịn silica (20 phần) và diatomit (54 phần) được trộn, sau đó bổ sung hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (20 phần) vào hỗn hợp và trộn thu được bột có thể thấm ướt của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 3

Bổ sung bột mịn silica (1 phần), canxi lignin sulfonat (2 phần), bentonit (30 phần) và đất sét kaolanh (65 phần) vào hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất

từ 1-1 đến 1-98 (2 phần) và trộn. Sau đó, vào hỗn hợp được bổ sung lượng thích hợp của nước, khuấy tiếp, tạo hạt bằng máy tạo hạt và làm khô sơ bộ các hạt thu được hạt của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 4

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (1 phần) được hòa tan trong lượng thích hợp của axeton. Bổ sung bột mịn silica (5 phần) vào hỗn hợp, PAP (0,3 phần) và pyrophyllit (93,7 phần) và khuấy kỹ. Sau đó, axeton được loại bỏ bằng cách cho bay hơi thu được các bụi của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 5

Hỗn hợp (tỷ lệ phân tử = 1: 1) gồm muối amoni polyoxyetylen alkyl ete sulfat và cacbon trắng (35 phần), hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10 phần) và nước (55 phần) được trộn, nghiền bột bằng máy nghiền ướt thu được chất cô dạng huyền phù của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 6

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,1 phần) được hòa tan trong xylen (5 phần) và tricloetan (5 phần) và trộn với dầu hỏa đã khử mùi (89,9 phần) thu được các dung dịch dầu của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 7

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10mg) được hòa tan trong axeton (0,5ml). Hỗn hợp được bổ sung vào thức ăn rắn dạng bột dùng cho động vật (thức ăn rắn dạng bột để nhân giống, CE-2, từ CLEA Japan, Inc.) (5g) và trộn đồng nhất. Sau đó, axeton được loại bỏ bằng cách cho bay hơi thu được bã độc của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 8

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,1 phần) và Neothiosol (Chuo Kasei Co. Ltd.) (49,9 phần) được nạp vào bình chứa sol khí. Sau khi van sol khí được lắp vào bình, dimetyl ete (25 phần) và LPG (25 phần) được nạp vào bình. Bình được rung và lắp cần kích hoạt thu được sol khí dạng dầu của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 9

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,6 phần), BHT (2,6-di-tert-butyl-4-metylphenol) (0,01 phần), xylen (5 phần), dầu hỏa đã khử mùi (3,39 phần) và chất tạo nhũ (RHEODOL MO-60, do Kao Corporation sản xuất) (1 phần) được trộn và hòa tan. Hỗn hợp và nước cất (50 phần) được nạp vào bình sol khí và lắp van. Sau đó, chất đẩy (LPG) (40 phần) được nạp áp lực vào bình qua van thu được sol khí trong nước của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 10

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,1g) được hòa tan trong propylen glycol (2ml) và dung dịch được thấm vào tấm gôm xốp (4,0 x 4,0cm, dày 1,2cm) thu được tác nhân tạo khối loại gia nhiệt.

Ví dụ phối chế 11

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (5 phần) và etylen-metyl metacrylat copolyme (tỷ lệ của metyl metacrylat trong copolyme: 10% trọng lượng, Acryft WD301, do Sumitomo Chemical Co., Ltd sản xuất) (95 phần) được trộn nóng chảy bằng thiết bị ngào trộn điều áp, kín (do Moriyama Co., Ltd. sản xuất). hỗn hợp thu được được ép đùn từ máy đúc nhờ khuôn đúc thu được áp đúc dạng thanh (dài 15cm, đường kính 3 mm).

Ví dụ phối chế 12

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (5 phần) và nhựa vinyl clorua mềm (95 phần) được trộn nóng chảy bằng máy ngào trộn điều áp, kín (do Moriyama Co., Ltd. sản xuất). Hỗn hợp thu được được ép đùn từ máy đúc nhờ khuôn đúc thu được sản phẩm đúc dạng thanh (dài 15cm, đường kính 3mm).

