



(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)



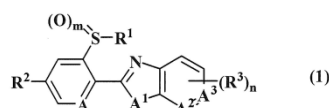
1-0031118

(51)⁸ C07D 401/04; A01N 43/76; A01N 43/78; A01N 43/90; A01P 7/04; A01N 43/54; C07D 413/04; C07D 417/04; C07D 471/04; C07D 498/04; C07D 513/04 (13) B

- (21) 1-2017-02994 (22) 29/01/2016
(86) PCT/JP2016/052841 29/01/2016 (87) WO 2016/121997 A1 04/08/2016
(30) 2015-015041 29/01/2015 JP; 2015-256132 28/12/2015 JP
(45) 25/02/2022 407 (43) 27/11/2017 356A
(73) NIHON NOHYAKU CO., LTD. (JP)
19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386 (JP)
(72) YONEMURA, Ikki (JP); SUWA, Akiyuki (JP); MATSUO, Soichiro (JP); AOKI, Takanori (JP).
(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG NGỪNG TỤ CÓ NHÓM XYCLOALKYLPYRIDYL HOẶC MUỐI CỦA CHÚNG, THUỐC TRỪ SÂU DÙNG CHO NÔNG NGHIỆP VÀ LÀM VƯỜN BAO GỒM HỢP CHẤT NÀY, VÀ PHƯƠNG PHÁP SỬ DỤNG THUỐC TRỪ SÂU NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến các thuốc trừ sâu dùng cho nông nghiệp và làm vườn trên cơ sở xem xét rằng tổn thất do côn trùng gây hại, v.v., gây ra vẫn lớn và vẫn có sự xuất hiện của côn trùng gây hại kháng thuốc trừ sâu trong trồng trọt trong các lĩnh vực nông nghiệp, làm vườn và tương tự. Sáng chế đề cập đến hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1):



trong đó, R¹ là nhóm etyl, R² là nhóm xycloalkyl, R³ là nhóm haloalkyl, mỗi A, A² và A³ là nguyên tử nitơ hoặc nhóm CH, A¹ là N-Me, m bằng 0 hoặc 2, và n bằng 1, hoặc muối của chúng; thuốc trừ sâu dùng cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính; và phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xycloalkylpyridyl hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính; và phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các loại hợp chất khác nhau đã được tìm hiểu khả năng làm thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn của chúng, và trong số chúng, các loại hợp chất dị vòng ngưng tụ nhất định được báo cáo là hữu ích để làm thuốc trừ sâu (ví dụ, xem các tài liệu sáng chế từ 1 đến 7). Không có tài liệu nào trong số các tài liệu viện dẫn này bộc lộ hợp chất bất kỳ có vòng dị vòng ngưng tụ liên kết với nhóm xycloalkylpyridyl.

Tài liệu đối chứng

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: JP-A 2009-280574

Tài liệu sáng chế 2: JP-A 2010-275301

Tài liệu sáng chế 3: JP-A 2011-79774

Tài liệu sáng chế 4: JP-A 2012-131780

Tài liệu sáng chế 5: WO 2012/086848

Tài liệu sáng chế 6: WO 2014/142292

Tài liệu sáng chế 7: WO 2015/715

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề kỹ thuật

Trong trồng trọt trong các lĩnh vực nông nghiệp, làm vườn và các lĩnh vực tương tự, tổn thất do côn trùng gây hại v.v... gây ra vẫn rất lớn, và đã xuất hiện côn

BẢO MẬT CẤP BẰNG:

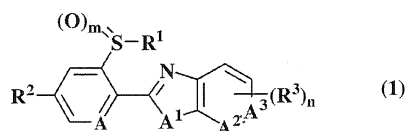
trùng gây hại kháng thuốc trừ sâu. Trong trường hợp này, mong muốn phát triển về các thuốc trừ sâu mới cho nông nghiệp và làm vườn.

Giải pháp cho vấn đề

Các tác giả sáng chế đã thực hiện nghiên cứu chuyên sâu để giải quyết các vấn đề nêu trên. Kết quả là, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xycloalkylpyridyl, v.v... được biểu diễn bởi công thức chung (1) hoặc muối của chúng có tác dụng kiểm soát ưu việt đối với côn trùng gây hại trong nông nghiệp và làm vườn, và hoàn thành sáng chế.

Có nghĩa là, sáng chế đề cập đến các hợp chất sau đây.

[1] Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1):



{trong đó R^1 là

- (a1) nhóm (C_1 - C_6) alkyl;
- (a2) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (a3) nhóm (C_2 - C_6) alkenyl; hoặc
- (a4) nhóm (C_2 - C_6) alkynyl,

R^2 là

- (b1) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b2) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkyl;
- (b3) nhóm halo (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkyl;
- (b4) nhóm (C_1 - C_6) alkylthio; hoặc
- (b5) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ
 - (a) nguyên tử halogen,
 - (b) nhóm xyano,
 - (c) nhóm xyano (C_1 - C_6) alkyl,
 - (d) nhóm formyl;
 - (e) nhóm hydroxy (C_1 - C_6) alkyl,

- (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,
- (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl,
- (k) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl (C₁-C₆) alkyl,
- (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl (C₁-C₆) alkyl,
- (m) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl,
- (n) nhóm carboxyl,
- (o) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (p) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (q) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (r) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (s) nhóm (C₃-C₆) xycloalkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (t) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (u) nhóm R⁵(R⁶)N (trong đó R⁵ và R⁶ có thể là giống hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl, hoặc nhóm di-(C₁-C₆) alkylaminocarbonyl (trong đó các nhóm alkyl của gốc di-(C₁-C₆) alkylamino có thể là giống hoặc khác nhau)),
- (v) nhóm R⁵(R⁶)N(C₁-C₆) alkyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),
- (w) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),
- (x) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên), và
- (y) nhóm C(R⁵)=NOR⁶ (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),

R³ là

- (C₁) nguyên tử halogen;
- (c2) nhóm xyano;
- (c3) nhóm nitơ;
- (c4) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

- (c5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (C₆) nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c7) nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c8) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c10) nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c11) nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;
- (c13) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl; hoặc
- (c17) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

mỗi A, A² và A³ là CH hoặc nguyên tử nito,

A¹ là O, S hoặc N-R⁴ (trong đó R⁴ là

- (d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (d2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (d3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl; hoặc
- (d4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl);

loại trừ trường hợp mà A¹ là N-R⁴ và cả hai A² và A³ là nguyên tử nito,

m bằng 0, 1 hoặc 2, và

n bằng 1 hoặc 2}, hoặc

muối của chúng.

[2] Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo mục [1] nêu trên,

trong đó R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² là

- (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (b4) nhóm (C₁-C₆) alkylthio; hoặc
- (b5) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ

- (b) nhóm xyano,
- (c) nhóm xyano (C₁-C₆) alkyl,
- (d) nhóm formyl,
- (e) nhóm hydroxy (C₁-C₆) alkyl,
- (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,
- (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
- (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl,
- (k) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl (C₁-C₆) alkyl,
- (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl (C₁-C₆) alkyl,
- (m) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl,
- (n) nhóm carboxyl,
- (o) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (p) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (q) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (r) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (s) nhóm (C₃-C₆) xycloalkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (t) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (u) nhóm R⁵(R⁶)N (trong đó R⁵ và R⁶ có thể là giống hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl, hoặc nhóm di-(C₁-C₆) alkylaminocarbonyl (trong đó các nhóm alkyl của gốc di-(C₁-C₆) alkylamino có thể là giống hoặc khác nhau)),
- (v) nhóm R⁵(R⁶)N(C₁-C₆) alkyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),
- (w) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),
- (x) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên), và
- (y) nhóm C(R⁵)=NOR⁶ (trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên),

R³ là

(c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl;

(c9) nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy;

(c12) nhóm (C_1-C_6) alkylthio; hoặc

(c15) nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio,

mỗi A , A^2 và A^3 là CH hoặc nguyên tử nitơ,

A^1 là O, S hoặc $N-R^4$ (trong đó R^4 là (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl),

loại trừ trường hợp mà A^1 là $N-R^4$ và cả hai A^2 và A^3 là nguyên tử nitơ,

m bằng 0, 1 hoặc 2, và

n bằng 1, hoặc

muối của chúng.

