



(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)



1-0027698

(51)⁷ A01N 43/52; A01P 7/04; A01N 43/90; (13) B
A01N 43/76; A01N 43/78

(21) 1-2017-00393

(22) 24/06/2015

(86) PCT/JP2015/068168 24/06/2015

(87) WO 2016/002595 A1 07/01/2016

(30) 2014-138434 04/07/2014 JP; 2014-162206 08/08/2014 JP; 2014-194870 25/09/2014 JP

(45) 25/03/2021 396

(43) 25/04/2017 349A

(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)

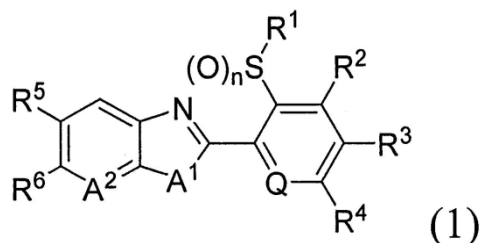
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 Japan

(72) NISHIMURA, Shinya (JP); AKAYAMA, Atsuo (JP); KAMEZAKI, Masashi (JP).

(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) CHẾ PHẨM PHÒNG TRỪ CÁC SINH VẬT GÂY HẠI VÀ PHƯƠNG PHÁP
PHÒNG TRỪ CÁC SINH VẬT GÂY HẠI

(57) Sáng chế đề cập đến chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1):



(trong đó các ký hiệu như được xác định trong bản mô tả), và muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin có hiệu quả phòng trừ đặc hiệu đối với các sinh vật gây hại. Chế phẩm phòng trừ sinh vật gây hại có hiệu quả phòng trừ hữu hiệu đối với các sinh vật gây hại. Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại, và hạt giống hoặc củ của cây trồng được bám dính chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập tới chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại và phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Cho đến nay, nhiều hợp chất đã được biết đến là hoạt chất dùng cho chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại (xem các tài liệu sáng chế 1 đến 3, và tài liệu phi sáng chế 1).

Danh sách tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: Công bố đơn quốc tế số WO 2013/018928

Tài liệu sáng chế 2: Công bố đơn quốc tế số WO 2012/092115

Tài liệu sáng chế 3: Công bố đơn quốc tế số WO 2014/104407

Tài liệu phi sáng chế

Tài liệu phi sáng chế 1: THE Pesticide Manual - 16th edition được xuất bản bởi BCPC, ISBN 9781901396867

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề cần được giải quyết bởi sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề xuất chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại có hiệu quả phòng trừ tuyệt vời đối với các sinh vật gây hại.

Cách thức giải quyết vấn đề

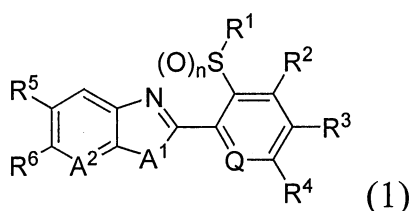
Các tác giả sáng chế đã nghiên cứu sâu rộng để phát hiện ra chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại có hiệu quả phòng trừ tuyệt vời đối với các sinh

vật gây hại. Kết quả là, họ đã phát hiện ra rằng chế phẩm chứa hợp chất được thể hiện bằng công thức (1) được nêu dưới đây, và

muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin (dưới đây, được gọi là "Triflumezopyrim") có hiệu quả phòng trừ tuyệt vời đối với các sinh vật gây hại.

Sáng chế đề xuất các phương án dưới đây.

[1] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1):



trong đó,

A¹ là -NR⁷-, nguyên tử oxy, hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

$$A^2 \text{ là } =N-, =N(\rightarrow O)-, \text{ hoặc } =CR^8-,$$

Q là =N- hoặc =N($\rightarrow$ O)-,

R¹ là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ Nhóm X,

R^2 , R^3 và R^4 là giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}CO_2R^{11}$, $-NR^{10}C(O)R^{11}$, $-CO_2R^{10}$, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)NR^{10}R^{11}$, $-SF_5$, nhóm xyno, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro,

R⁵ và R⁶ giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X, -OR¹⁰,

$-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{10}\text{CO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{10}$, $-\text{SF}_5$, nhóm xyano, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro (với điều kiện là R^5 và R^6 không đồng thời là nguyên tử hydro),

R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm W, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{10}$, nhóm C3-C6 xycloalkyl, hoặc nguyên tử hydro,

R^8 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-\text{OR}^{10}$, $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, nhóm xyano, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro,

R^{10} và R^{11} giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X, hoặc nguyên tử hydro (với điều kiện là trong $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, khi m là 1 hoặc 2, R^{10} không phải là nguyên tử hydro),

m độc lập với nhau là 0, 1 hoặc 2, và

n là 0, 1 hoặc 2,

nhóm X: nhóm bao gồm nhóm C1-C6 alkoxy tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc một hoặc nhiều nhóm C1-C3 alkyl, nhóm xyano, nhóm hydroxy, và nguyên tử halogen,

nhóm W: nhóm C1-C6 alkoxy tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm hydroxy, nguyên tử halogen, hoặc nhóm xyano], và

muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin (triflumezopyrim) (dưới đây, được gọi là "chế phẩm của sáng chế").

[2] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục [1], trong đó A^1 là -NMe-, nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh, A^2 là =N-, =N($\rightarrow$ O)-, hoặc =CH-, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 và R^4 là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, -OR¹⁰, hoặc -S(O)_mR¹⁰, R^6 là -NR¹⁰R¹¹ hoặc nguyên tử hydro, và R¹⁰ và R¹¹ độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen.

[3] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục [1] hoặc [2] trong đó A^1 là -NMe-.

[4] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục [1] hoặc [2] trong đó A^1 là nguyên tử oxy.

[5] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [4] trong đó tỷ lệ của hợp chất có công thức (1) so với muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin là nằm trong khoảng từ 100:1 đến 1:100 theo trọng lượng.

[6] Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [4] trong đó tỷ lệ của hợp chất có công thức (1) so với muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin là nằm trong khoảng từ 10:1 đến 1:10 theo trọng lượng.

[7] Phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại bao gồm bước phun lượng có hiệu quả của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] lên sinh vật gây hại hoặc chỗ cư trú nơi sinh vật gây hại sống.

[8] Phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại bao gồm bước phun lượng có hiệu quả của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] lên cây trồng, hạt giống cây trồng, củ, hoặc

đất để trồng cây trồng.

[9] Hạt giống hoặc củ của cây trồng được bám dính một lượng có hiệu quả của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được nêu trong mục bất kỳ trong số các mục [1] đến [6].

Hiệu quả của sáng chế

Sáng chế có thể phòng trừ các sinh vật gây hại.

Mô tả chi tiết sáng chế

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại của sáng chế chứa hợp chất có công thức (1) được nêu ở trên (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế") và triflumezopyrim.

Các nhóm như đã nêu được giải thích dưới đây.

Thuật ngữ "nhóm Ca-Cb alkyl" như được sử dụng ở đây là nhóm hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh có "a" đến "b" nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ "nhóm Ca-Cb haloalkyl" là nhóm hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh có "a" đến "b" nguyên tử cacbon, trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro gắn vào nguyên tử cacbon được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen. Khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Thuật ngữ "nhóm Ca-Cb alkoxy" là nhóm alkyl-O- mạch thẳng hoặc mạch nhánh có "a" đến "b" nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ "nhóm Ca-Cb xycloalkyl" là nhóm hydrocacbon vòng bão hòa có "a" đến "b" nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ "tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X" như được sử dụng ở đây là khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm, các nguyên tử hoặc các nhóm được lựa chọn từ nhóm X có thể

giống nhau hoặc khác nhau.

Thuật ngữ "tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm W" như được sử dụng ở đây là khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X, các nguyên tử hoặc các nhóm có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Thuật ngữ "tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen" như được sử dụng ở đây là khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Trong hợp chất theo sáng chế, thuật ngữ "các nguyên tử halogen" như được sử dụng ở đây là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, và nguyên tử iot.

Trong hợp chất theo sáng chế, thuật ngữ "nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X" là nhóm hydrocacbon bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 6 nguyên tử cacbon, trong đó các nguyên tử hydro gắn vào các nguyên tử cacbon có thể tùy ý được thay thế bằng các nguyên tử hoặc các nhóm được lựa chọn từ nhóm X. Khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm, các nguyên tử hoặc các nhóm được lựa chọn từ nhóm X có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các ví dụ về "nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X" bao gồm nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X gồm nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm isopropyl, nhóm butyl, nhóm isobutyl, nhóm *sec*-butyl, nhóm *tert*-butyl, nhóm pentyl, nhóm neopentyl, nhóm hexyl, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm propyloxymetyl, nhóm isopropyloxymetyl, nhóm butyloxymetyl, nhóm *sec*-butyloxymetyl, nhóm *tert*-butyloxymetyl, nhóm 2-metoxyetyl, nhóm 2-etoxetyl, nhóm 2-propyloxyetyl, nhóm 2-isopropyloxyetyl, nhóm 2-butyloxyetyl, nhóm 2-*sec*-butyloxyetyl, nhóm 2-*tert*-butyloxyetyl, nhóm

triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm 2-floetyl, nhóm 2,2-difloetyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl và nhóm pentaflloetyl, nhóm 2-hydroxyetyl, nhóm xyclopropylmetyl, nhóm 1-metylxcyclopropylmetyl, nhóm 2,2-difloxycyclopropylmetyl, nhóm trimetoxymetyl, nhóm trietoxymetyl và các nhóm khác, mà được lựa chọn phụ thuộc vào số lượng các nguyên tử cacbon được biểu thị.