Ví dụ phối chế 13

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (100mg), lactoza (68,75mg), tinh bột ngô (237,5mg), xenluloza vi tinh thể (43,75mg), polyvinyl pyrrolidon (18,75mg), tinh bột natri carboxymetyl (28,75mg) và magie stearat (2,5mg) được trộn và hỗn hợp thu được được nén thành kích cỡ phù hợp thu được các viên nén.

Ví dụ phối chế 14

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (25mg), lactoza (60mg), tinh bột ngô (25mg), carmeloza canxi (6mg) và hydroxypropylmetyl xenluloza 5% (lượng phù hợp) được trộn và hỗn hợp thu được đóng gói vào các viên nang gelatin vỏ cứng hoặc các viên nang hydroxypropyl metyl-xenluloza thu được các viên nang.

Ví dụ phối chế 15

Bổ sung nước cất vào hỗn hợp gồm hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (1000mg), axit fumaric (500mg), natri clorua (2000mg), methylparaben (150mg), propylparaben (50mg), đường hạt (25000mg), dung dịch sorbitol 70% (13000mg), VeegumK (VanderbiltCo) (100mg), nước thơm (35mg) và chất tạo màu (500mg) sao cho thể tích cuối cùng trở thành 100ml và trộn kỹ thu được huyền phù để dùng qua đường miệng.

Ví dụ phối chế 16

Bổ sung hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (5% trọng lượng) được hòa tan trong Polysorbate 85 (5% trọng lượng), benzyl rượu (3% trọng lượng) và propylen glycol (30% trọng lượng) và đệm phosphat vào hỗn hợp sao cho độ pH nằm trong khoảng từ 6,0 đến 6,5 và bổ sung nước vào hỗn hợp tới thể tích cuối cùng thu được dịch lỏng để dùng qua đường miệng.

Ví dụ phối chế 17

Nhôm distearat (5% trọng lượng) được phân tán vào dầu dừa cắt đoạn (57% trọng lượng) và Polysorbate 85 (3% trọng lượng) bằng cách gia nhiệt. Sau khi làm nguội đến nhiệt độ trong phòng, sacarin (25% trọng lượng) được phân tán vào chất mang dầu. Sau đó, bổ sung hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10% trọng lượng) vào hỗn hợp thu được bột nhão để dùng qua đường miệng.

Ví dụ phối chế 18

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (5% trọng lượng) và bột đá vôi (95% trọng lượng) được trộn và sau đó hỗn hợp được cho nghiền hạt ướt thu được các hạt để dùng qua đường miệng.

Ví dụ phối chế 19

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (5 phần) được hòa tan trong dietylen glycol monoetyl ete (80 phần) và sau đó propylen cacbonat (15 phần) được trộn trong đó thu được dịch lỏng đặt đúng chỗ.

Ví dụ phối chế 20

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10 phần) được hòa tan trong dietylen glycol monoetyl ete (70 phần) và sau đó 2-octyldodecanol (20 phần) được trộn vào đó thu được dịch lỏng đổ lên.

Ví dụ phối chế 21

Bổ sung Nikkol TEALS-42 (Nikko Chemicals Co., Ltd., dung dịch trong nước của rượu etylicamin lauryl sulfat) 42% (60 phần) và propylen glycol (20 phần) vào hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,5 phần) được. Sau khi khuấy và trộn đủ để tạo ra dung dịch đồng nhất, bổ sung nước (19,5 phần) vào hỗn hợp và hỗn hợp được khuấy và trộn thích hợp thu được chế phẩm gỏi đồng nhất.

Ví dụ phối chế 22

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,15% trọng lượng), thức ăn cho động vật (95% trọng lượng) và hỗn hợp (4,85% trọng lượng) gồm dicanxi phosphat, diatomit, Aerosil và cacbonat (hoặc phần) được

khuấy và trộn thích hợp thu được hỗn hợp trộn sẵn dùng cho thức ăn cho động vật.

Ví dụ phối chế 23

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (7,2g) và Vosco S-55 (do Maruishi Pharmaceutical Co., Ltd. sản xuất) (92,8g) được hòa tan và trộn ở nhiệt độ 100°C. Sau đó, hỗn hợp được rót vào khuôn đúc thuốc đạn và được làm nguội và đóng rắn thu được thuốc đạn.