[3] Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo mục [1] nêu trên,

trong đó R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl,

R^2 là

(b1) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl; hoặc

(b5) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ

(b) nhóm xyano,

(n) nhóm carboxyl,

(o) nhóm (C_1-C_6) alkoxycarbonyl,

(t) nhóm (C_1-C_6) alkoxycarbonyloxy (C_1-C_6) alkyl, và

(w) nhóm $R^5(R^6)N$ carbonyl (trong đó R^5 và R^6 được xác định như trên),

R^3 là (c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl,

A , A^2 và A^3 là nguyên tử nitơ,

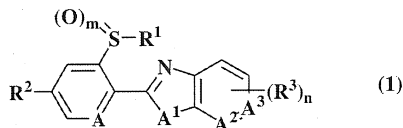
A^1 is $N-R^4$ (trong đó R^4 là (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl, loại trừ trường hợp mà cả hai A^2 và A^3 là nguyên tử nitơ),

m bằng 0 hoặc 2, và

n bằng 1, hoặc

muối của chúng.

[4] Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức:



{trong đó R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl; (a2) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl; (a3) nhóm (C_2-C_6) alkenyl; hoặc (a4) nhóm (C_2-C_6) alkynyl,

R^2 là (b1) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl; (b2) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl (C_1-C_6) alkyl; (b3) nhóm halo (C_3-C_6) xycloalkyl (C_1-C_6) alkyl; hoặc (b4) nhóm (C_1-C_6) alkylthio,

R^3 là (C1) nguyên tử halogen; (c2) nhóm xyano; (c3) nhóm nitơ; (c4) nhóm (C_1-C_6) alkyl; (c5) nhóm (C_1-C_6) alkoxy; (C6) nhóm (C_2-C_6) alkenyloxy; (c7) nhóm (C_2-C_6) alkynyloxy; (c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl; (c9) nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy; (C10) nhóm halo (C_2-C_6) alkenyloxy; (c11) nhóm halo (C_2-C_6) alkynyloxy; (c12) nhóm (C_1-C_6) alkylthio; (c13) nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl; (c14) nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl; (c15) nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio; (c16) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl; hoặc (c17) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl,

mỗi A, A^2 và A^3 là CH hoặc nguyên tử nitơ,

A^1 là O, S hoặc $N-R^4$ (trong đó R^4 là (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl; (d2) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl; (d3) nhóm (C_2-C_6) alkenyl; hoặc (d4) nhóm (C_2-C_6) alkynyl),

loại trừ trường hợp mà A^1 là $N-R^4$ và cả hai A^2 và A^3 là nguyên tử nitơ,

m bằng 0, 1 hoặc 2, và

n bằng 1 hoặc 2}.

[5] Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo mục [4] nêu trên,

trong đó R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl,

R^2 là (b1) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl; hoặc (b4) nhóm (C_1-C_6) alkylthio,

R^3 là (c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl; (c9) nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy; (c12) nhóm (C_1-C_6) alkylthio; hoặc (c15) nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio,

mỗi A, A^2 và A^3 là CH hoặc nguyên tử nitơ,

A^1 là $N-R^4$ (trong đó R^4 là (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl),

m bằng 0 hoặc 2, và

n bằng 1.

[6] Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo mục [4] nêu trên, trong đó R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl,

R^2 là (b1) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl,

R^3 là (c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl,

mỗi A, A^2 và A^3 là CH hoặc nguyên tử nitơ,

A^1 là O, S hoặc N- R^4 (trong đó R^4 là (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl),

m bằng 0 hoặc 2, và

n bằng 1.

[7] Thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] nêu trên làm thành phần hoạt tính.

[8] Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn, bao gồm xử lý cây hoặc đất bằng lượng hữu hiệu của hợp chất dị vòng ngưng tụ hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] nêu trên.

[9] Chất kiểm soát vật ký sinh ngoài bao gồm lượng hữu hiệu của hợp chất dị vòng ngưng tụ hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [6] nêu trên làm thành phần hoạt tính.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong phần định nghĩa về công thức chung (1) biểu diễn hợp chất dị vòng ngưng tụ của sáng chế hoặc muối của nó, “halo” dùng để chỉ “nguyên tử halogen” và là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom hoặc nguyên tử iot.

“Nhóm (C_1-C_6) alkyl” dùng để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm isobutyl, nhóm sec-butyl, nhóm tert-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm isopentyl, nhóm tert-pentyl, nhóm neopentyl, nhóm 2,3-dimethylpropyl, nhóm 1-ethylpropyl, nhóm 1-methylbutyl, nhóm 2-methylbutyl, nhóm n-hexyl, nhóm isohexyl, nhóm 2-hexyl, nhóm 3-hexyl, nhóm 2-methylpentyl, nhóm 3-methylpentyl, nhóm 1,1,2-trimethyl propyl, nhóm 3,3-dimethylbutyl hoặc tương tự.

“(C₃-C₆) nhóm xycloalkyl” dùng để chỉ nhóm xyclic alkyl có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl,

nhóm xyclohexyl hoặc tương tự. “(C₁-C₆) nhóm alkoxy” dùng để chỉ a nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm isopropoxy, nhóm n-butoxy, nhóm sec-butoxy, nhóm tert-butoxy, nhóm n-pentyloxy, nhóm isopentyloxy, nhóm tert-pentyloxy, nhóm neopentyloxy, nhóm 2,3-dimetylpropyloxy, nhóm 1-etylpropyloxy, nhóm 1-metylbutyloxy, nhóm n-hexyloxy, nhóm isohexyloxy, nhóm 1,1,2-trimetylpropyloxy hoặc tương tự. “(C₂-C₆) nhóm alkenyloxy” dùng để chỉ nhóm alkenyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenyloxy, nhóm butenyloxy, nhóm pentenyloxy, nhóm hexenyloxy hoặc tương tự. “(C₂-C₆) nhóm alkynyloxy” dùng để chỉ nhóm alkynyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynyloxy, nhóm butynyloxy, nhóm pentynyloxy, nhóm hexynyloxy hoặc tương tự.