Trong hợp chất theo sáng chế, thuật ngữ "nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen" là nhóm hydrocacbon bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 6 nguyên tử cacbon trong đó các nguyên tử hydro gắn vào các nguyên tử cacbon có thể tùy ý được thay thế bằng các nguyên tử halogen, và khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các ví dụ về "nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen" bao gồm nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen được lựa chọn từ nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm isopropyl, nhóm butyl, nhóm isobutyl, nhóm *sec*-butyl, nhóm *tert*-butyl, nhóm pentyl, nhóm neopentyl, nhóm hexyl, nhóm triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm 2-floetyl, nhóm 2,2-difloetyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl, và nhóm pentaflloetyl, hoặc nhóm heptaflloisopropyl v.v., mà được lựa chọn phụ thuộc vào số lượng nguyên tử cacbon được biểu thị.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm W" bao gồm nhóm C2-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm W gồm có nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm isopropyl, nhóm butyl, nhóm isobutyl, nhóm *sec*-butyl, nhóm *tert*-butyl, nhóm pentyl, nhóm neopentyl, nhóm hexyl, nhóm triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm 2-floetyl, nhóm 2,2-difloetyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl, nhóm pentaflloetyl, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm propyloxymetyl, nhóm

isopropyloxymetyl, nhóm butyloxymetyl, nhóm *sec*-butyloxymetyl, nhóm isobutyloxymetyl, nhóm *tert*-butyloxymetyl, nhóm metoxyetyl, nhóm etoxyetyl, nhóm propyloxyetyl, nhóm isopropyloxyetyl, nhóm butyloxyetyl, nhóm *sec*-butyloxyetyl, nhóm isobutyloxyetyl, nhóm *tert*-butyloxyetyl và các nhóm khác. Khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm W, các nguyên tử hoặc các nhóm được lựa chọn từ nhóm W có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C1-C6 alkoxy tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen" bao gồm nhóm metoxy, nhóm triflometoxy, nhóm etoxy, nhóm 2,2,2-trifloetoxi, nhóm propyloxy, nhóm isopropyloxy, nhóm butyloxy, nhóm isobutyloxy, nhóm *sec*-butyloxy, nhóm *tert*-butyloxy, nhóm pentyloxy, và nhóm hexyloxy.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen" bao gồm nhóm xyclopropyl, nhóm 2,2-difloxypropyl, nhóm 2,2-dicloxypropyl, nhóm 2,2-dibromoxycyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, và nhóm xyclohexyl.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc một hoặc nhiều nhóm C1-C3 alkyl" bao gồm nhóm xyclopropyl, nhóm 1-metylxcyclopropyl, nhóm 2-metylxcyclopropyl, nhóm 1-floxypropyl, nhóm 2,2-difloxypropyl, nhóm 2,2-dicloxypropyl, nhóm 2,2-dibromoxycyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, và nhóm xyclohexyl.

Trong hợp chất theo sáng chế, thuật ngữ "nhóm C1-C3 haloalkyl" là nhóm hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 3 nguyên tử cacbon trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro gắn vào các nguyên tử cacbon được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen, và khi có mặt hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các ví dụ về "nhóm C1-C3 haloalkyl " bao gồm nhóm flometyl, nhóm clometyl, nhóm bromometyl, nhóm iodometyl, nhóm diflometyl, nhóm diclometyl, nhóm triflometyl, nhóm clodiflometyl, nhóm bromodiflometyl, nhóm triclometyl, nhóm 2-floetyl, nhóm 2-cloetyl, nhóm 2-bromoetyl, nhóm 2,2-difloetyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl, nhóm pentafoetyl, nhóm heptaflopropyl, nhóm heptafloisopropyl và các nhóm khác.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C1-C3 alkyl" bao gồm nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, và nhóm isopropyl.

Trong hợp chất theo sáng chế, các ví dụ về "nhóm C1-C3 perfloalkyl" bao gồm nhóm triflometyl, nhóm pentafoetyl, nhóm heptaflopropyl, và nhóm heptafloisopropyl.

Trong một phương án, các ví dụ về hợp chất theo sáng chế bao gồm các hợp chất có công thức (1) như được liệt kê trong Bảng 1 đến Bảng 20 dưới đây.

Bảng 1

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
1	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
2	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
3	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
4	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
5	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
6	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
7	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
8	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
9	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	0	N
10	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	0	N
11	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	2	N
12	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	2	N
13	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
14	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
15	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
16	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
17	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
18	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
19	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
20	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
21	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	0	N
22*	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N(→O)	2	N
23	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
24	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	2	N
25	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 2

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
26	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
27	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
28	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
29	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
30	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
31	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
32	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
33	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
34	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
35	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
36*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N($\rightarrow$ O)
37*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N($\rightarrow$ O)	2	N
38	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
39	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
40	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
41	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	0	N
42	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	0	N
43	Et	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	N	0	N
44	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
45	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	0	N
46	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
47*	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N($\rightarrow$ O)
48*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N($\rightarrow$ O)	2	N
49	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	0	N
50	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	2	N

Bảng 3

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
51*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N(→O)
52	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
53	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
54	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
55	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
56	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	2	N
57	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
58	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
59	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	0	N
60	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
61	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	0	N
62	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	1	N
63	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	2	N
64	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
65	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
66	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
67	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	2	N
68	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	2	N
69	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	2	N
70*	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N(→O)	2	N
71	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
72	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
73	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
74	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
75	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N

Bảng 4

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
76	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
77	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
78	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
79	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
80	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	0	N
81	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	2	N
82	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	0	N
83	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	2	N
84	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
85	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
86	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
87	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
88	Et	H	H	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
89	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
90	Et	H	H	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
91	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
92	Et	H	H	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
93	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
94	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
95	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
96	Et	H	H	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
97	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
98	Et	H	H	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
99	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
100	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 5

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
101	CH ₂ CycPr	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
102	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
103	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
104	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
105	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
106	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
107	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
108	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	2	N
109	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
110	Et	H	SCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
111	Et	H	S(O)CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
112	Et	H	S(O) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
113	Et	H	CF(CF ₃) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
114	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
115	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
116	Et	H	I	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
117	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
118	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
119	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
120	Et	H	CF ₃	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
121	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	N	2	N
122	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
123	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
124	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
125	Et	H	CF ₃	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 6

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
126	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
127	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
128	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
129	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
130	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
131	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
132	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
133	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
134	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
135	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
136	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
137	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
138	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
139	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
140	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N
141	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N
142	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
143	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
144	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
145	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
146	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
147	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
148	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
149	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
150	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 7

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
151	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
152	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
153	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
154	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
155	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
156	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	0	N
157	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	1	N
158	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
159	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	0	N
160	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	1	N
161	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N
162	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	0	N
163	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	1	N
164	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	2	N
165	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	0	N
166	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	1	N
167	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	2	N
168	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	0	N
169	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	1	N
170	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
171	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	0	N
172	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	0	N
173	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	1	N
174	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	2	N
175	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N

Bảng 8

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
176	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
177	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
178	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	1	N
179	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	2	N
180	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	0	N
181	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	1	N
182	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	2	N
183	Et	H	H	H	CHO	H	NMe	N	0	N
184	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	0	N
185	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	1	N
186	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	2	N
187	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
188	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	0	N
189	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	1	N
190	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	2	N
191	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
192	Me	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
193	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	1	N
194	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	1	N
195	Me	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
196	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	1	N
197	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
198	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
199	Et	H	H	H	COCF ₃	H	NMe	N	0	N
200	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	0	N

Bảng 9

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
201	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	1	N
202	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	2	N
203	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
204	Et	H	H	SEt	CF ₃	H	NMe	N	0	N
205	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	0	N
206	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	0	N
207	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Et	N	0	N
208	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₂ OMe	N	0	N
209	Et	H	H	H	CF ₃	H	NBu	N	0	N
210	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	0	N
211	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
212	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	N	0	N
213	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
214	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
215	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
216	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
217	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
218	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
219	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
220	Et	H	OH	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
221	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	0	N
222	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	N	1	N
223	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	N	2	N
224	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
225	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N

Bảng 10

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
226	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
227	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
228	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
229	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
230	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
231	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	0	N
232	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	1	N
233	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	0	N
234	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	1	N
235	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	2	N
236	Et	H	H	H	SH	H	NMe	N	0	N
237	Et	H	H	H	Et	H	NMe	N	0	N
238	Et	H	H	H	iPr	H	NMe	N	0	N
239	Et	H	H	H	NHEt	H	NMe	N	0	N
240	Et	H	H	H	NEt ₂	H	NMe	N	0	N
241	Et	H	H	H	tBu	H	NMe	N	0	N
242	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	0	N
243	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
244	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
245	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
246	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	1	N
247	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	2	N
248	Et	H	H	H	NMe ₂	H	NMe	N	0	N
249	Et	H	H	H	NHCOMe	H	NMe	N	0	N
250	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N

Bảng 11

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
251	Et	H	H	H	NMeCOMe	H	NMe	N	0	N
252	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	1	N
253	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
254	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	0	N
255	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	1	N
256	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	2	N
257	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	1	N
258	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
259	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
260	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
261	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
262	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
263	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
264	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
265	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	0	N
266	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	1	N
267	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	2	N
268	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
269	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
270	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
271	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
272	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
273	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
274	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
275	Et	H	H	H	SMe	H	NMe	N	0	N

Bảng 12

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
276	Et	H	H	H	S(O) ₂ Me	H	NMe	N	2	N
277	Et	H	H	H	SEt	H	NMe	N	0	N
278	Et	H	H	H	S(O) ₂ Et	H	NMe	N	2	N
279	Et	H	H	H	S(O) ₂ iPr	H	NMe	N	2	N
280	Et	H	H	H	SCH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
281	Et	H	H	H	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
282	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
283	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
284	Et	H	H	H	SCF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
285	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
286	Et	H	H	H	CH(Cl)CF ₃	H	NMe	N	0	N
287	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	0	N
288	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	2	N
289	Et	H	H	H	OCF ₂ Br	H	NMe	N	2	N
290	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	N	2	N
291	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
292	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
293	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
294	Et	H	H	H	StBu	H	NMe	N	0	N
295	Et	H	H	H	S(O) ₂ tBu	H	NMe	N	2	N
296	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	0	N
297	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	1	N
298	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	2	N
299	Et	H	I	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
300	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N

Bảng 13

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
301	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
302	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
303	Et	H	I	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
304	Et	H	I	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
305	Et	H	Br	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
306	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	0	N
307	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	2	N
308	Et	H	H	H	C(OH)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
309	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
310	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	1	N
311	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
312	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
313	Et	H	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	NMe	CH	0	N
314	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	0	N
315	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	2	N
316	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
317	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
318	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
319	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
320	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
321	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
322	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
323	Et	H	H	H	I	H	S	N	0	N
324	Et	H	CF ₃	H	I	H	S	N	0	N
325	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N

Bảng 14

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
326	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N
327	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
328	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
329	Et	H	Et	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
330	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	1	N
331	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	2	N
332	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N
333	Et	H	Br	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
334	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
335	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N
336	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
337	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
338	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
339	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
340	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NH	CH	0	N
341	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
342	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
343	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
344	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
345	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	1	N
346	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	0	N
347	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
348	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CN	N	2	N
349	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
350	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N

Bảng 15

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
351	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₃ CH ₃	N	2	N
352	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	2	N
353	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	2	N
354	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ Me	N	2	N
355	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCOMe	N	2	N
356	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
357	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
358	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
359	Et	H	NH ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
360	Et	H	NHCOCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
361	Et	H	iPr	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
362	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
363	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
364	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
365	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
366	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
367	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
368	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
369	Et	H	CF ₂ H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
370	Et	H	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
371	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
372	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
373	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
374	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
375	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 16

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
376	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
377	Et	H	CH ₂ F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
378	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	0	N
379	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	2	N
380	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
381	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
382	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
383	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	0	N
384	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	1	N
385	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	0	N
386	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	1	N
387	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
388	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
389	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N
390	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	0	N
391	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
392	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
393	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
394	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
395	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
396	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	0	N
397	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	2	N
398	Et	H	H	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
399	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
400*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)