Ví dụ phối chế 24

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10 phần), các muối polyoxyalkylen arylphenyl ete phosphat, propylen glycol (5 phần), chất khử bột silicon (0,2 phần) và nước (58,5 phần) được trộn và nghiền bột bằng phương pháp nghiền ướt thu được huyền phù. Bổ sung hỗn hợp gồm magie nhôm silicat (0,4 phần), gôm xantan (0,2 phần), chất bảo quản 0,2 phần) và nước (23,5 phần) vào huyền phù thu được và trộn thu được chất cô dạng huyền phù của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 25

Bổ sung hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (10 phần) và hydrocacbon thơm (Solvesso 200ND, do ExxonMobil Chemical sản xuất) (20 phần) vào dung dịch trong nước của polyvinyl rượu thu được bằng cách hòa tan polyvinyl rượu (3 phần) trong nước (43,5 phần) và hỗn hợp được khuấy bằng máy khuấy thu được huyền phù. Bổ sung hỗn hợp gồm magie nhôm silicat (0,3 phần), gôm xantan (0,15 phần), chất bảo quản (0,2 phần) và nước (17,65 phần) và propylen glycol (5 phần) và chất khử bột silicon (0,2 phần) vào huyền phù thu được và trộn thu được chất cô huyền phù của mỗi hợp chất.

Ví dụ phối chế 26

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (3,6 phần) được trộn với axeton (14,3 phần) thu được dung dịch. Bổ sung kẽm oxit (0,2 phần), tinh bột α (1,0 phần) và azodicarbonamit (42,8 phần) vào dung dịch thu được. Sau khi bổ sung nước (38,1 phần) vào hỗn hợp, hỗn hợp được ngào trộn và tạo thành dạng hạt bằng cách sử dụng máy ép đùn và sau đó làm khô. Các hạt thu được chứa hợp chất này được cho vào khoảng trống ở phần trên của bình có vách ngăn được làm bằng nhôm ở phần tâm của nó và canxi oxit (50g) được cho vào khoảng trống ở phần dưới của bình, thu được tác nhân tạo khói.

Ví dụ phối chế 27

Kẽm oxit (0,5 phần), tinh bột α (2 phần) và azodicarbonamit (97,5 phần) được trộn và bổ sung nước vào hỗn hợp. Hỗn hợp được ngào trộn và tạo thành dạng hạt bằng cách sử dụng máy ép đùn và sau đó làm khô thu được các hạt.

Các hạt (2g) được tẩm đồng nhất bằng dung dịch của hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98 (0,58g) trong axeton và sau đó làm khô thu được các hạt chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất từ 1-1 đến 1-98. Các hạt thu được chứa hợp chất này được cho vào khoảng trống ở phần bên trên của bình có vách ngăn được làm bằng nhôm ở phần tâm của nó và canxi oxit (50g) được cho vào khoảng trống ở phần dưới của bình, thu được tác nhân tạo khói.

Hiệu quả diệt trừ sinh vật gây hại bởi hợp chất này sẽ được minh họa dưới đây dựa vào các ví dụ thử nghiệm.

Ví dụ thử nghiệm 1

Mỗi dung dịch thử nghiệm được chuẩn bị bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63, 1-65 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được thành phần hoạt tính có nồng độ 500 ppm.

Mặt khác, lên cây giống dưa chuột (giai đoạn lá thật thứ nhất) được cấy trong cốc nhựa được ủ với khoảng 30 rệp vùng *Aphis gossypii* (toàn bộ giai đoạn) và để nó trong thời gian một ngày. Hai mươi (20) ml mỗi dung dịch thử nghiệm được phun lên cây giống.