“(C₁-C₆) nhóm alkylthio” dùng để chỉ nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylthio, nhóm ethylthio, nhóm n-propylthio, nhóm isopropylthio, nhóm n-butylthio, nhóm sec-butylthio, nhóm tert-butylthio, nhóm n-pentylthio, nhóm isopentylthio, nhóm tert-pentylthio, nhóm neopentylthio, nhóm 2,3-dimetylpropylthio, nhóm 1-etylpropylthio, nhóm 1-metylbutylthio, nhóm n-hexylthio, nhóm isohexylthio, nhóm 1,1,2-trimetylpropylthio hoặc tương tự. “(C₁-C₆) nhóm alkylsulfinyl” dùng để chỉ nhóm alkylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metylsulfinyl, nhóm etylsulfinyl, nhóm n-propylsulfinyl, nhóm isopropylsulfinyl, nhóm n-butylsulfinyl, nhóm sec-butylsulfinyl, nhóm tert-butylsulfinyl, nhóm n-pentylsulfinyl, nhóm isopentylsulfinyl, nhóm tert-pentylsulfinyl, nhóm neopentylsulfinyl, nhóm 2,3-dimetylpropylsulfinyl, nhóm 1-etylpropylsulfinyl, nhóm 1-metylbutylsulfinyl, nhóm n-hexylsulfinyl, nhóm isohexylsulfinyl, nhóm 1,1,2-trimetylpropylsulfinyl hoặc tương tự. “(C₁-C₆) nhóm alkylsulfonyl” dùng để chỉ nhóm alkylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metylsulfonyl, nhóm etylsulfonyl, nhóm n-propylsulfonyl, nhóm isopropylsulfonyl, nhóm n-butylsulfonyl, nhóm sec-butylsulfonyl, nhóm tert-butylsulfonyl, nhóm n-pentylsulfonyl, nhóm

isopentylsulfonyl, nhóm tert-pentylsulfonyl, nhóm neopentylsulfonyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfonyl, nhóm 1-ethylpropylsulfonyl, nhóm 1-methylbutylsulfonyl, nhóm n-hexylsulfonyl, nhóm isohexylsulfonyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl hoặc tương tự.

- “Nhóm (C₁-C₆) alkyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynyl,”
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkyl,”
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkyloxy,”
- “(C₁-C₆) nhóm alkoxy,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenyloxy,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynyloxy,”
- “(C₁-C₆) nhóm alkylthio,”
- “(C₁-C₆) nhóm alkylsulfinyl,”
- “(C₁-C₆) nhóm alkylsulfonyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenylthio,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynylthio,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenylsulfinyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynylsulfinyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenylsulfonyl,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynylsulfonyl,”
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkyl,”
- “(C₁-C₆) nhóm alkoxy,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkenyloxy,”
- “(C₂-C₆) nhóm alkynyloxy,”
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkylthio,”
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkylsulfinyl” hoặc
- “(C₃-C₆) nhóm xycloalkylsulfonyl”

có thể được thế bởi một hoặc nhiều nguyên tử halogen ở (các) vị trí thế được, và trong trường hợp mà nhóm liệt kê nêu trên được thế bởi hai hoặc nhiều nguyên tử

halogen, các nguyên tử halogen có thể là giống hoặc khác nhau.

Mỗi nhóm được nêu trên được thể bởi một hoặc nhiều nguyên tử halogen được biểu diễn là

- “nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynyl,”
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl,”
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyloxy,”
- “nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy,”
- “nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio,”
- “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl,”
- “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonfyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylthio,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylthio,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylsulfinyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylsulfinyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylsulfonfyl,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylsulfonfyl,”
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl,”
- “nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy,”
- “nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy,”
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylthio,”
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” và
- “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfonfyl”.

Mỗi cụm từ “(C₁-C₆),” “(C₂-C₆),” “(C₃-C₆),” v.v... là để chỉ khoảng số nguyên tử cacbon trong các nhóm thể. Định nghĩa tương tự được áp dụng cho các nhóm được ghép với nhóm thể nêu trên, và ví dụ, “nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl” có

nghĩa là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon được gắn với nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm 1 đến 6 nguyên tử cacbon.

Các ví dụ về muối của hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế bao gồm muối của axit vô cơ, như hydroclorua, sulfat, nitrat và phosphat; các muối của axit hữu cơ, như axetat, fumarat, maleat, oxalat, metanesulfonat, benzensulfonat và p-toluensulfonat; và các muối với bazơ vô cơ hoặc hữu cơ như ion natri, ion kali, ion canxi và ion trimetylammoni.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế và muối của chúng có thể có một hoặc nhiều tâm không đối xứng trong công thức cấu tạo, và có thể tồn tại dưới dạng hai hoặc nhiều đồng phân quang học hoặc đồng phân không đối quang. Tất cả đồng phân quang học và hỗn hợp của các đồng phân ở tỷ lệ bất kỳ cũng được kể đến trong sáng chế. Hơn nữa, hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế và muối của chúng có thể tồn tại dưới hai dạng là đồng phân hình học do liên kết đôi cacbon-cacbon trong công thức cấu tạo. Tất cả đồng phân hình học và hỗn hợp của các đồng phân ở tỷ lệ bất kỳ cũng được kể đến trong sáng chế.

Theo một phương án theo sáng chế, được ưu tiên là hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) trong đó

R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl,

R^2 là (b1) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl hoặc (b5) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ (b) nhóm xyano, (n) nhóm carboxyl, (o) nhóm (C_1-C_6) alkoxy carbonyl, (t) nhóm (C_1-C_6) alkoxy carbonyloxy (C_1-C_6) alkyl, và (w) nhóm $R^5(R^6)N$ carbonyl (trong đó R^5 và R^6 được xác định như trên),

R^3 là (c8) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl,

A, A^2 và A^3 là nguyên tử nito,

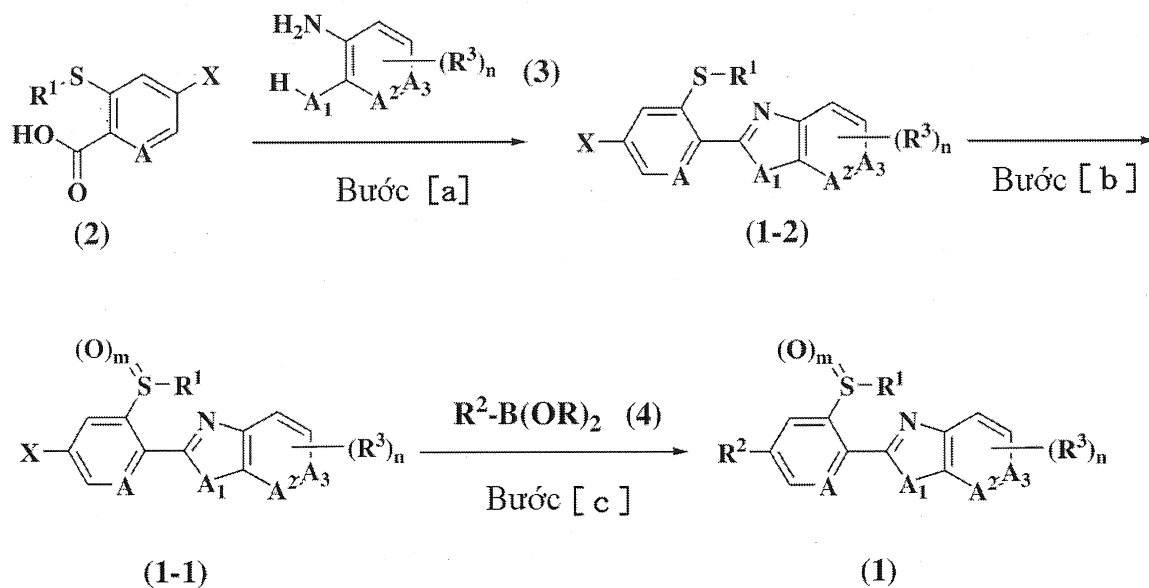
A^1 là $N-R^4$ (trong đó R^4 represents (d1) nhóm (C_1-C_6) alkyl, loại trừ trường hợp mà cả hai A^2 và A^3 là nguyên tử nito),

m là 0 hoặc 2, và

n là 1, hoặc
muối của chúng.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo sáng chế hoặc muối của chúng có thể được điều chế theo, ví dụ, phương pháp điều chế được mô tả dưới đây, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở đó.