Bảng 17

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
401*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
402	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	0	N
403	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₃	0	N
404	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₃	2	N
405	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSA(O) ₂ CH ₂ CF ₃	2	N
406	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	0	N
407	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CO OH	NMe	N	2	N
408	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CO NH ₂	NMe	N	2	N
409*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
410*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
411	Et	H	CF ₃	H	COOH	H	NMe	N	0	N
412	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	1	N
413	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CCF ₃	0	N
414	Et	H	C(OCH ₃) ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
415	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	0	N
416	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	2	N
417	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	2	N
418	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
419	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
420	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
421	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
422	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
423	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
424	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
425	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

Bảng 18

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
426	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
427	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
428	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
429	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
430	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
431	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
432	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
433	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
434	Et	H	CF ₃	H	CN	H	NMe	N	0	N
435	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	0	N
436	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
437	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
438	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	2	N
439	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	N	2	N
440	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
441	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	0	N
442	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	1	N
443	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	2	N
444	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	2	N
445	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
446	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
447	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
448	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	2	N
449	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	N	2	N
450	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N

Bảng 19

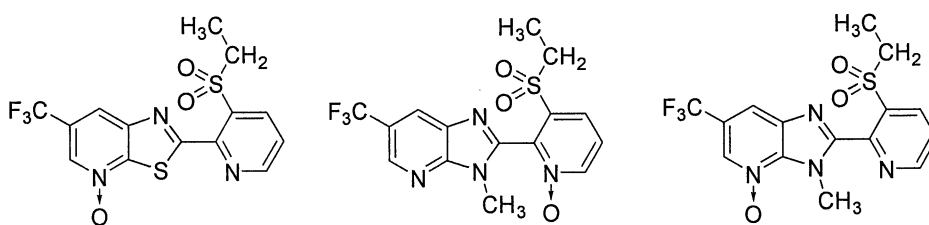
Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
451	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	0	N
452	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	1	N
453	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	2	N
454	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	2	N
455	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
456*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N($\rightarrow$ O)	2	N
457*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N($\rightarrow$ O)	2	N
458*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N($\rightarrow$ O)
459*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N($\rightarrow$ O)
460*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N($\rightarrow$ O)
461*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N($\rightarrow$ O)
462	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
463	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	1	N
464	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
465	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
466	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	1	N
467	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
468	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
469	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	1	N
470	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
471	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
472	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	1	N
473	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
474	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	N	0	N
475	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	0	N

Bảng 20

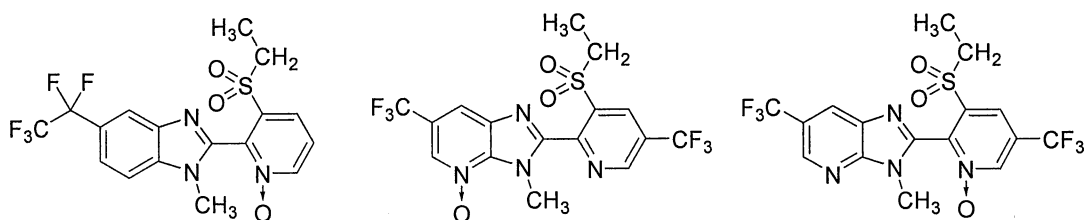
Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
476	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	0	N
477	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
478	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	N	0	N
479	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
480	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	0	N
481	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N

Ở đây, ký hiệu "*" trong các hợp chất theo sáng chế như được liệt kê trong Bảng 1 đến Bảng 20 được nêu ở trên là N-oxit. Các ví dụ cụ thể về chúng bao gồm dưới đây.

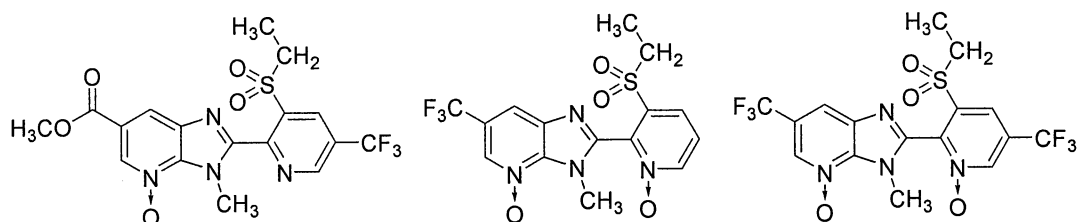
Hợp chất theo sáng chế 22 Hợp chất theo sáng chế 36 Hợp chất theo sáng chế 37



Hợp chất theo sáng chế 47 Hợp chất theo sáng chế 48 Hợp chất theo sáng chế 51

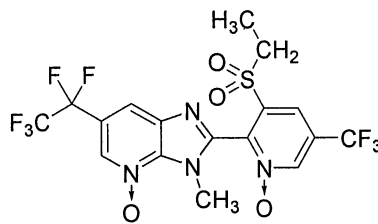
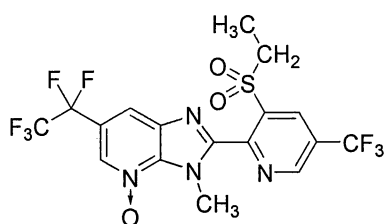


Hợp chất theo sáng chế 70 Hợp chất theo sáng chế 400 Hợp chất theo sáng chế 401



Hợp chất theo sáng chế 409

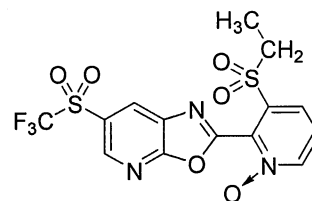
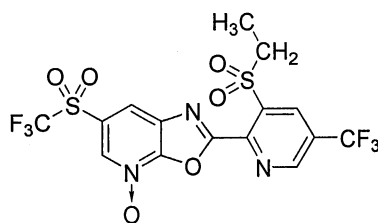
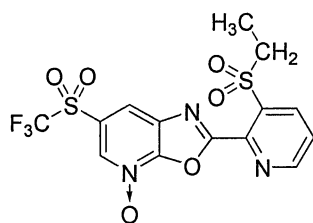
Hợp chất theo sáng chế 410



Hợp chất theo sáng chế 456

Hợp chất theo sáng chế 457

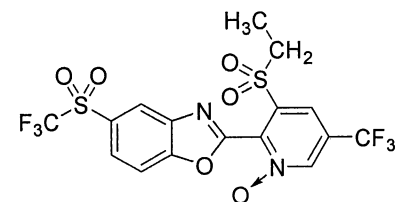
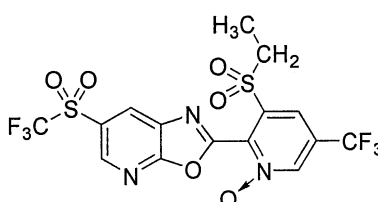
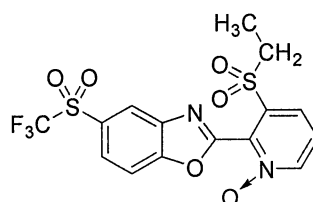
Hợp chất theo sáng chế 458



Hợp chất theo sáng chế 459

Hợp chất theo sáng chế 460

Hợp chất theo sáng chế 461



Trong Bảng 1 đến Bảng 20 nêu trên, Me là nhóm metyl, Et là nhóm etyl, Pr là nhóm propyl, Bu là nhóm butyl, tBu là tertiary nhóm butyl, iPr là nhóm isopropyl, CycPr là nhóm xyclopropyl, và CycBu là nhóm xyclobutyl.

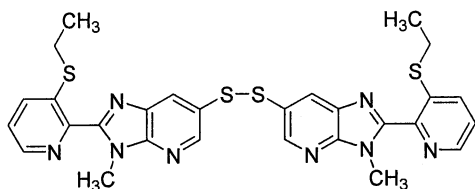
Các hợp chất này có thể được điều chế theo phương pháp được mô tả trong công bố đơn quốc tế số WO 2013/018928, hoặc công bố đơn quốc tế số WO 2014/104407. Đối với một số hợp chất trong số chúng, các phương pháp điều chế các hợp chất đó được mô tả dưới đây.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ điều chế 1(1)

Hỗn hợp của 1,1g 2-(3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-6-iodo-3-metyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin, 160mg đồng (1) iotua, 2,7g natri sulfat 9 hydrat, và

10mL N,N-dimetylformamit (dưới đây, được gọi là DMF) được khuấy ở 110°C trong 5 giờ. Nước được bổ sung vào các hỗn hợp phản ứng, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được làm khô trên natri sulfat và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 710mg hợp chất được thể hiện bởi công thức dưới đây:

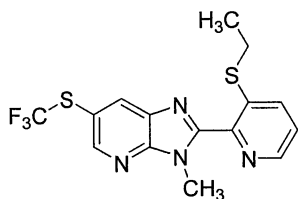


(dưới đây, được gọi là hợp chất (1-1)).

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 8,56-8,55 (2H, m), 8,53-8,50 (2H, m), 8,38-8,36 (2H, m), 8,04 (2H, d), 7,61-7,56 (2H, m), 3,87 (6H, brs), 3,00 (4H, q), 1,23-1,16 (6H, m).

Ví dụ điều chế 1(2)

Hỗn hợp của 710mg hợp chất (1-1) và 12mL DMF được làm lạnh tới -60°C, và 10g trifloiodometan được bổ sung vào đó. Bổ sung 1,2mL tetrakis(dimethylamino)etylen theo từng giọt vào các hỗn hợp ở -40°C. Các hỗn hợp nâng nhiệt độ lên đến -10°C và được khuấy ở -10°C trong 5 giờ. Bổ sung nước vào các hỗn hợp phản ứng, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được làm khô trên natri sulfat và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 530mg 2-(3-ethylsulfanylpyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometylsulfanyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 13").

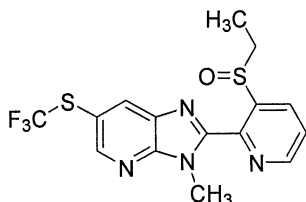


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8,67 (1H, d), 8,52 (1H, dd), 8,46 (1H, d), 7,79 (1H, dd),

7,39 (1H, dd), 4,03 (3H, s), 2,97 (2H, q), 1,36 (3H, t).

Ví dụ điều chế 2

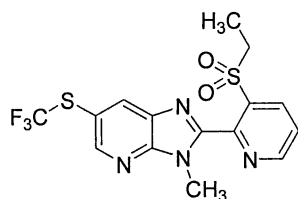
Hỗn hợp của 200mg hợp chất theo sáng chế 13, 230mg axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết 65% hoặc cao hơn), và 10mL cloroform được khuấy ở điều kiện làm mát bằng nước đá trong 5 giờ. Bổ sung dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa vào các hỗn hợp phản ứng và các hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Các lớp hữu cơ được làm khô trên natri sulfat và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 89mg 2-(3-ethylsulfanyl-pyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometylsulfanyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 14") và 130mg 2-(3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometylsulfanyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 15").



Hợp chất theo sáng chế 14

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8,87-8,83 (1H, m), 8,73-8,64 (2H, m), 8,41 (1H, d), 7,72-7,66 (1H, m), 4,34 (3H, s), 3,72-3,62 (1H, m), 3,17-3,05 (1H, m), 1,47 (3H, t).