Sáu ngày sau khi phun, số côn trùng rệp vùng *Aphis gossypii* được ký sinh trên lá cây dưa chuột được xem xét và van kiểm soát được tính toán theo biểu thức dưới đây:

$$\text{Giá trị diệt trừ (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong công thức trên là như sau:

Cb: số côn trùng trong phần không được xử lý trước khi xử lý

Cai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

Tb: số côn trùng trong phần được xử lý trước khi xử lý

Tai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

trong đó phần không được xử lý là phần mà dung dịch pha loãng thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm không có hợp chất này như trong ví dụ phối chế 5 với cùng lượng nước như trong phần được xử lý được sử dụng.

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63, 1-65 và 1-76, giá trị diệt trừ là 90% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 2

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm

chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-8, 1-9, 1-10 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm nồng độ của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây giống dưa chuột (giai đoạn hai lá thực) được trồng trong chậu nhựa được phun nước ở gốc của nó với 5ml mỗi dung dịch thử nghiệm và giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C trong thời gian 7 ngày. Trên bề mặt lá dưa chuột được ghép với khoảng 30 rệp vùng *Aphis gossypii* (toàn bộ giai đoạn) và được giữ tiếp trong nhà kính trong thời gian 6 ngày, sau đó số côn trùng rệp vùng *Aphis gossypii* ký sinh trên các lá dưa chuột sống sót được xem xét và giá trị diệt trừ được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Giá trị diệt trừ (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong biểu thức trên là như sau:

Cb: số côn trùng trong phần không được xử lý trước khi xử lý

Cai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

Tb: số côn trùng trong phần được xử lý trước khi xử lý

Tai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

trong đó phần không được xử lý là phần mà dung dịch pha loãng thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm không có hợp chất này như trong ví dụ phối chế 5 với cùng lượng nước như trong phần được xử lý được sử dụng.

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-8, 1-9, 1-10 và 1-76, giá trị diệt trừ là 90% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 3

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-48, 1-49 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây mạ (giai đoạn lá thứ hai) được cấy trong cốc polyetylen được phun 10ml mỗi dung dịch thử nghiệm. Sau khi làm khô bằng không khí, 20 ba phần tư số ấu trùng của rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) được thả và giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C. Sau 6 ngày, số côn trùng rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) ký sinh trên lúa sống sót được xem xét và giá trị diệt trừ được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Giá trị diệt trừ (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong biểu thức trên là như sau:

Cb: số côn trùng trong phần không được xử lý trước khi xử lý

Cai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

Tb: số côn trùng trong phần được xử lý trước khi xử lý

Tai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

trong đó phần không được xử lý là phần ở đó dung dịch pha loãng thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm không có hợp chất này như trong ví dụ phối chế 5 với cùng lượng nước như trong phần được xử lý được sử dụng.

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-48, 1-49 và 1-76, giá trị diệt trừ là 90% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 4

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-19, 1-48, 1-49, 1-63 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây mạ (2 tuần sau gieo, giai đoạn lá thứ hai) được cấy trong cốc nhựa được phun nước ở rễ của nó với 5ml mỗi dung dịch thử nghiệm và giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C trong thời gian 7 ngày. Hai mươi (20) ba phần tư số ấu trùng của rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) được thả và giữ tiếp trong nhà kính trong thời gian 6 ngày, sau đó số côn trùng rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) ký sinh trên lúa sống sót được xem xét và giá trị diệt trừ được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Giá trị diệt trừ (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong biểu thức trên là như sau:

Cb: số côn trùng trong phần không được xử lý trước khi xử lý

Cai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

Tb: số côn trùng trong phần được xử lý trước khi xử lý

Tai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

trong đó phần không được xử lý là phần ở đó dung dịch pha loãng thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm không có hợp chất này như trong ví dụ phối chế 5 với cùng lượng nước như trong phần được xử lý được sử dụng.