Phương pháp điều chế 1



{Trong công thức, R^1 , R^2 , R^3 , m , n , A , A^1 , A^2 và A^3 được xác định như trên, X là nguyên tử halogen và R là nguyên tử hydro, nhóm (C_1 - C_3) alkyl, hoặc tương tự.}

Phương pháp điều chế theo bước [a]

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-2) có thể được điều chế bằng cách cho axit carboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2) phản ứng với hợp chất dị vòng được biểu diễn bởi công thức chung (3) trong sự có mặt của chất ngưng tụ, bazơ và dung môi trơ, và sau đó cho chất trung gian thu được, có hoặc không có sự tách ra của chúng, phản ứng dưới các điều kiện axit.

Các ví dụ về chất ngưng tụ được sử dụng trong phản ứng này bao gồm diethyl phosphoxyanidat (DEPC), carbonyldiimidazol (CDI), 1,3-dicyclohexylcarbodiimide (DCC), các este clocarbonic và 2-clo-1-metylpyridini iodua. Lượng chất ngưng tụ được sử dụng được chọn thích hợp từ khoảng gấp từ 1 đến 1,5 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (2).

Các ví dụ về bazơ được sử dụng bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit,

kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit của kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; các amin bậc ba như trietylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimetyl aminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng gấp từ 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (2).

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm tiến trình phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; các hydrocarbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete, dioxan và tetrahydrofuran; các este như etyl axetat; các amit như dimetylformamit và dimetylacetamit; các keton như axeton và metyl etyl keton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

Do phản ứng này là phản ứng đẳng mol của các chất phản ứng, nên chúng cơ bản được sử dụng trong các lượng đẳng mol, nhưng có thể là bất kỳ trong số các chất phản ứng này được sử dụng trong lượng dư. Nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ nhiệt độ trong phòng đến điểm sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất đang nói đến có thể được điều chế bằng cách cho chất trung gian, có hoặc không có sự tách ra của chúng khỏi hệ phản ứng, phản ứng trong sự có mặt của axit và dung môi trơ.

Các ví dụ về axit được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các axit vô cơ như axit hydrochloric, axit sulfuric và axit nitric; các axit hữu cơ như axit formic, axit axetic, axit propionic, axit trifloaxetic và axit benzoic; các axit sulfonic như axit metansufonic và axit triflometansufonic; axit phosphoric; v.v... Lượng axit

được sử dụng thích hợp được chọn từ khoảng gấp năm trong khoảng từ 0,01 đến 10 lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (2-2).

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm tiến trình của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete, dioxan và tetrahydrofuran; các este như etyl axetat; các amit như dimetylformamit và dimetylacetamit; các keton như axeton và metyl etyl keton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

Phương pháp điều chế theo bước [b]

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-1) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-2) phản ứng với chất oxi hóa trong dung môi trơ.

Các ví dụ về chất oxi hóa được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các peroxit như a dung dịch hydro peroxit, axit perbenzoic và axit m-cloperoxybenzoic. Lượng chất oxi hóa được sử dụng được chọn thích hợp nằm trong khoảng gấp từ 0,8 đến 5 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-2).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm phản ứng, và các ví dụ bao gồm các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, tetrahydrofuran và dioxan; các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như

clobenzen và diclobenzen; các nitril như axetonitril; các este như etyl axetat; các axit hữu cơ như axit formic và axit axetic ; và các dung môi phân cực như N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylacetamit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và nước. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này được chọn thích hợp từ khoảng là -10°C đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự và không giống nhau trong mọi trường hợp, nhưng về cơ bản được chọn thích hợp trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

Phương pháp điều chế theo bước [c]

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) có thể được điều chế bằng phản ứng ghép cặp chéo của hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-1) với hợp chất axit boric được biểu diễn bởi công thức chung (4) hoặc hợp chất tương đương (ví dụ, muối natri xyclopropylxyclic-triolborat) trong sự có mặt của xúc tác kim loại, bazơ và dung môi trơ theo phương pháp được mô tả trong Journal of Synthetic Organic Chemistry, Japan, Tập 69 số 7 2011; Chem. Rev. 2011, 4475; hoặc WO 2013/018928.

Các ví dụ về xúc tác mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các hợp chất paladi có sẵn trên thị trường như kim loại paladi hóa trị không và hai và muối (bao gồm các phức) của chúng, và các hợp chất paladi này có thể được hỗ trợ trên cacbon hoạt tính. Các ví dụ về hợp chất paladi ưu tiên bao gồm paladi(0)-carbon, paladi(II) axetat, paladi(II) clorua, bis(triphenylphosphin)paladi(II) clorua, và tetrakis(triphenylphosphin)paladi(0).

Phản ứng này còn có thể được thực hiện bằng việc bổ sung phối tử. Các ví dụ về phối tử bao gồm các phối tử phosphin như triphenylphosphin (PPh_3), metyldiphenylphosphin (Ph_2PCH_3), trifurylphosphin ($\text{P}(\text{2-furyl})_3$), tri(o-tolyl)phosphin ($\text{P}(\text{o-tol})_3$), tri(xyclohexyl)phosphin (PCy_3),

dicyclohexylphenylphosphin (PhPCy_2), tri(*t*-butyl)phosphin (P^tBu_3), 2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl (BINAP), diphenylphosphinoferroxen (DPPF), 1,1'-bis(di-*t*-butylphosphino)ferroxen (D^tBPF), *N,N*-dimetyl-1-[2-(diphenylphosphino)ferroxenyl]etylamin, ete của 1-[2-(diphenylphosphino)ferroxenyl]etyl metyl, và Xantphos; và các phối tử phosphin-mimic như imidazol-2-yliden carben (xem Tạp chí Angewandte Chemie International Edition Tiếng Anh, tập 36, 2163 (1997)).

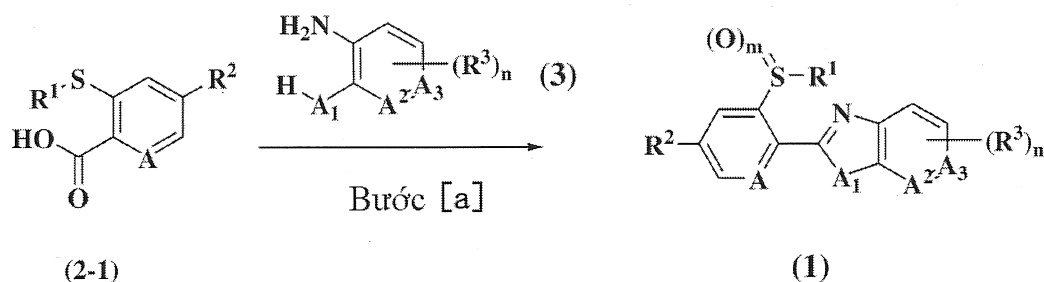
Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, xesi cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; các hydrua của kim loại kiềm như natri hydrua và kali hydrua; và các alkoxit như natri metoxit, natri etoxit và kali *tert*-butoxit. Lượng bazơ thường được sử dụng nằm trong khoảng gấp từ 1 đến 5 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (4).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm phản ứng, và các ví dụ bao gồm rượu như metanol, etanol, propanol, butanol và 2-propanol; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như ete dietyl, tetrahydrofuran và dioxan; các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các nitril như axetonitril; các este như etyl axetat; và các dung môi phân cực như *N,N*-dimetylformamit, *N,N*-dimetylacetamit, dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0°C đến điểm sôi của dung môi được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự, nhưng về cơ bản được chọn thích hợp trong khoảng thời gian từ vài phút đến 48 giờ. Hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (4) hoặc hợp chất tương đương thường được sử dụng trong khoảng gấp từ 1 đến 5 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất dị vòng ngưng tụ