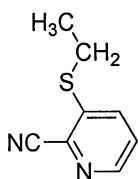
Hợp chất theo sáng chế 15



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9,01-8,98 (1H, m), 8,71 (1H, d), 8,55-8,52 (1H, m), 8,39 (1H, d), 7,72 (1H, dd), 3,90-3,81 (5H, m), 1,36 (3H, t).

Ví dụ điều chế 3(1)

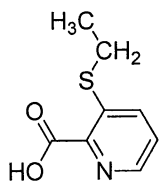
Bổ sung 0,52g natri hydrua (60%, các nguyên liệu dầu) vào hỗn hợp của 1,39g 3-clo-2-xyanopyridin, 0,9mL etyl mercaptan và 10mL DMF ở điều kiện làm mát bằng nước đá, và các hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 1 giờ. Nước được bổ sung vào các hỗn hợp phản ứng, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa và nước muối bão hòa, và các hỗn hợp được làm khô trên natri sulfat khan và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại thu được được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 1,52g 2-xyano-3-etylsulfanylpýridin.



$^1\text{H-NMR}$ (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 3(2)

Bổ sung 1,4g 2-xyano-3-etylsulfanylpýridin vào hỗn hợp của 15mL axit sulfuric đậm đặc và 5mL nước, và các hỗn hợp được khuấy ở 130°C trong 2 giờ. Các hỗn hợp phản ứng được cho làm mát tới nhiệt độ trong phòng, và dung dịch nước kali hydroxit được bổ sung vào đó, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Bổ sung axit clohydric đậm đặc vào các lớp nước thu được, và các hỗn hợp được chiết bằng cloroform và được làm khô trên natri sulfat khan, và sau đó được cô dưới áp suất giảm để tạo ra 1,15g axit 3-etylsulfanylpicolinic.

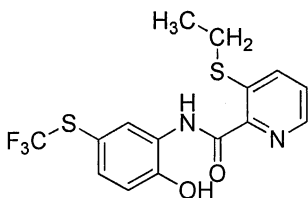


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8,31 (1H, d), 7,75 (1H, d), 7,49 (1H, dd), 2,97 (2H, q), 1,44 (3H, t).

Ví dụ điều chế 3(3)

Hỗn hợp của 1,0g 2-amino-4-(triflometylsulfanyl)phenol (được điều chế bằng phương pháp được mô tả trong công bố đơn quốc tế số WO 2009/131237), 0,87g axit 3-etylsulfanylpicolinic, 1,10g muối axit 1-etyl-3-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimitt clohydric, và 10mL cloroform được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 30 phút. Nước được bổ sung vào các hỗn hợp phản ứng, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa và nước muối bão hòa, và được làm khô trên magie sulfat khan, và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại thu được được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 1,32g 3-etylsulfanyl-N-[2-hydroxy-5-(triflometylsulfanyl)phenyl]picolinamit (dưới đây, được gọi là "hợp chất 3-3").

Hợp chất 3-3

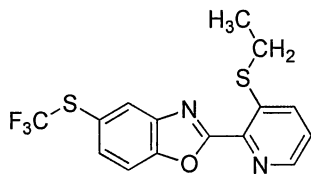


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10,40 (1H, brs), 9,63 (1H, s), 8,36 (1H, dd), 7,75 (1H, dd), 7,53 (1H, d), 7,45 (1H, dd), 7,41 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 2,97 (2H, q), 1,44 (3H, t).

Ví dụ điều chế 3(4)

Hỗn hợp của 1,23g hợp chất 3-3, 1,28g di-2-metoxyletylazodicarboxylat, 1,39g triphenylphosphin, và 30mL tetrahydrofuran được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 1 giờ và ở 50°C trong 1 giờ. Các hỗn hợp phản ứng được cho làm mát tới nhiệt độ trong phòng và sau đó được cô dưới áp suất giảm, và nước được bổ sung vào đó, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa và nước muối bão hòa, và được làm khô trên magie sulfat khan và được cô dưới áp suất giảm. Phần

còn lại thu được được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 1,21g 2-(3-ethylsulfanylpinyin-2-yl)-5-(triflometylsulfanyl) benzoxazol (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 441").

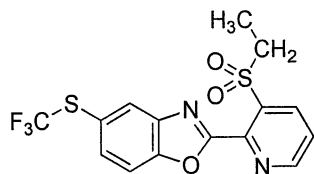


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8,59 (1H, dd), 8,27 (1H, s), 7,78 (1H, dd), 7,75-7,69 (2H, m), 7,42 (1H, dd), 3,07 (2H, q), 1,47 (3H, t).

Ví dụ điều chế 4

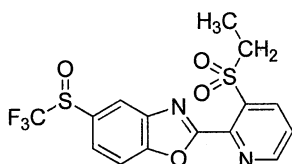
Bổ sung 1,47g axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết 65% hoặc cao hơn) vào hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế 441 (1,06 g) và 30mL cloroform ở điều kiện làm mát bằng nước đá, và các hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 6 giờ. Bổ sung dung dịch nước natri sulfit 10% vào các hỗn hợp phản ứng, và các hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Các lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa, và được làm khô trên magie sulfat khan, và sau đó được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại thu được được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 0,87g 2-(3-ethylsulfonylpinyin-2-yl)-5-(triflometylsulfanyl)benzoxazol (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 443") và 0,17g 2-(3-ethylsulfonylpinyin-2-yl)-5-(triflometylsulfinyl)benzoxazol (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 444").

Hợp chất theo sáng chế 443



$^1\text{H-NMR}$ (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 theo sáng chế 444

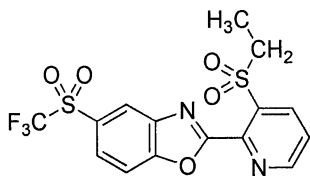


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9,04 (1H, dd), 8,61 (1H, dd), 8,35 (1H, d), 7,96-7,86 (2H, m), 7,77 (1H, dd), 4,01 (2H, q), 1,44 (3H, t).

Ví dụ điều chế 5

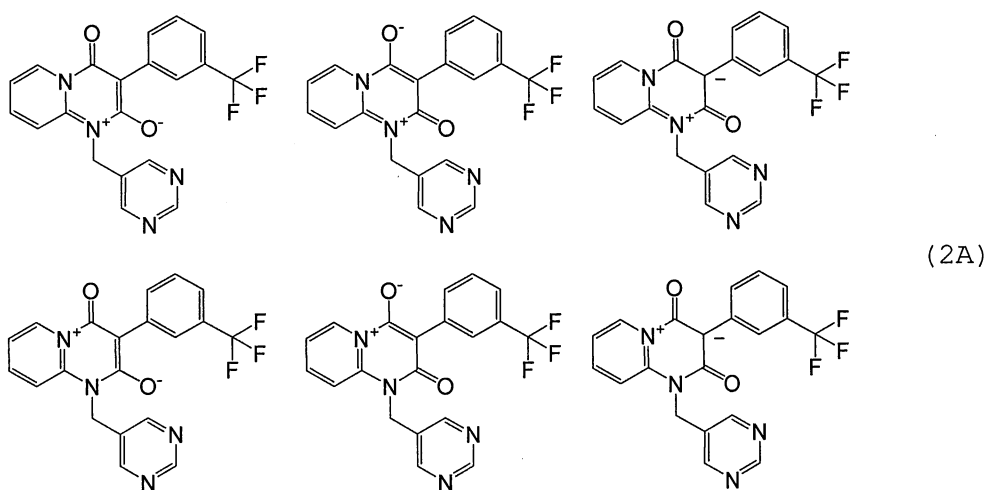
Bổ sung 0,43g axit m-cloperbenzoic (độ tinh khiết 65% hoặc cao hơn) vào hỗn hợp của 0,35g hợp chất theo sáng chế 443 và 8mL cloroform ở điều kiện làm mát bằng nước đá, và các hỗn hợp được khuấy ở 40°C trong 6 giờ. Các hỗn hợp phản ứng được cho làm mát tới nhiệt độ trong phòng, và dung dịch nước natri sulfit 10% được bổ sung vào đó, và các hỗn hợp được chiết bằng cloroform. Các lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri hydro carbonat bão hòa, và được làm khô trên magie sulfat khan, và sau đó được cô dưới áp suất giảm. Bổ sung 4mL axetonitril, 30mg natri tungstat 2 hydrat và 4mL dung dịch hydro peroxit (30%) vào phần còn lại thu được, và các hỗn hợp được khuấy ở 80°C trong 6 giờ. Các hỗn hợp phản ứng được cho làm mát tới nhiệt độ trong phòng, và nước được bổ sung vào đó, và các chất rắn kết tủa được thu gom bằng lọc, và bổ sung dung dịch nước natri sulfit 10% vào phần lọc được, và các hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ được rửa bằng nước và nước muối bão hòa, được làm khô trên magie sulfat khan và được cô dưới áp suất giảm. Phần còn lại thu được được đưa đi sắc ký cột silicagel để tạo ra 0,35g 2-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfonyl)benzoxazol (dưới đây, được gọi là "hợp chất theo sáng chế 445").

Hợp chất theo sáng chế 445



$^1\text{H-NMR}$ (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).

Triflumezopyrim được sử dụng trong sáng chế là ở dạng muối nội mesoion, và được thể hiện bởi sáu công thức cấu tạo dưới đây.



Triflumezopyrim có thể được điều chế theo phương pháp được mô tả trong công bố đơn quốc tế số WO 2012/092115, và trong tài liệu này, được mô tả là muối liên phân tử 2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-4H-pyrid[1,2-a]pyridini.