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-19, 1-48, 1-49, 1-63 và 1-76, giá trị diệt trừ là 90% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 5

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất này như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, rệp phấn trắng trưởng thành *Bemisia tabaci* được thả vào cây cà chua (giai đoạn ba lá thật) được trồng trong cốc polyetylen và được để để trứng trong khoảng 72 giờ. Cây cà chua được giữ trong nhà kính trong thời gian 8 ngày. Khi ấu trùng hình sao thứ nhất chui ra từ trứng, dung dịch thử nghiệm nêu trên được phun với lượng 20 ml/cốc. Cốc được giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C. Sau khi giữ trong thời gian 7 ngày, số ấu trùng sống sót trên các lá cà chua được xem xét và giá trị kiểm soát được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Giá trị diệt trừ (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong biểu thức trên là như sau:

Cb: số côn trùng trong phần không được xử lý trước khi xử lý

Cai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

Tb: số côn trùng trong phần được xử lý trước khi xử lý

Tai: số côn trùng trong phần không được xử lý khi quan sát

trong đó phần không được xử lý là phần ở đó dung dịch pha loãng thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm không có hợp chất này như trong ví dụ phối chế 5 với cùng lượng nước như trong phần được xử lý được sử dụng.

Ví dụ thử nghiệm 6

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, bấp cải (giai đoạn ba lá) được trồng trong cốc polyetylen được phun 20mL/cốc mỗi dung dịch thử nghiệm. Sau khi dung dịch thử nghiệm được làm khô, phần trên không được cắt bỏ và sau đó đặt trong cốc 50mL. Năm (5) ấu trùng hình sao thứ hai của sâu tơ hại bắp cải (*Plutella xylostella*) được thả vào cốc và cốc được đậy kín bằng nắp. Sau đó cốc được giữ ở 25°C trong thời gian 5 ngày, số côn trùng sống sót được tính. Tỷ lệ chết được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63 và 1-76, tỷ lệ chết là 80% hoặc cao

hơn.

Ví dụ thử nghiệm 7

Mỗi dung dịch phun thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây táo con được trồng trong cốc nhựa và lớn lên cho đến khi bảy mươi tám lá được đặt. Cây táo được phun 20mL/cốc mỗi dung dịch thử nghiệm. Sau khi dung dịch thử nghiệm được làm khô, 60 ấu trùng *Adoxophyes orana fasciata* thứ nhất được thả và cốc được đậy bằng cốc nhựa đặt lộn ngược đáy của nó được cắt bỏ và giấy lọc được đặt trên đó. Sau 7 ngày, số côn trùng sống sót được tính. Tỷ lệ chết được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-63 và 1-76, tỷ lệ chết là 90% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 8

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-63 và 1-95 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Giấy lọc có đường kính 5,5cm được đặt lên đáy cốc polyetylen có đường kính 5,5cm và mỗi dung dịch thử nghiệm (0,7ml) được bổ sung nhỏ giọt vào giấy lọc. Khi sucroza dạng bả (30mg) được đặt đồng nhất trên giấy lọc. 10 thành trùng cái của ruồi *Musca domestica* được thả vào cốc polyetylen và cốc được đậy kín bằng nắp. Sau 24 giờ, số lượng ruồi *Musca domestica* sống sót được xem xét và tỷ lệ chết của sinh vật gây hại được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong khi xử lý bằng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-4, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-63 và 1-95, tỷ lệ chết là 100%.

Ví dụ thử nghiệm 9

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-9 và 1-19 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Giấy lọc có đường kính là 5,5cm được đặt ở đáy cốc polyetylen có

đường kính là 5,5cm và mỗi dung dịch thử nghiệm (0,7ml) được bổ sung nhỏ giọt lên giấy lọc. Sucroza (30mg) là bã được làm đồng nhất được đặt trên giấy lọc, 2 thành trùng đực của gián Đức *Blattalla germanica* được thả và cốc được đậy kín bằng nắp. Sau 6 giờ, số gián Đức *Blattalla germanica* sống sót được xem xét và tỷ lệ chết của sinh vật gây hại được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong khi xử lý với mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-9 và 1-19, tỷ lệ chết là 100%.