được biểu diễn bởi công thức chung (1-1). Phản ứng này có thể được thực hiện trong khí quyển có khí trơ như khí nitơ và khí argon. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

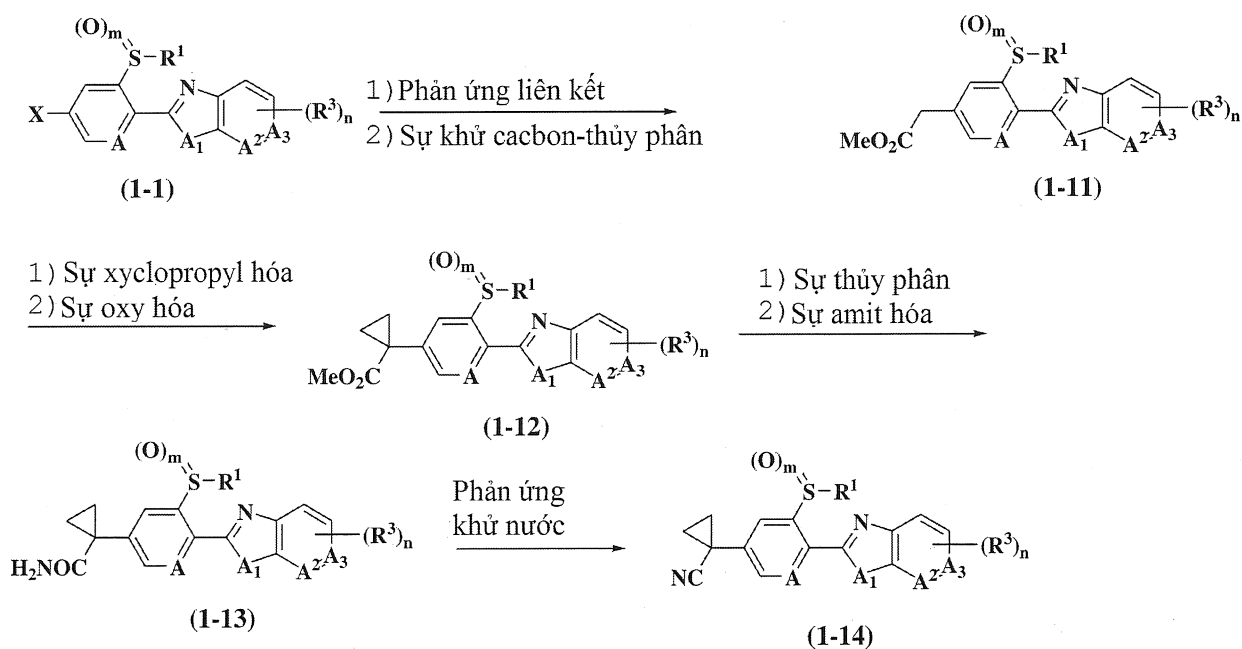
Phương pháp điều chế 2



{Trong công thức, R^1 , R^2 , R^3 , m , n , A , A^1 , A^2 và A^3 được xác định như trên.}

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) có thể được điều chế bằng cách cho axit carboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2-1) phản ứng với hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (3) theo phương pháp được nêu theo bước [a] và/hoặc bước [b].

Phương pháp điều chế 3



{Trong công thức, R^1 , R^2 , R^3 , m , n , A , A^1 , A^2 và A^3 được xác định như trên.}

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-11) có thể

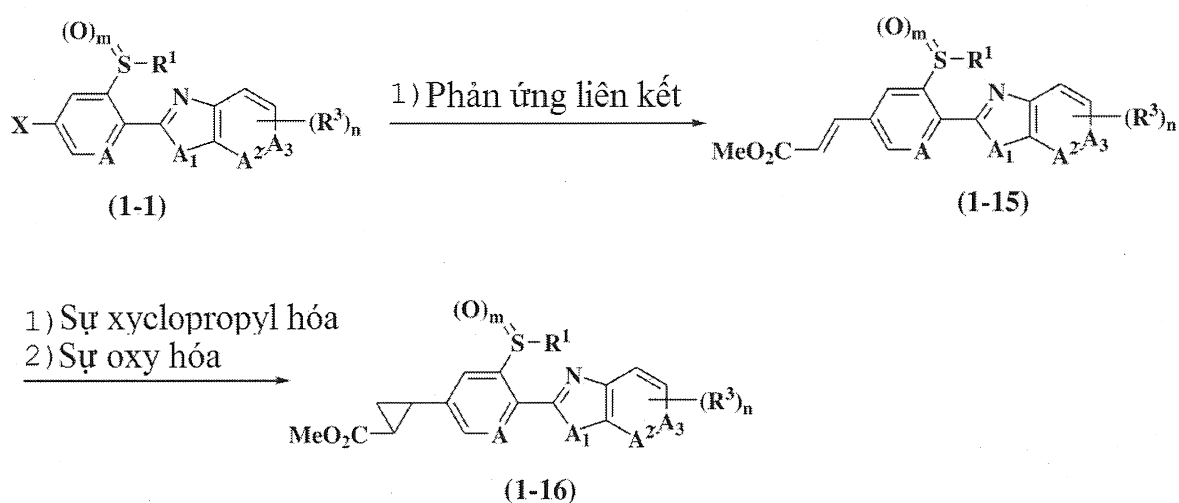
được điều chế bằng cách cho phản ứng ghép đôi của hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-1) với este malonic axit được tiến hành trong sự có mặt của xúc tác kim loại và bazơ trong dung môi trơ theo phương pháp được mô tả trong Organic Letters, Tập 9(17), 3469-3472, 2007, hoặc Angewandte Chemie International Edition, Tập 54(47), 13975-13979, 2015, và đưa sản phẩm vào thủy phân trong các điều kiện axit sau đó khử cacbon.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-12) có thể được tạo ra từ hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-11) theo phương pháp được mô tả trong WO 2014/113485, hoặc Journal of Medicinal Chemistry, 57(7), 2963-2988; 2014.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-13) có thể được điều chế bằng cách thủy phân hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-12) bằng phương pháp thông thường, cho sản phẩm phản ứng với chất clo hóa như thionyl clorua và oxalyl diclorua để tạo ra carboxylic clorua, và cho carboxylic clorua phản ứng với ammoni.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-14) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-13) phản ứng với chất clo hóa như phosphorus oxycloclorua bằng phương pháp thông thường.