Trong một phương án, các ví dụ về chế phẩm sáng chế bao gồm dưới đây.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là $-\text{NMe}-$, nguyên tử oxy, hoặc nguyên tử lưu huỳnh, A^2 là $=\text{N}-$, $=\text{N}(\rightarrow\text{O})-$, hoặc $=\text{CH}-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-\text{OR}^{10}$, hoặc $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, R^6 là $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} độc lập với nhau là nhóm C1-

C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là -NMe- hoặc nguyên tử oxy, A^2 là =N-, =N($\rightarrow$ O)-, hoặc =CH-, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, -OR¹⁰, hoặc -S(O)_mR¹⁰, R^6 là -NR¹⁰R¹¹ hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là -NMe- hoặc nguyên tử oxy, A^2 là =N-, =N($\rightarrow$ O)-, hoặc =CH-, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl, R^2 , R^4 và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử halogen, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, -OR¹⁰, hoặc -S(O)_mR¹⁰, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là -NMe-, A^2 là =N- hoặc =N($\rightarrow$ O)-, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl, R^2 , R^4 , và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc -S(O)_mR¹⁰, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, A^2 là =N-, =N($\rightarrow$ O)-, hoặc =CH-, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl, R^2 , R^4 , và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, -OR¹⁰, hoặc S(O)_mR¹⁰,

và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, A^2 là $=N-$ hoặc $=N(\rightarrow O)-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 , R^3 , R^4 và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc $-S(O)_mR^{10}$, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, A^2 là $=N-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl, R^2 , R^3 , R^4 và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc $-S(O)_mR^{10}$, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, A^2 là $=CH-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 , R^3 , R^4 , và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc $-S(O)_mR^{10}$, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, A^2 là $=CH-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl, R^2 , R^3 , R^4 , và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc $-S(O)_mR^{10}$, và R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm Y (nhóm Y: nhóm bao gồm nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy

ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, và nguyên tử halogen), R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-C(OR^{10})_3$, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, $-CO_2R^{10}$, $-SF_5$, hoặc nguyên tử halogen, R^6 là $-OR^{10}$, $-NR^{10}R^{11}$, $-CO_2R^{10}$, $-C(O)NR^{10}R^{11}$, $-OC(O)R^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-CH_2CO_2R^{10}$, nhóm C3-C6 xycloalkyl hoặc nguyên tử hydro, R^8 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^{10} và R^{11} độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro (với điều kiện là trong $-S(O)_mR^{10}$, khi m là 1 hoặc 2, R^{10} không phải là nguyên tử hydro); và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-C(OR^{10})_3$, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, hoặc nguyên tử halogen, R^6 là nhóm xyano, $-NR^{10}R^{11}$, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^8 là $-S(O)_mR^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} mỗi nhóm độc lập với nhau là nhóm xyano, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} mỗi nhóm độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó R^1 là nhóm etyl, R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-C(OR^{10})_3$, nguyên tử

halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 haloalkyl, $-OR^{20}$, $-S(O)_mR^{20}$ hoặc nguyên tử halogen (R^{20} là nhóm C1-C3 haloalkyl), R^6 là nhóm xyano, $-NR^{10}R^{11}$, nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^8 là $-S(O)_mR^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là $-NR^7-$; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là $-NR^7-$, R^1 là nhóm C1-C3 alkyl, R^2 và R^4 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-C(OR^{10})_3$, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 haloalkyl, $-OR^{20}$, $-S(O)_mR^{20}$, hoặc nguyên tử halogen, R^6 là nhóm xyano, $-NR^{10}R^{11}$, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^8 là $-S(O)_mR^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} độc lập với nhau là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, và R^{20} là nhóm C1-C3 haloalkyl; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, R^1 là nhóm etyl, R^2 , R^4 và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-C(OR^{10})_3$, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 haloalkyl, $-OR^{20}$, $-S(O)_mR^{20}$, hoặc nguyên tử halogen, R^8 là $-S(O)_mR^{10}$, nhóm xyano, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^{10} là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý

có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, và R^{20} là nhóm C1-C3 haloalkyl; và triflumezopyrim.

Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa hợp chất có công thức (1) trong đó A^1 là nguyên tử oxy, R^1 là nhóm etyl, R^2 , R^4 và R^6 mỗi nhóm là nguyên tử hydro, R^3 là nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 perfluoroalkyl, $-OR^{30}$, hoặc $-S(O)_mR^{30}$, R^{30} là nhóm C1-C3 perfluoroalkyl, và R^8 là nguyên tử halogen hoặc nguyên tử hydro; và triflumezopyrim.

Chế phẩm của sáng chế có thể chỉ là hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim, tuy nhiên, thường được điều chế bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim với chất mang trợ, và nếu cần, bổ sung các chất hoạt động bề mặt và các tác nhân hỗ trợ khác để bào chế, để bào chế thành các dung dịch dầu, các chất cô nhũ hóa được, chảy được, bột thấm ướt được, bột thấm ướt dạng hạt, dạng bào chế bụi, các hạt, và các dạng khác.

Đồng thời, chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại được bào chế ở trên có thể được sử dụng ngay như vậy hoặc bằng cách bổ sung các thành phần trợ khác.

Tổng lượng của hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim thường là nằm trong khoảng 0,1% đến 100% theo trọng lượng, ưu tiên là nằm trong khoảng từ 0,2% đến 90% theo trọng lượng, và ưu tiên hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 80% theo trọng lượng trong chế phẩm của sáng chế.

Các ví dụ về các chất mang trợ được sử dụng trong bào chế bao gồm chất mang rắn và chất mang lỏng. Các ví dụ về chất mang rắn bao gồm các bột mịn hoặc các hạt đất sét (chẳng hạn, đất sét cao lanh, silicagen, bentonit, đất sét Fubasami, hoặc đất sét trắng axit), các silic oxit được hydrat tổng hợp, các talc, các xeramic, các chất khoáng vô cơ khác (chẳng hạn, serixit, thạch anh, lưu huỳnh, than hoạt tính, canxi carbonat hoặc silic đioxit được hydrat) hoặc các phân bón hóa học (chẳng hạn, amoni sulfat, amoni phosphat, amoni nitrat, ure

hoặc amoni clorua) và các loại khác; cũng như các nhựa tổng hợp (chẳng hạn, các nhựa polyeste như là polypropylen, polyacrylonitril, polymethylmethacrylat và polyetylen terephthalat; các nhựa nylon (chẳng hạn, nylon-6, nylon-11 và nylon-66); các nhựa polyamit; copolyme polyvinyl clorua, polyvinyliden clorua, vinyl clorua-propylen, và các loại khác).

Các ví dụ về các chất mang lỏng bao gồm nước; các rượu (chẳng hạn, metanol, etanol, rượu isopropyl, butanol, hexanol, rượu benzyl, etylen glycol, propylen glycol hoặc phenoxy etanol); các keton (chẳng hạn, axeton, metyl etyl keton hoặc xyclohexanon); các hydrocacbon thơm (chẳng hạn, toluen, xylen, etyl benzen, dodexyl benzen, phenyl xylyl etan hoặc metylnaphthalen); các hydrocacbon béo (chẳng hạn, hexan, xyclohexan, kerosen hoặc dầu nhẹ); các este (chẳng hạn, etyl axetat, butyl axetat, isopropyl myristat, etyl oleat, diisopropyl adipat, diisobutyl adipat hoặc propylen glycol monometyl ete axetat); các nitril (chẳng hạn, axetonitril hoặc isobutyronitril); các ete (chẳng hạn, diisopropyl ete, 1,4-dioxan, etylenglycol dimetyl ete, dietylenglycol dimetyl ete, dietylen glycol monometyl ete, propylen glycol monometyl ete, dipropylen glycol monometyl ete hoặc 3-metoxi-3-metyl-1-butanol); các axit amit (chẳng hạn, N,N-dimetylformamit hoặc N,N-dimetylxetamit); các hydrocacbon được halogen hóa (chẳng hạn, diclometan, tricloetan hoặc carbon tetraclorea); các sulfoxit (chẳng hạn, dimetyl sulfoxit); propylen carbonat; và các dầu thực vật (chẳng hạn, dầu đậu tương hoặc dầu hạt bông).

Các ví dụ về các chất hoạt động bề mặt bao gồm các chất hoạt động bề mặt không phân ly như là các polyoxyetylenated alkyl ete, các alkyl aryl ete được polyoxyetylen hóa và các este axit béo polyetylen glycol; và các chất hoạt động bề mặt anion như là các alkyl sulfonat, các alkylbenzen sulfonat và các alkyl sulfat.

Các ví dụ về các tác nhân hỗ trợ khác để bào chế bao gồm chất kết dính,

chất phân tán, chất tạo màu và chất ổn định. Các ví dụ cụ thể bao gồm casein, gelatin, các polysacarit (chẳng hạn, tinh bột, gôm arabic, các dẫn xuất xenluloza và axit alginic), bentonit, các polyme tổng hợp tan trong nước (chẳng hạn, rượu polyvinyl, polyvinyl pyrrolidon và các axit polyacrylic), PAP (isopropyl phosphat axit hóa), BHT (2,6-di-tert-butyl-4-metylphenol), BHA (hỗn hợp của 2-tert-butyl-4-metoxyphecol và 3-tert-butyl-4-metoxyphecol).

Phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại của sáng chế được thực hiện bằng cách phun lượng có hiệu quả của chế phẩm của sáng chế lên các sinh vật gây hại hoặc chỗ cư trú nơi sinh vật gây hại sống (thực vật, đất, v.v.). Trong phương pháp để phòng trừ các sinh vật gây hại của sáng chế, chế phẩm của sáng chế thường được sử dụng dưới dạng tác nhân để phòng trừ các sinh vật gây hại mà chế phẩm của sáng chế được bào chế thành.

Các ví dụ cụ thể về phun chế phẩm của sáng chế bao gồm phun lên thân và lá, hoa, cây giống, hoặc bông (cây); phun lên đất trước khi trồng cây hoặc đất sau khi trồng cây (đất để trồng cây); phun lên hạt giống cây trồng (chẳng hạn, tẩy trùng hạt giống, ngâm hạt giống, hoặc phủ hạt giống) hoặc củ như là thân củ giống. Đồng thời, hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim có thể được phun riêng biệt, và, chẳng hạn, một trong số hợp chất theo sáng chế hoặc triflumezopyrim được tích tụ trên hạt giống hoặc củ của cây trồng và một thành phần khác sau đó được phun lên hạt giống hoặc củ của cây trồng, hoặc đất để trồng hạt giống hoặc củ của cây trồng trước hoặc sau khi trồng cây.

Các ví dụ cụ thể về phương pháp phun lên thân và lá, hoa, cây giống, bông của cây trồng bao gồm phương pháp phun lên bề mặt của cây như là phun lên tán lá và phun lên thân cây, và đồng thời phương pháp phun lên hoa hoặc toàn bộ cây ở thời điểm trổ hoa bao gồm trước khi trổ hoa, trong khi trổ hoa, và sau khi trổ hoa, và phương pháp phun lên bông hoặc toàn bộ thực vật ở mùa nảy mầm của hạt.

Đồng thời, các ví dụ về phương pháp phun lên đất trước khi trồng cây hoặc sau khi trồng cây (đất để trồng cây) bao gồm phương pháp phun chế phẩm của sáng chế lên phần rễ của cây cần được bảo vệ khỏi tổn hại như là bị sinh vật gây hại ăn, và phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại ăn cây trồng bằng cách hấp thụ và chuyển chế phẩm của sáng chế từ rễ và/hoặc các thân ngầm vào các bộ phận bên trong của cây trồng.