Ví dụ thử nghiệm 10

Mỗi dung dịch thử nghiệm được điều chế bằng cách pha loãng chế phẩm chứa hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-61, 1-63 và 1-76 như thu được trong ví dụ phối chế 5, với nước để thu được 500 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Bổ sung mỗi dung dịch thử nghiệm (0,7ml) được bổ sung vào nước trao đổi ion (100ml) nồng độ thành phần hoạt tính: 3,5 ppm). 20 ấu trùng hình sao cuối cùng của muỗi *Culex pipiens pallens* được thả vào dung dịch. Một ngày sau, số muỗi *Culex pipiens pallens* sống sót được xem xét và tỷ lệ chết của sinh vật gây hại được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong khi xử lý bằng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-18, 1-19, 1-20, 1-29, 1-46, 1-48, 1-49, 1-50, 1-61, 1-63 và 1-76, tỷ lệ chết là 95% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 11

Mỗi 2mg của các hợp chất này được cho vào ống vít (Maruemu® No. 5; 27 x 55 mm). Bổ sung axeton (0,2ml) vào hỗn hợp và đậy kín bằng nắp. Sau khi hòa tan hợp chất trong axeton, ống vít được quay và đảo ngược thành dung dịch đồng nhất lên toàn bộ thành trong của ống. Sau khi tháo nắp, dung dịch được làm khô bằng không khí trong khoảng 2 giờ. Sau đó, nhộng ve không hút máu người *Haemaphysalis longicornis* (5 con ve một nhóm) được thả vào ống và ống được đậy kín bằng nắp. Sau 2 ngày, số ve chết được tính và tỷ lệ chết được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = (\text{Số ve chết} / \text{Số ve thử nghiệm}) \times 100$$

Kết quả là, trong việc xử lý với mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất này, tỷ lệ chết là 100%.

Ví dụ thử nghiệm 12

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-6, 1-8, 1-9 và 1-10 (10mg) được

hòa tan trong dung dịch trộn (0,1ml) gồm xylen, DMF và Sorpol® 3005X (do Toho Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) theo tỷ lệ 4: 4: 1 thu được chế phẩm. Mỗi chế phẩm được pha loãng bằng nước để thu được 50 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây mạ (giai đoạn 2,5 lá) được trồng trong cốc polyetylen được phun 10ml mỗi dung dịch thử nghiệm. Sau khi làm khô bằng không khí cây, 10 phần ba ấu trùng hình sao của rệp mềm rầy nâu nhỏ (*Laodelphax striatella*) được thả và giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C. Sau 5 ngày, số côn trùng sống sót được tính. Tỷ lệ chết được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = \{10 - (\text{Số côn trùng sống sót sau 5 ngày})/10\} \times 100$$

Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-6, 1-8, 1-9 và 1-10, giá trị diệt trừ là 100%.

Ví dụ thử nghiệm 13

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất 1-6, 1-8, 1-9 và 1-10 (10mg) được hòa tan trong dung dịch trộn (0,1ml) gồm xylen, DMF và Sorpol® 3005X (do Toho Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) theo tỷ lệ 4: 4: 1 thu được chế phẩm. Mỗi chế phẩm được pha loãng bằng nước để thu được 50 ppm chất cô của thành phần hoạt tính.

Mặt khác, cây mạ (giai đoạn 2,5 lá) được trồng trong cốc polyetylen được phun 10ml mỗi dung dịch thử nghiệm. Sau khi làm khô bằng không khí cây mạ, 10 phần ba ấu trùng hình sao của rầy lưng trắng hại lúa *Sogatella furcifera* được thả và giữ trong nhà kính ở nhiệt độ 25°C. Sau 5 ngày, số côn trùng sống sót được tính. Tỷ lệ chết được tính theo biểu thức sau đây:

$$\text{Tỷ lệ chết (\%)} = \{10 - (\text{Số côn trùng sống sót sau 5 ngày})/10\} \times 100$$

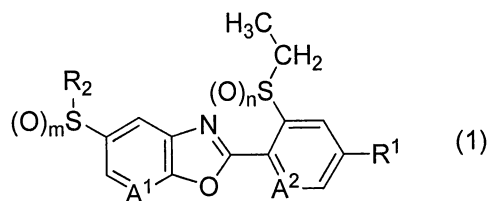
Kết quả là, trong phần được xử lý sử dụng mỗi dung dịch thử nghiệm chứa mỗi một trong số các hợp chất 1-6, 1-8, 1-9 và 1-10, giá trị diệt trừ là 100%.