Phương pháp điều chế 4



{Trong công thức, R^1 , R^2 , R^3 , m , n , A , A^1 , A^2 và A^3 được xác định như trên, và X là

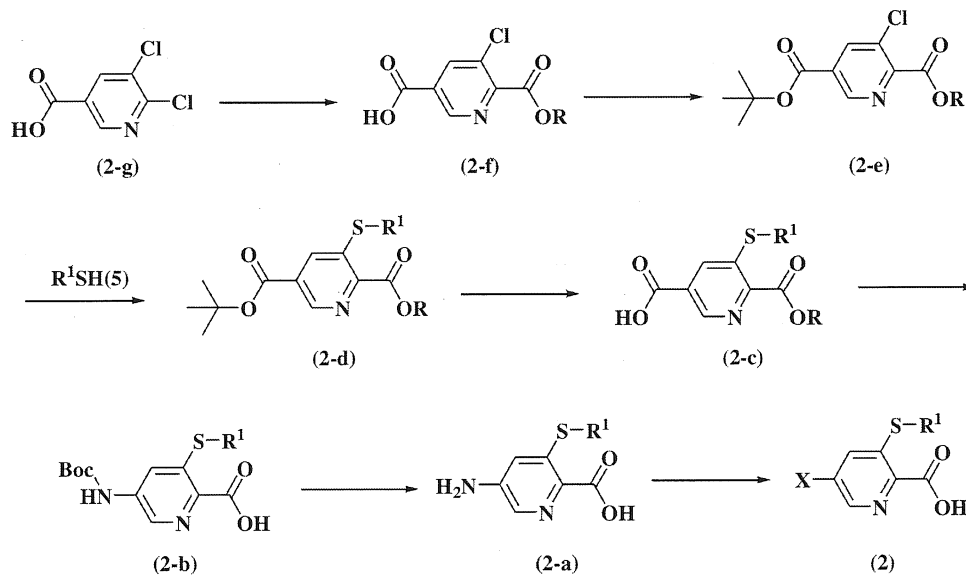
nhóm đi ra như nguyên tử halogen.}

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-15) có thể được tạo ra từ hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-1) theo phương pháp được mô tả trong Modern Arylation Methods, 221-269, Wiley-VCH.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-16) có thể được tạo ra từ hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-15) theo phương pháp được mô tả trong WO 2011/115065.

Các hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1-12) và (1-16) có nhóm metoxycarbonyl, và các nhóm chức này có thể được chuyển thành axit carboxylic và sau đó được đưa vào phản ứng chuyển vị Curtius để tạo ra hợp chất amin. Ngoài ra, nhóm metoxycarbonyl có thể bị khử bằng nhôm hydrua v.v... để tạo ra hợp chất rượu.

Phương pháp điều chế chất trung gian (2)



(Trong công thức, R¹ được xác định như trên, Boc là nhóm tert-butoxycarbonyl, R là nhóm (C₁-C₃) alkyl, và X là nguyên tử halogen.)

Chất trung gian được biểu diễn bởi công thức chung (2) được sử dụng để tạo ra hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế bằng phương pháp sau đây.

Hợp chất diclopyridinaxit carboxylic (2-g) có sẵn trên thị trường có thể phải

chịu việc đưa vào nhóm este bằng phản ứng Heck hoặc phương pháp được mô tả trong JP-A 2005-272338 để tổng hợp pyridinaxit carboxylic (2-f).

Để tổng hợp este pyridinaxit carboxylic (2-e), pyridinaxit carboxylic (2-f) có nhóm este được đưa vào có thể được clo hóa thứ nhất bằng chất clo hóa trong dung môi trơ để được chuyển thành pyridincarboxylic clorua.

Các ví dụ về dung môi được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các ete như THF, ete etylen glycol dimetyl, ete tert-butyl metyl và 1,4-dioxan; các hydrocarbon thơm như toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như diclometan và cloform; và hỗn hợp của chúng. Các ví dụ về chất clo hóa được sử dụng trong phản ứng này bao gồm thionyl clorua và oxalyl diclorua. Chất clo hóa có thể thường được sử dụng với lượng mol gấp từ 1 đến 10 lần lượng tương ứng với 1 mol của pyridinaxit carboxylic (2-f) có nhóm este được đưa vào. Nhiệt độ phản ứng thường nằm trong khoảng từ 0 đến 100°C. Thời gian phản ứng thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, dung môi và lượng dư của chất clo hóa được hóa hơi để tạo ra pyridincarboxylic clorua.

Sau đó hợp chất pyridincarboxylic clorua có thể được cho phép phản ứng với rượu tert-butyl trong sự có mặt của bazơ và dung môi trơ để tạo ra hợp chất este pyridin tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-e). Các ví dụ về dung môi được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các ete như THF, ete etylen glycol dimetyl, ete tert-butyl metyl và 1,4-dioxan; các hydrocarbon thơm như toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như diclometan và cloform; và hỗn hợp của chúng. Các ví dụ về bazơ được sử dụng trong phản ứng bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit của kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; các amin bậc ba như trietylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimetyl aminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng có thể thường nằm trong khoảng gấp từ 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của pyridincarboxylic clorua.

Hợp chất este pyridinaxit carboxylic (2-d) có thể được điều chế bằng cách cho

hợp chất este pyridin tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-e) phản ứng với hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (5) trong sự có mặt của dung môi trơ.

Các ví dụ về bazơ được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit của kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; các amin bậc ba như triethylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimethyl aminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng gấp từ 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất este tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-e). Trong trường hợp mà muối kiềm của hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (5) được sử dụng, bazơ cần không được sử dụng.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetrachlorua; các hydrocarbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như diethyl ete, methyl tert-butyl ete, dioxan và tetrahydrofuran; các este như etyl axetat; các amit như dimethylformamit và dimethylacetamit; các keton như axeton và methyl etyl keton; và các dung môi phân cực như dimethyl sulfoxit và 1,3-dimethyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

Do phản ứng này là phản ứng đẳng mol của các chất phản ứng, hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (5) và hợp chất este pyridin tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-e) được sử dụng cơ bản trong các lượng đẳng mol, nhưng chất phản ứng bất kỳ trong số các chất phản ứng này có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng nhiệt độ từ -10°C đến điểm sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản nằm trong khoảng thời gian từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

Hợp chất pyridinaxit carboxylic (2-c) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng của hợp chất este pyridin tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-d) được thực hiện trong sự có mặt của axit và/hoặc dung môi trơ.

Các ví dụ về axit được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các axit vô cơ như axit clohydric, axit sulfuric và axit nitric; các axit hữu cơ như axit formic, axit axetic, axit propionic, axit trifloaxetic và axit benzoic; các axit sulfonic như axit metansufonic và trifloaxit metansufonic; v.v... Lượng axit được sử dụng được chọn thích hợp trong khoảng gấp từ 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất este tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-d). Trong một số trường hợp, axit có thể được sử dụng làm dung môi.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclohua; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete, dioxan và tetrahydrofuran; các este như etyl axetat; các amit như dimetylformamit và dimetylacetamit; các keton như axeton và metyl etyl keton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại. Trong các trường hợp mà axit được sử dụng làm dung môi, dung môi trơ không cần được sử dụng.

Nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng nhiệt độ từ nhiệt độ trong phòng đến điểm sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản nằm trong khoảng thời gian từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến

có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

Hợp chất pyridinaxit carboxylic (2-b) có thể được điều chế bằng cách cho pyridinaxit carboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2-c) phản ứng với DPPA (diphenylphosphoryl azide) trong sự có mặt của tert-butyl alcohol theo phương pháp được mô tả trong J. A. Chem. Soc. 1972, 94, 6203-6205.

Hợp chất aminopyridinaxit carboxylic (2-a) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng của hợp chất pyridinaxit carboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2-b) vào thực hiện trong sự có mặt của axit và dung môi trơ.

Các ví dụ về axit được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các axit vô cơ như axit clohydric, axit sulfuric và axit nitric; các axit hữu cơ như axit formic, axit axetic, axit propionic, axit trifloaxetic và axit benzoic; các axit sulfonic như axit metansufonic và trifloaxit metansufonic; v.v... Lượng axit được sử dụng được chọn thích hợp trong khoảng gấp từ 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với lượng mol của hợp chất este tert-butyl được biểu diễn bởi công thức chung (2-d). Trong một số trường hợp, axit có thể được sử dụng làm dung môi.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ trừ khi nó làm chậm tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocarbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocarbon được halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete, dioxan và tetrahydrofuran; các este như etyl axetat; các amit như dimetylformamit và dimetylacetamit; các keton như axeton và metyl etyl keton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn hoặc là hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại.