Các ví dụ cụ thể về xử lý phun bao gồm xử lý lỗ trồng (xịt vào các lỗ trồng, trộn đất sau khi xử lý lỗ trồng), xử lý gốc cây (xịt vào gốc cây, trộn đất sau khi xử lý gốc cây, tưới vào gốc cây, xử lý gốc cây ở giai đoạn nảy mầm sau), xử lý trong rãnh (xịt vào rãnh trồng, trộn đất sau khi xử lý trong rãnh), xử lý luống trồng (xịt vào luống trồng, trộn đất sau khi xử lý luống trồng, xịt vào luống trồng ở giai đoạn sinh trưởng), xử lý luống trồng ở thời điểm gieo hạt (xịt vào luống trồng ở thời điểm gieo hạt, trộn đất sau khi xử lý luống trồng ở thời điểm gieo hạt), xử lý rải (xịt toàn bộ bề mặt đất, trộn đất sau khi xử lý rải), xử lý cạnh luống, xử lý bề mặt nước (phun lên bề mặt nước, phun lên bề mặt nước sau khi ngập), xử lý xịt đất khác (xịt hạt bào chế lên lá ở giai đoạn sinh trưởng, xịt dưới tán hoặc quanh thân cây, xịt lên bề mặt đất, trộn với đất bề mặt, xịt vào các lỗ gieo, xịt lên các bề mặt nền của các rãnh, xịt vào giữa các cây trồng), xử lý tưới khác (tưới đất, tưới ở giai đoạn nảy mầm, bơm dung dịch, tưới vào phần của cây trồng ở trên mặt đất, tưới đầm dung dịch, tưới nhỏ giọt (chemigation)), xử lý chậu cây giống (xịt vào chậu cây giống, tưới chậu cây giống, ngâm ngập chậu cây giống bằng dung dịch hóa học), xử lý khay cây giống (xịt vào khay cây giống, tưới khay cây giống, ngâm ngập khay cây giống bằng dung dịch hóa học), xử lý lớp ươm (xịt vào lớp ươm, tưới lớp ươm, xịt vào ruộng lúa ngập, ngâm cây giống), xử lý kết hợp lớp đất ươm (trộn với lớp đất ươm, trộn với lớp đất ươm trước khi gieo hạt, xịt ở thời điểm gieo hạt trước khi phủ đất, xịt ở thời điểm gieo hạt sau khi phủ đất, trộn với đất phủ, và xử lý khác (trộn với đất trồng, cày lấp, trộn với đất bề mặt, trộn với đất ở nơi có mưa rơi, xử lý ở vị trí trồng, xịt

dạng bào chế hạt lên chùm hoa, trộn với phân bón nhão).

Các ví dụ về phun lên hạt giống hoặc củ của cây trồng có thể được thực hiện cũng bằng cách phun chế phẩm của sáng chế lên hạt giống hoặc củ của cây trồng. Hạt giống của cây trồng được mô tả ở đây là hạt giống của cây trồng ở trạng thái trước khi gieo vào đất hoặc môi trường nuôi cấy hạt giống, và củ được mô tả ở đây là các loại thân đĩa, thân hành, thân củ, củ giống, rễ thân củ, của cây trồng ở trạng thái trước khi trồng vào đất hoặc môi trường nuôi cấy để nuôi cấy. Các ví dụ về phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại bằng cách phun chế phẩm của sáng chế lên hạt giống hoặc củ của cây trồng bao gồm phương pháp phun chế phẩm của sáng chế trực tiếp lên hạt giống hoặc củ của cây trồng cần được bảo vệ khỏi hư hại như là bị ăn bởi các sinh vật gây hại; và phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại mà ăn hạt giống bằng cách phun chế phẩm của sáng chế vào vùng lân cận hạt giống hoặc củ của cây trồng; và phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại mà ăn cây trồng bằng cách tẩm và chuyển chế phẩm của sáng chế từ hạt giống hoặc củ của cây trồng vào bên trong của thân cây trồng. Các ví dụ về phương pháp phun chế phẩm của sáng chế lên hạt giống hoặc củ của cây trồng bao gồm xử lý xịt, xử lý phủ xịt, xử lý ngâm, xử lý thấm, xử lý phủ, xử lý phủ màng, và xử lý phủ viên.

Khi chế phẩm của sáng chế được sử dụng để phòng trừ các sinh vật gây hại, liều lượng phun có thể thay đổi nhiều phụ thuộc vào thời gian phun, nơi cần được phun, hoặc cách phun và tương tự. Tổng lượng hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim thường là nằm trong khoảng 1 đến 10000g trên mỗi 10000 m². Khi chế phẩm của sáng chế được bào chế thành chất cô nhũ hóa được, bột ướt, hoặc dạng bào chế chảy v.v., hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim thường là được phun bằng pha loãng chúng với nước theo cách mà tổng nồng độ hợp chất theo sáng chế và triflumezopyrim nằm trong khoảng 0,01 đến 10000 ppm. Trong trường hợp dạng bào chế hạt, hoặc dạng bào chế bụi v.v., các dạng bào chế này thường là được phun luôn mà không pha loãng.

Đồng thời, khi chế phẩm của sáng chế được phun cho lúa, chế phẩm của sáng chế có thể được sử dụng bằng cách xử lý chậu cây giống. Tính thời gian phun chế phẩm của sáng chế bởi xử lý chậu cây giống có thể là từ thời điểm gieo giống đến thời điểm cấy chuyển. Đồng thời, chế phẩm của sáng chế có thể được sử dụng cho cách gieo trồng gieo hạt trực tiếp hoặc gieo trồng cấy chuyển cây lúa. Khi chế phẩm của sáng chế được sử dụng cho lúa đối với cách gieo trồng gieo hạt trực tiếp, chế phẩm của sáng chế có thể được phun trước khi gieo hạt trực tiếp lên ruộng lúa ngập nước, sau khi gieo hạt trực tiếp lên ruộng lúa ngập nước, trước khi gieo hạt trực tiếp lên ruộng lúa cạn, hoặc sau khi gieo hạt trực tiếp lên ruộng lúa cạn, và cũng có thể là thời điểm trước khi gieo hạt đến 21 ngày sau khi gieo hạt. Khi chế phẩm của sáng chế được sử dụng cho lúa đối với cách gieo trồng cấy chuyển, lúa có thể là lúa sau khi cấy chuyển, và thời điểm phun có thể là thời điểm trước khi cấy chuyển tới 21 ngày sau khi cấy chuyển.

Các ví dụ về các sinh vật gây hại mà chế phẩm của sáng chế có hiệu lực bao gồm các động vật chân đốt gây hại như là các loại côn trùng gây hại và các loại ve bét gây hại. Các ví dụ cụ thể về các sinh vật gây hại bao gồm các loại dưới đây.

Các sinh vật gây hại bộ cánh nửa - Hemiptera:

Delphacidae (chẳng hạn, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, hoặc *Sogatella furcifera*),

Deltocephalidae (chẳng hạn, *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix virescens*, *Empoasca onukii*,

Aphididae (chẳng hạn, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis spiraecola*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus*, hoặc *Hyalopterus pruni*)

Pentatomidae (chẳng hạn, *Nezara antennata*, *Riptortus clavetus*, *Riptortus clavetus*, *Leptocorisa chinensis*, *Eysarcoris parvus*, hoặc *Halyomorpha mista*),

Aleyrodidae (chẳng hạn, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*).

Các sinh vật gây hại bộ cánh vảy-Lepidoptera:

Pyrallidae (chẳng hạn, *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis*, hoặc *Pediasia teterrellus*),

Noctuidae (chẳng hạn, *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Trichoplusia* spp., *Heliothis* spp., hoặc *Helicoverpa* spp.),

Pieridae (chẳng hạn, *Pieris rapae*),

Tortricidae (chẳng hạn, *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, hoặc *Cydia pomonella*),

Gracillariidae (chẳng hạn, *Caloptilia theivora*, hoặc *Phyllonorycter ringoneella*),

Carposinidae (chẳng hạn, *Carposina niponensis*),

Lyonetiidae (chẳng hạn, *Lyonetia* spp.),

Lymantriidae (chẳng hạn, *Lymantria* spp., hoặc *Euproctis* spp.),

Yponomeutidae (chẳng hạn, *Plutella xylostella*),

Gelechiidae (chẳng hạn, *Pectinophora gossypiella*, hoặc *Phthorimaea operculella*),

Arctiidae (chẳng hạn, *Hyphantria cunea*);

Tinea (chẳng hạn, *Tinea translucens*).

Các sinh vật gây hại bộ cánh tơ - Thysanoptera:

Thysanopterae (chẳng hạn, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips parvi*,

Scirtothrips dorsalis, *Thrips tabaci*, hoặc *Frankliniella intonsa*).

Các sinh vật gây hại bộ hai cánh - Diptera:

Anthomyiidae (chẳng hạn, *Delia platura*, hoặc *Delia antiqua*),

Agromyzidae (chẳng hạn, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, hoặc *Chromatomyia horticola*),

Clopidae (chẳng hạn, *Clops oryzae*),

Tephritidae (chẳng hạn, *Dacus cucurbitae*, hoặc *Ceratitis capitata*), và

Drosophilidae.

Các sinh vật gây hại bộ cánh cứng - Coleoptera:

Chrysomelidae (chẳng hạn, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*),

Scarabaeidae (chẳng hạn, *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea*, hoặc *Popillia japonica*),

Curculionidae (chẳng hạn, *Sitophilus zeamais*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Echinocnemus squameus*, *Anthonomus grandis*, hoặc *Sphenophorus venatus*),

Tenebrionidae (chẳng hạn, *Tenebrio molitor*, hoặc *Tribolium castaneum*),

Chrysomelidae (chẳng hạn, *Oulema oryzae*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata*, hoặc *Leptinotarsa decemlineata*),

Epilachna (chẳng hạn, *Epilachna vigintioctopunctata*),

Scolytidae (chẳng hạn, *Lyctus brunneus*, hoặc *Tomicus piniperda*),

Bostrichidae,

Ptinidae,

Cerambycidae (chẳng hạn, *Anoplophora malasiaca*),

Elateridae (*Agriotes* spp., hoặc *Limonius* spp.), và

Paederus fuscipes.

Các sinh vật gây hại được nêu ở trên cũng bao gồm quần thể các sinh vật gây hại có tính khác các tác nhân thông thường, và do đó chế phẩm của sáng chế có hiệu quả chống lại quần thể có tính kháng.

Các ví dụ về các cây trồng mà chế phẩm sáng chế có thể được phun lên bao gồm các loại dưới đây.