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Hợp chất này có tác dụng diệt trừ sinh vật gây hại và do vậy hữu ích làm thành phần hoạt tính của tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức (1):



trong đó:

A^1 là $N(O)_p$ hoặc CH,

A^2 là $N(O)_q$,

R^1 là nhóm triflometyl, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro,

R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl,

p là 0 hoặc 1,

q là 0 hoặc 1,

n là 0, 1 hoặc 2,

m là 0, 1 hoặc 2,

với điều kiện là khi A^1 là NO và/hoặc A^2 là NO, n là 2 và m là 2.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó A^1 là CH.

3. Hợp chất theo điểm 1, trong đó A^1 là N.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^1 là nguyên tử hydro.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^1 là nhóm triflometyl.

6. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, trong đó R^2 là nhóm triflometyl.

7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6, trong đó p là 0 và q là 0.

8. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 và chất mang trợ.

9. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo điểm 8, trong đó chất mang trợ là nước và hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 được phân tán trong nước chứa chất hoạt động bề mặt.

10. Phương pháp diệt trừ sinh vật gây hại, trong đó phương pháp này bao gồm

bước phun một lượng hữu hiệu hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7.

11. Phương pháp theo điểm 10, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun một lượng hữu hiệu hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 lên cuống và lá của cây hoặc đất nơi cây phát triển.

12. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo điểm 8, trong đó chất mang trợ là chất mang ăn.

13. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo điểm 8, trong đó chất mang trợ là dung môi và khí đẩy.

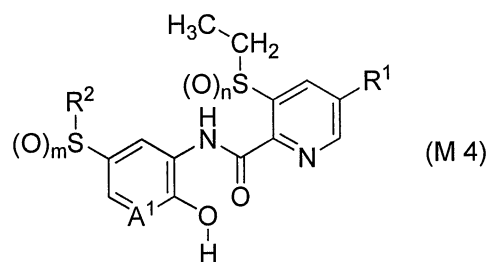
14. Phương pháp theo điểm 10, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo điểm 13 lên sinh vật gây hại và/hoặc chỗ sinh vật gây hại trú ngụ.

15. Tác nhân diệt trừ sinh vật gây hại theo điểm 8, trong đó chất mang trợ là tác nhân tạo khí.

16. Phương pháp theo điểm 10, trong đó phương pháp này bao gồm bước phun hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 lên bề mặt thân của động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại.

17. Phương pháp theo điểm 10, trong đó phương pháp này bao gồm bước cho động vật ký sinh bởi sinh vật gây hại dùng qua đường miệng hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7.

18. Hợp chất có công thức (M4):



trong đó:

A^1 là N hoặc CH,

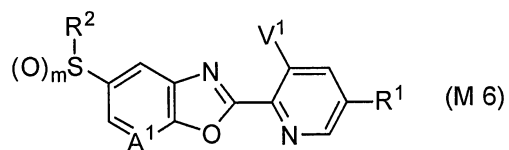
R^1 là nhóm triflometyl, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro,

R^2 là nhóm C1-C3 perfloalkyl,

n là 0, 1 hoặc 2,

m là 0, 1 hoặc 2.

19. Hợp chất có công thức (M6):



trong đó:

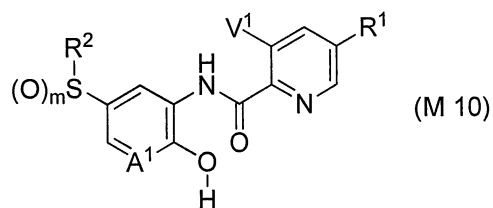
A¹ là N hoặc CH,

V¹ là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

R² là nhóm C1-C3 perfluoralkyl,

m là 0, 1 hoặc 2.

20. Hợp chất có công thức (M10):



trong đó:

A¹ là N hoặc CH,

V¹ là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

R² là nhóm C1-C3 perfluoralkyl,

m là 0, 1 hoặc 2.