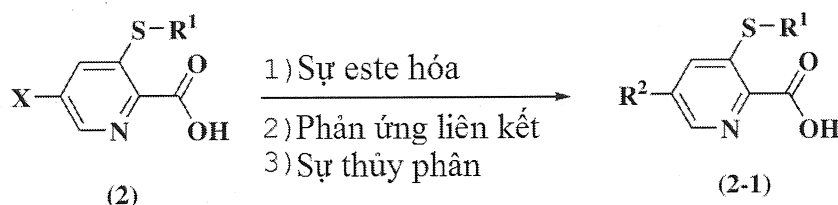
Nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng nhiệt độ từ -10°C đến điểm sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản nằm trong khoảng thời gian từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng hoàn thành, hợp chất đang nói đến được tách ra khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, hợp chất đang nói đến

có thể được tinh chế bằng phương pháp tái kết tinh, sắc ký cột, v.v...

Hợp chất halopyridinaxit carboxylic (2) có thể được tạo ra từ hợp chất axit aminpyridincarboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2-a) bằng phản ứng được gọi là Sandmeyer hoặc theo phương pháp được mô tả trong Chem. Rev. 1988, 88, 765.

Phương pháp điều chế chất trung gian (2-1)

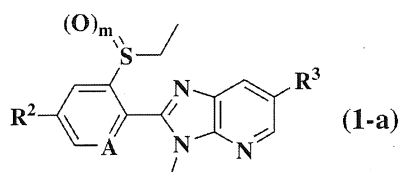


Hợp chất este halopyridinaxit carboxylic (2-1) có thể được điều chế bằng chuyển hợp chất pyridinaxit carboxylic được biểu diễn bởi công thức chung (2) thành hợp chất este bằng phương pháp thông thường, sau đó phản ứng ghép đôi được thực hiện theo phương pháp được mô tả trong Bước [c] nêu trên, và đưa sản phẩm vào thủy phân bằng phương pháp thông thường.

Phương pháp điều chế chất trung gian (3)

Hợp chất của chất trung gian được biểu diễn bởi công thức chung (3) để thực hiện là hợp chất đã biết và có thể được điều chế bằng phương pháp được mô tả trong WO 2012/086848 hoặc WO 2014/142135.

Tiếp theo, các ví dụ cụ thể về hợp chất theo sáng chế được thể hiện dưới đây. Trong các bảng sau đây, Me là nhóm metyl, Et là nhóm etyl, i-Pr là nhóm isopropyl, c-Pr là nhóm xyclopropyl, t-Bu là nhóm tert-butyl, c-Bu là nhóm xyclobutyl và c-Pent là nhóm xyclopentyl. Ac là nhóm axetyl. Tính chất vật lý là điểm nóng chảy (°C) hoặc NMR. Dữ liệu được liệt kê riêng biệt trong bảng dưới đây.



Bảng 1

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
1-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
1-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
1-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
1-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
1-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
1-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
1-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
1-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
1-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
1-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
1-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
1-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
1-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
1-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
1-15	c-Pr	CF ₃	N	2	NMR
1-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	NMR
1-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
1-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	NMR

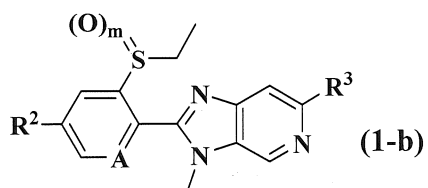
Bảng 1 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
1-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
1-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
1-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
1-22	SMe	CF ₃	CH	0	
1-23	SMe	CF ₃	CH	1	
1-24	SMe	CF ₃	CH	2	
1-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
1-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
1-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
1-28	SMe	SCF ₃	N	0	
1-29	SMe	SCF ₃	N	1	
1-30	SMe	SCF ₃	N	2	
1-31	SMe	CF ₃	N	0	
1-32	SMe	CF ₃	N	1	
1-33	SMe	CF ₃	N	2	
1-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
1-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

1-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--

Bảng 1 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
1-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
1-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
1-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
1-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
1-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
1-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
1-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
1-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
1-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
1-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
1-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
1-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



Bảng 2

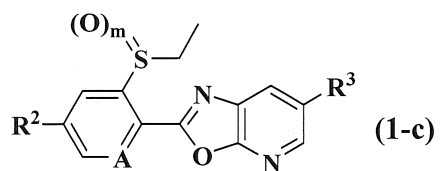
Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
2-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
2-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
2-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
2-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
2-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
2-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
2-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
2-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
2-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
2-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
2-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
2-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
2-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
2-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
2-15	c-Pr	CF ₃	N	2	169-173
2-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
2-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
2-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 2 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
2-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
2-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
2-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
2-22	SMe	CF ₃	CH	0	
2-23	SMe	CF ₃	CH	1	
2-24	SMe	CF ₃	CH	2	
2-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
2-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
2-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
2-28	SMe	SCF ₃	N	0	
2-29	SMe	SCF ₃	N	1	
2-30	SMe	SCF ₃	N	2	
2-31	SMe	CF ₃	N	0	
2-32	SMe	CF ₃	N	1	
2-33	SMe	CF ₃	N	2	
2-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
2-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
2-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 2 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
2-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
2-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
2-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
2-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
2-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
2-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
2-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
2-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
2-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
2-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
2-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
2-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



Bảng 3

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
3-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
3-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
3-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
3-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
3-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
3-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
3-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
3-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
3-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
3-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
3-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
3-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
3-13	c-Pr	CF ₃	N	0	NMR
3-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
3-15	c-Pr	CF ₃	N	2	140-141
3-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
3-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
3-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

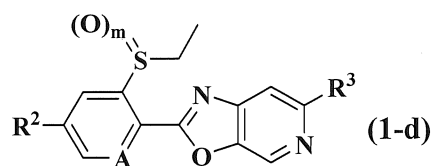
Bảng 3 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
3-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
3-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
3-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
3-22	SMe	CF ₃	CH	0	
3-23	SMe	CF ₃	CH	1	
3-24	SMe	CF ₃	CH	2	
3-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
3-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
3-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
3-28	SMe	SCF ₃	N	0	
3-29	SMe	SCF ₃	N	1	
3-30	SMe	SCF ₃	N	2	
3-31	SMe	CF ₃	N	0	
3-32	SMe	CF ₃	N	1	
3-33	SMe	CF ₃	N	2	
3-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
3-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

3-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--

Bảng 3 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
3-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
3-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
3-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
3-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
3-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
3-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
3-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
3-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
3-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
3-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
3-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
3-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



Bảng 4

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
4-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
4-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
4-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
4-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
4-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
4-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
4-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
4-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
4-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
4-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
4-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
4-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
4-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
4-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
4-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
4-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
4-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
4-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

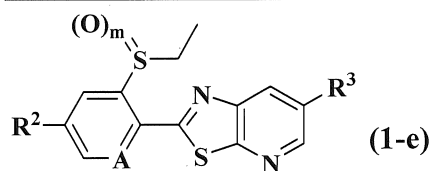
Bảng 4 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
4-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
4-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
4-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
4-22	SMe	CF ₃	CH	0	
4-23	SMe	CF ₃	CH	1	
4-24	SMe	CF ₃	CH	2	
4-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
4-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
4-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
4-28	SMe	SCF ₃	N	0	
4-29	SMe	SCF ₃	N	1	
4-30	SMe	SCF ₃	N	2	
4-31	SMe	CF ₃	N	0	
4-32	SMe	CF ₃	N	1	
4-33	SMe	CF ₃	N	2	
4-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
4-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