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

Các loại rau: các loại rau họ cà (cà, cà chua, ớt, hồ tiêu, và khoai tây, v.v.), các loại rau họ bầu bí (dưa chuột, bí ngô, bí ngòi, dưa hấu, dưa, và bí, v.v.), các loại rau họ cải (củ cải Nhật Bản, củ cải trắng, củ cải ngựa, su hào, cải bắp Trung Quốc, cải bắp, cải bẹ xanh, cải bông xanh, và súp lơ, v.v.), các loại rau họ cúc (nguru bàng, cải cúc, atisô, và rau diếp, v.v.), các loại rau họ huệ tây (hành tây, hành, tỏi, và măng tây), các loại rau họ hoa tán (cà rốt, mùi tây, cần tây, và củ cải vàng, v.v.), các loại rau họ rau muống (rau bina, và cải cầu vồng, v.v.), các loại rau họ húng (tía tô, bạc hà, và húng quế, v.v.), dâu tây, khoai lang, khoai môn, và khoai sọ, v.v.;

Các loại hoa;

Các loại cây có tán;

Các loại cỏ mịn;

Các loại cây ăn quả: các loại cây ăn quả họ táo (táo, lê, lê Nhật Bản, mận qua Trung Quốc, và mận qua, v.v.), các cây ăn quả cùi dày (đào, mận, xuân đào, mơ Nhật Bản (*Prunus mume*), anh đào, mơ, và mận, v.v.), cây giống cam quýt (quýt, cam, chanh, chanh vàng, và bưởi, v.v.), các loại cây quả hạch (hạt dẻ, óc chó, phỉ, hạch, hồ trăn, điều, và mắc ca, v.v.), các loại cây quả mọng (việt quất,

nam việt quất, mâm xôi đen, và mâm xôi đỏ, v.v.), nho, hồng vàng Nhật Bản, oliu, mận Nhật Bản, chuối, cà phê, chà là, và dứa, v.v.; và

Các loại cây không phải cây ăn quả: chè, dâu, các loại cây ra hoa, các loại cây bên đường (tần bì, bạch dương, sơn thù du, bạch đàn, bạch quả (*ginkgo biloba*), đinh hương, thích, sồi (*quercus*), dương, cây Judas, gồm Formosan(*Liquidambar formosana*), tiêu huyền, zelkova, trắc bá Nhật Bản (*Thuja standishii*), linh sam, độc cần, bách xù, cây họ thông, cây họ vân sam, và thủy tùng (*Taxus cuspidate*)), v.v..

Các cây được mô tả ở trên có thể là các cây được gây giống bằng kỹ thuật lai.

Tức là, các cây được nhân giống bởi kỹ thuật lai là các cây có ưu thế giống lai (nói chung, dẫn đến tăng cường tiềm năng thu hoạch và cải thiện tích kháng các yếu tố áp lực sinh học và vô sinh, chẳng hạn).

"Cây trồng" nêu trên có thể bao gồm các cây trồng mà tính kháng được truyền bởi tái tổ hợp di truyền.

Chẳng hạn, các cây trồng được mô tả ở trên cũng bao gồm các cây trồng có tính kháng các thuốc diệt cỏ bao gồm các chất ức chế HPPD như là isoxaflutole; các chất ức chế ALS như là imazethapyr và thifensulfuron metyl; các chất ức chế EPSP; các chất ức chế glutamin synthetaza; bromoxynil; dicamba; và tương tự, mà tính kháng đã được truyền bằng phương pháp nhân giống cổ điển hoặc kỹ thuật cải biến di truyền.

Các cây trồng được mô tả ở trên có thể bao gồm các cây trồng mà đã có khả năng tổng hợp các độc tố chọn lọc và tương tự (chẳng hạn, giống *Bacillus*) sinh ra bằng cách sử dụng kỹ thuật cải biến di truyền.

Ngoài ra, các cây trồng được mô tả ở trên bao gồm các dòng có hai hoặc nhiều kiểu tính trạng liên quan đến tính kháng thuốc diệt cỏ, tính kháng sinh vật

gây hại, tính kháng bệnh, và tương tự như được mô tả ở trên, mà các tính trạng được truyền sử dụng kỹ thuật nhân giống cổ điển hoặc kỹ thuật cải biến di truyền, và các dòng có hai hoặc nhiều kiểu đặc tính được sở hữu bởi các dòng bố mẹ, mà các đặc tính được truyền bởi các cây trồng được cải biến di truyền chéo có các kiểu đặc tính giống nhau hoặc khác nhau. Các ví dụ về các cây trồng như vậy bao gồm Smart stax (nhãn hiệu được đăng ký).

Tỷ lệ của hợp chất theo sáng chế so với triflumezopyrim trong chế phẩm của sáng chế thường là nằm trong khoảng 100:1 đến 1:100 theo trọng lượng, và ưu tiên là nằm trong khoảng 10:1 đến 1:10.

Chế phẩm của sáng chế có thể còn chứa một hoặc nhiều hợp chất được lựa chọn từ Nhóm (A) được nêu dưới đây.

Nhóm (A): nhóm bao gồm các hợp chất dưới đây: clothianidin, dinotefuran, thiametoxam, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid, fipronil, ethiprol, etofenprox, silafluofen, clorantraniliprol, xyantraniliprol, cartap, flupyradifuron, pymetrozin, isotianil, azoxystrobin, orysastrobin, probenazol, tiadinil, trioxyclozol, pyroquilon, dicloxymet, ferimzon, phtalit, kasugamycin hydrochlorua hydrat, tebufloquin, penxycuron, validamycin, hexaconazol, flutolanil, carpropamid, furametpyr, penflufen, và tolprocarb.

Các ví dụ về tổ hợp bao gồm dưới đây.

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và isotianil;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và orysastrobin;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và probenazol;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến

481", triflumezopyrim, và trixycclazol;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và dicloxymet;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và carpropamid;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và tiadinil;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và pyroquilon;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và tolprocarb;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, isotianil, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, isotianil, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, probenazol, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, probenazol, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, trixycclazol, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, trixyclozol, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, tiadinil, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, tiadinil, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, pyroquilon, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, pyroquilon, và penflufen;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, tolprocarb, và furametpyr;

Tổ hợp của "hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481", triflumezopyrim, tolprocarb, và penflufen;

Dưới đây, sáng chế được giải thích chi tiết hơn bằng cách sử dụng Ví dụ bào chế và Ví dụ thử nghiệm, tuy nhiên, sáng chế không giới hạn ở các ví dụ này. Thuật ngữ "phần" là "phần trọng lượng" trừ phi được nêu cụ thể.

Trước tiên, các ví dụ bào chế được mô tả.

Ví dụ bào chế 1

Năm (5) phần của bất kỳ loại nào trong số các hợp chất theo sáng chế 1 đến 481, 10 phần triflumezopyrim, 35 phần hỗn hợp của cacbon trắng và muối polyoxyetylen alkyl ete sulfat amoni (tỷ lệ trọng lượng là 1:1), và nước được trộn để tạo ra 100 phần là trọng lượng toàn phần, tiếp theo là nghiền mịn bằng phương pháp nghiền ướt để thu mỗi dạng bào chế.

Ví dụ bào chế 2

Mười (10) phần bất kỳ loại nào trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481, 2 phần triflumezopyrim, 1,5 phần sorbitan trioleat, 28 phần dung dịch chứa 2 phần polyvinylalcohol được trộn và được nghiền bằng phương pháp nghiền ướt, và sau đó dung dịch chứa 0,05 phần gôm xantan và 0,1 phần nhôm magie silicat được bổ sung vào các hỗn hợp để tạo ra 90 phần là trọng lượng toàn phần. 10 phần propyleneglycol được bổ sung vào các hỗn hợp, và các hỗn hợp được khuấy và được trộn để thu mỗi dạng bào chế.

Ví dụ bào chế 3

Mười (10) phần bất kỳ loại nào trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481, 10 phần triflumezopyrim, 3 phần canxi lignin sulfonat, 2 phần natri lauryl sulfat, và phần còn lại là silic oxit được hydrat tổng hợp được nghiền kỹ và được trộn để thu 100 phần mỗi dạng bột ướt.

Ví dụ bào chế 4

Một (1) phần của bất kỳ loại nào trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481, 0,5 phần triflumezopyrim, 1 phần bột mịn silic oxit được hydrat tổng hợp, 2 phần canxi lignin sulfonat, 30 phần bentonit, và phần còn lại là đất sét cao lanh được bổ sung và được trộn. Sau đó, vào các hỗn hợp, lượng nước thích hợp được bổ sung, và các hỗn hợp được khuấy, được tạo hạt bằng thiết bị tạo hạt và được sấy bằng không khí cưỡng bức để thu 100 phần mỗi dạng bào chế hạt.

Ví dụ bào chế 5

Một trăm (100) phần của hỗn hợp gồm 2 phần của bất kỳ loại nào trong số các hợp chất theo sáng chế từ 1 đến 481, 0,75 phần triflumezopyrim, 2 phần isotianil, 1 phần silic oxit được hydrat tổng hợp, 2 phần canxi lignin sulfonat, 30 phần bentonit, và phần còn lại là đất sét cao lanh được trộn nghiền kỹ, và nước được bổ sung vào đó, và các hỗn hợp được ngào trộn kỹ, và được tạo hạt và được sấy để thu 100 phần của mỗi dạng bào chế hạt.

Các ví dụ bào chế 6 đến 15

Mỗi dạng bào chế hạt thu được theo cách thức tương tự với Ví dụ bào chế 5 ngoại trừ sử dụng hợp chất riêng và lượng được sử dụng của chúng được chỉ ra trong Bảng A thay cho 2 phần isotianil.

Bảng A

Ví dụ bào chế	Hợp chất	Lượng được sử dụng [Phần]
6	Isotianil	2
	Furametpyr	4
7	Isotianil	2
	Penflufen	2
8	Probenazol	10
9	Probenazol	24
10	Tiadinil	12
11	Trioxycloz	4
12	Orysastrobilin	7
13	Pyroquilon	12
14	Tolprocarb	4
15	Tolprocarb	9

Tiếp theo, các ví dụ ứng dụng chế phẩm của sáng chế cho hạt giống cây trồng được mô tả.

Ví dụ ứng dụng 1

Mỗi loại dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng 200mL trên mỗi 100kg hạt giống lúa miến khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Đồng thời, 180g oxabetrinil hoặc 40g fluxofenim được bổ sung vào mỗi dạng bào chế 200mL thu được trong các Ví dụ bào chế được nêu ở trên, và dạng bào chế thu được có thể được sử dụng cho xử lý bôi trong hạt giống lúa miến khô ở trên để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 2

Mỗi dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng là 40mL trên mỗi 10 kg hạt giống ngô khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 3

Mỗi loại bột ướt được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 3 được sử dụng cho xử lý phủ bột với lượng là 50g trên mỗi 10 kg hạt giống ngô khô để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 4

Mỗi dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng là 20mL trên mỗi 10kg hạt giống đậu tương khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 5

Mỗi loại bột ướt được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 3 được sử dụng cho xử lý phủ bột với lượng là 30g trên mỗi 10kg hạt giống đậu tương khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, do Hans-Ulrich Hege GmbH sản xuất) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 6

Mỗi dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng là 50mL trên mỗi 10kg hạt giống bông khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị

sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 7

Mỗi dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng là 150mL trên mỗi 10kg hạt giống cải dầu khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 8

Mỗi dạng bào chế được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 1 hoặc 2 được sử dụng cho xử lý bôi với lượng là 20mL trên mỗi 10kg hạt giống lúa khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, được sản xuất bởi Hans-Ulrich Hege GmbH) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Ví dụ ứng dụng 9

Mỗi loại bột ướt được điều chế theo phương pháp được mô tả trong Ví dụ bào chế 3 được sử dụng để xử lý phủ bột với lượng là 60g trên mỗi 10kg hạt giống lúa khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống quay (thiết bị sàng đãi hạt giống, do Hans-Ulrich Hege GmbH sản xuất) để thu mỗi hạt giống được xử lý.

Tiếp theo, hiệu quả của sáng chế được thể hiện bởi Ví dụ thử nghiệm dưới đây.

Ví dụ thử nghiệm 1

Mỗi 1mg các hợp chất theo sáng chế 3, 15, 19, 20, 48, 50, 72, 81, 85, 99, 130, 421, 444, 445, 464, và 467 lần lượt, hoặc triflumezopyrim được hòa tan vào 10 μ L dung dịch hỗn hợp của xylen, dimetylformamit và chất hoạt động bề mặt (Tên thương mại: Sorpol 3005X, được sản xuất bởi TOHO CHEMICAL

INDUSTRY CO.LTD) (4:4:1 (tỷ lệ thể tích)). Nước chứa 0,02% (thể tích/thể tích) tác nhân phân tán (tên thương mại: Sindain, được sản xuất bởi Sumitomo Chemical Company, Limited) được bổ sung vào đó để tạo ra mỗi nồng độ quy định như được chỉ ra trên các Bảng 21 đến Bảng 22, để tạo ra mỗi dung dịch hóa học thử nghiệm.

Phiến lá (độ dài 1,5 cm) của lá mầm dưa chuột (*Cucumis sativus*) được đặt vào mỗi lỗ trong bảng có 24 lỗ nhỏ (được sản xuất bởi Becton Dickinson), và 2 cá thể trưởng thành không cánh của rệp muội ở bông (*Aphis gossypii*) và 8 thiếu trùng của rệp muội ở bông được thả vào mỗi 1 lỗ, và dung dịch hóa học thử nghiệm được xịt với tỷ lệ 20 μ L trên mỗi 1 lỗ, được gọi là nhóm được xử lý.

Trong khi đó, 20 μ L nước chứa 0,02% (thể tích/thể tích) tác nhân phân tán (tên thương mại: Sindain, được sản xuất bởi Sumitomo Chemical Company, Limited) được xịt vào lỗ thay cho dung dịch hóa học thử nghiệm, được gọi là nhóm được xử lý chưa được xử lý.

Sau khi sấy bằng không khí, phần bên trên của bảng lỗ nhỏ được phủ bằng tấm màng thấm được khí (tên sản phẩm: AeraSeal, được sản xuất bởi Excel Scientific Inc.), và 5 ngày sau khi thả côn trùng, số lượng côn trùng chết của mỗi lỗ được kiểm tra.

Mỗi giá trị phòng ngừa đối với nhóm được xử lý hoặc nhóm chưa được xử lý, lần lượt được tính toán bằng biểu thức dưới đây.

Biểu thức (1)

$$\text{Giá trị phòng ngừa (\%)} = \{1 - (\text{Tai}) / (\text{Cai})\} \times 100$$

trong đó các ký hiệu trong biểu thức là được mô tả dưới đây.

Cai: Số lượng côn trùng chết ở thời điểm kiểm tra trong nhóm chưa được xử lý;

Tai: Số lượng côn trùng chết ở thời điểm kiểm tra trong nhóm được xử lý;

Kết quả là, như được thể hiện trong Bảng 21 đến Bảng 22, các chế phẩm của sáng chế chứa hợp chất theo sáng chế 3, 15, 19, 20, 48, 50, 72, 81, 85, 99, 130, 421, 444, 445, 464, và 467, lần lượt, và triflumezopyrim thể hiện các hiệu quả phòng ngừa tuyệt vời.

Ở đây, mỗi giá trị phòng ngừa riêng của triflumezopyrim hoặc hợp chất theo sáng chế, lần lượt, được quan sát trong thử nghiệm mà được thực hiện tương tự với thử nghiệm được nêu ở trên, được thể hiện dưới đây. Đối với triflumezopyrim, 4 (nồng độ 0,1 ppm), và 30 (nồng độ 1 ppm); đối với hợp chất theo sáng chế 15, 28 (nồng độ 1 ppm); đối với hợp chất theo sáng chế 20, 12 (nồng độ 0,01 ppm); đối với hợp chất theo sáng chế 72, 32 (nồng độ 10 ppm); đối với hợp chất theo sáng chế 444, 32 (nồng độ 1 ppm); đối với hợp chất theo sáng chế 445, 30 (nồng độ 0,1 ppm), và 37 (nồng độ 1 ppm).

Bảng 21

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ (ppm)	Giá trị phòng ngừa được quan sát
Hợp chất theo sáng chế 3 + triflumezopyrim	1 + 1	84
Hợp chất theo sáng chế 15 + triflumezopyrim	1 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 15 + triflumezopyrim	1 + 0,1	100
Hợp chất theo sáng chế 19 + triflumezopyrim	0,01 + 1	92
Hợp chất theo sáng chế 20 + triflumezopyrim	0,01 + 1	84
Hợp chất theo sáng chế 48 + triflumezopyrim	0,1 + 1	80
Hợp chất theo sáng chế 50 + triflumezopyrim	10 + 1	80
Hợp chất theo sáng chế 50 + triflumezopyrim	1 + 1	76
Hợp chất theo sáng chế 72 + triflumezopyrim	10 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 72 + triflumezopyrim	10 + 0,1	100

Bảng 22

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ (ppm)	Giá trị phòng ngừa được quan sát
Hợp chất theo sáng chế 81 + triflumezopyrim	10 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 81 + triflumezopyrim	1 + 1	92
Hợp chất theo sáng chế 81 + triflumezopyrim	0,1 + 1	64
Hợp chất theo sáng chế 85 + triflumezopyrim	10 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 85 + triflumezopyrim	1 + 1	68
Hợp chất theo sáng chế 99 + triflumezopyrim	10 + 0,1	92
Hợp chất theo sáng chế 99 + triflumezopyrim	1 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 130 + triflumezopyrim	10 + 0,1	52
Hợp chất theo sáng chế 421 + triflumezopyrim	0,1 + 1	92
Hợp chất theo sáng chế 444 + triflumezopyrim	1 + 1	88
Hợp chất theo sáng chế 444 + triflumezopyrim	1 + 0,1	60
Hợp chất theo sáng chế 445 + triflumezopyrim	1 + 0,1	73
Hợp chất theo sáng chế 445 + triflumezopyrim	0,1 + 1	80
Hợp chất theo sáng chế 445 + triflumezopyrim	1 + 1	100
Hợp chất theo sáng chế 464 + triflumezopyrim	0,01 + 1	64
Hợp chất theo sáng chế 467 + triflumezopyrim	0,1 + 1	84
Hợp chất theo sáng chế 467 + triflumezopyrim	0,01 + 1	72

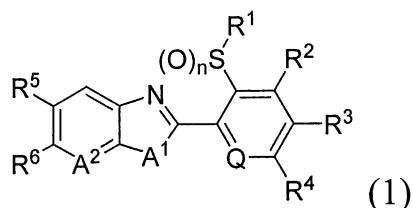
Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Sáng chế có thể phòng trừ các sinh vật gây hại.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại chứa:

hợp chất có công thức (1):



trong đó:

A^1 là $-NR^7-$, nguyên tử oxy, hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

A^2 là $=N-$, $=N(\rightarrow O)-$, hoặc $=CR^8-$,

Q là $=N-$ hoặc $=N(\rightarrow O)-$,

R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc nhóm được lựa chọn từ nhóm X,

R^2 , R^3 và R^4 là giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc các nhóm được chọn từ nhóm X, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}CO_2R^{11}$, $-NR^{10}C(O)R^{11}$, $-CO_2R^{10}$, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)NR^{10}R^{11}$, $-SF_5$, nhóm xyano, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro,

R^5 và R^6 là giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc các nhóm được chọn từ nhóm X, $-OR^{10}$, $-S(O)_mR^{10}$, $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}R^{11}$, $-NR^{10}CO_2R^{11}$, $-NR^{10}C(O)R^{11}$, $-CO_2R^{10}$, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)NR^{10}R^{11}$, $-OC(O)R^{10}$, $-SF_5$, nhóm xyano, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro (với điều kiện là R^5 và R^6 không đồng thời là nguyên tử hydro),

R^7 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc các

nhóm được chọn từ nhóm W, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{10}$, nhóm C3-C6 xycloalkyl, hoặc nguyên tử hydro,

R^8 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-\text{OR}^{10}$, $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, nhóm xyano, nhóm nitro, nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro,

R^{10} và R^{11} là giống nhau hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử hoặc các nhóm được chọn từ nhóm X, hoặc nguyên tử hydro (với điều kiện là trong $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, khi m là 1 hoặc 2, R^{10} không phải là nguyên tử hydro),

m độc lập với nhau là 0, 1 hoặc 2, và

n là 0, 1 hoặc 2,

nhóm X: nhóm bao gồm nhóm C1-C6 alkoxy tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc một hoặc nhiều nhóm C1-C3 alkyl, nhóm xyano, nhóm hydroxy, và nguyên tử halogen,

nhóm W: nhóm C1-C6 alkoxy tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm C3-C6 xycloalkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, nhóm hydroxy, nguyên tử halogen, hoặc nhóm xyano], và

muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin.

2. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó A^1 là $-\text{NMe}-$, nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh, A^2 là $=\text{N}-$, $=\text{N}(\rightarrow\text{O})-$, hoặc $=\text{CH}-$, R^1 là nhóm C1-C6 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, R^2 và R^4 là nguyên tử hydro, R^3 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, hoặc nguyên tử hydro, R^5 là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen, $-\text{OR}^{10}$, hoặc $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{10}$, R^6 là $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ hoặc nguyên tử hydro, và R^{10} và R^{11} độc lập với nhau

là nhóm C1-C3 alkyl tùy ý có một hoặc nhiều nguyên tử halogen.

3. Chế phẩm theo điểm 1 hoặc 2, trong đó A¹ là -NMe-.

4. Chế phẩm theo điểm 1 hoặc 2, trong đó A¹ là nguyên tử oxy.

5. Chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó tỷ lệ của hợp chất có công thức (1) với muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin nằm trong khoảng từ 100:1 đến 1:100 theo trọng lượng.

6. Chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó tỷ lệ của hợp chất có công thức (1) với muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrid[1,2-a]pyrimidin là nằm trong khoảng từ 10:1 đến 1:10 theo trọng lượng.

7. Phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại bao gồm bước phun lượng hữu hiệu của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 lên sinh vật gây hại hoặc nơi cư trú mà sinh vật gây hại sống.

8. Phương pháp phòng trừ các sinh vật gây hại bao gồm bước phun lượng hữu hiệu của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 lên cây trồng, hạt giống cây trồng, củ, hoặc đất trồng cây trồng.

9. Hạt giống của cây trồng, trong đó hạt giống này được bám dính một lượng hữu hiệu của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6.

10. Củ của cây trồng, trong đó củ này được bám dính một lượng hữu hiệu của chế phẩm phòng trừ các sinh vật gây hại theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6.