4-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--

Bảng 4 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
4-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
4-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
4-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
4-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
4-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
4-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
4-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
4-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
4-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
4-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
4-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
4-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



Bảng 5

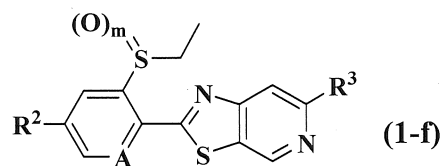
Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
5-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
5-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
5-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
5-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
5-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
5-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
5-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
5-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
5-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
5-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
5-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
5-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
5-13	c-Pr	CF ₃	N	0	177-178
5-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
5-15	c-Pr	CF ₃	N	2	140-141
5-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
5-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
5-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 5 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
5-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
5-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
5-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
5-22	SMe	CF ₃	CH	0	
5-23	SMe	CF ₃	CH	1	
5-24	SMe	CF ₃	CH	2	
5-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
5-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
5-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
5-28	SMe	SCF ₃	N	0	
5-29	SMe	SCF ₃	N	1	
5-30	SMe	SCF ₃	N	2	
5-31	SMe	CF ₃	N	0	
5-32	SMe	CF ₃	N	1	
5-33	SMe	CF ₃	N	2	
5-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
5-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
5-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 5 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
5-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
5-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
5-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
5-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
5-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
5-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
5-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
5-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
5-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
5-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
5-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
5-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



Bảng 6

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
6-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
6-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
6-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
6-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
6-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
6-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
6-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
6-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
6-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
6-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
6-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
6-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
6-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
6-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
6-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
6-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
6-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
6-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

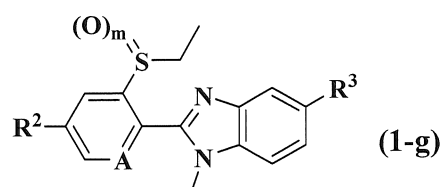
Bảng 6 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
6-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
6-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
6-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
6-22	SMe	CF ₃	CH	0	
6-23	SMe	CF ₃	CH	1	
6-24	SMe	CF ₃	CH	2	
6-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
6-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
6-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
6-28	SMe	SCF ₃	N	0	
6-29	SMe	SCF ₃	N	1	
6-30	SMe	SCF ₃	N	2	
6-31	SMe	CF ₃	N	0	
6-32	SMe	CF ₃	N	1	
6-33	SMe	CF ₃	N	2	
6-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
6-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

6-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--

Bảng 6 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
6-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
6-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
6-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
6-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
6-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
6-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
6-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
6-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
6-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
6-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
6-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
6-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



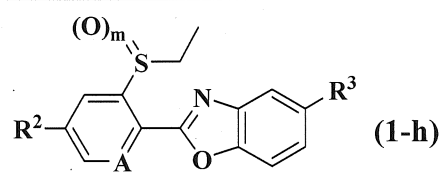
Bảng 7

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
7-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
7-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
7-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
7-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
7-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
7-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
7-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
7-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
7-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
7-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
7-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
7-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
7-13	c-Pr	CF ₃	N	0	NMR
7-14	c-Pr	CF ₃	N	1	192-193
7-15	c-Pr	CF ₃	N	2	88-90
7-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
7-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
7-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 7 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
7-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
7-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
7-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
7-22	SMe	CF ₃	CH	0	
7-23	SMe	CF ₃	CH	1	
7-24	SMe	CF ₃	CH	2	
7-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
7-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
7-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
7-28	SMe	SCF ₃	N	0	
7-29	SMe	SCF ₃	N	1	
7-30	SMe	SCF ₃	N	2	
7-31	SMe	CF ₃	N	0	
7-32	SMe	CF ₃	N	1	
7-33	SMe	CF ₃	N	2	
7-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
7-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

7-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--



Bảng 8

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
8-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
8-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
8-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
8-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
8-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
8-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
8-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
8-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
8-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
8-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	128,6-133,6
8-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
8-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	118,4-121,4
8-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
8-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
8-15	c-Pr	CF ₃	N	2	NMR
8-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	135,7-137,0
8-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
8-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	131,4-132,6

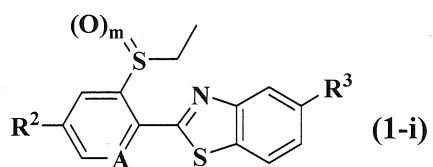
Bảng 8 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
8-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
8-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
8-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
8-22	SMe	CF ₃	CH	0	
8-23	SMe	CF ₃	CH	1	
8-24	SMe	CF ₃	CH	2	
8-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
8-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
8-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
8-28	SMe	SCF ₃	N	0	
8-29	SMe	SCF ₃	N	1	
8-30	SMe	SCF ₃	N	2	
8-31	SMe	CF ₃	N	0	
8-32	SMe	CF ₃	N	1	
8-33	SMe	CF ₃	N	2	
8-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
8-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	

8-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	
------	-----	---------------------------------	---	---	--

Bảng 8 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
8-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
8-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
8-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
8-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
8-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
8-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
8-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
8-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
8-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
8-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
8-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
8-48	c-Pen	CF ₃	N	2	



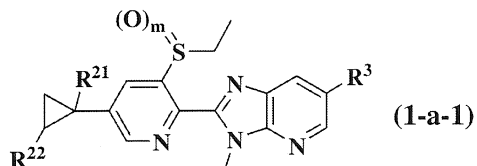
Bảng 9

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
9-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
9-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
9-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
9-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
9-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
9-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
9-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
9-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
9-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
9-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	148-149
9-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
9-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	198-199
9-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
9-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
9-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
9-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
9-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
9-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

Bảng 9 (Tiếp theo)

Số hợp chất	R ²	R ³	A	m	Tính chất vật lý
9-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
9-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
9-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
9-22	SMe	CF ₃	CH	0	
9-23	SMe	CF ₃	CH	1	
9-24	SMe	CF ₃	CH	2	
9-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
9-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
9-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
9-28	SMe	SCF ₃	N	0	
9-29	SMe	SCF ₃	N	1	
9-30	SMe	SCF ₃	N	2	
9-31	SMe	CF ₃	N	0	
9-32	SMe	CF ₃	N	1	
9-33	SMe	CF ₃	N	2	
9-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
9-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
9-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

Số hợp chất	Dữ liệu $^1\text{H-NMR}$
1-15	8,74(d, 2H), 8,28(d, 1H), 8,07(d,1H), 3,85(s, 3H), 3,79(dd, 2H), 2,17-2,09(m, 1H), 1,34(t, 3H), 1,31-1,24(m, 2H), 0,98-0,94(m, 2H)
1-16	8,65(d, 1H), 8,35(d, 1H), 8,28(d,1H), 7,40(d, 1H), 4,02(s, 3H), 2,95(dd, 2H), 2,02-1,97(m, 1H), 1,31(t, 3H), 1,18-1,13(m, 2H), 0,92-0,85(m, 2H)
1-18	8,74(d, 1H), 8,69(d, 1H), 8,26(d,1H), 8,07(d, 1H), 3,85(s, 3H), 3,80(dd, 2H), 2,17-2,09(m, 1H), 1,35(t, 3H), 1,31-1,25(m, 2H), 0,99-0,94(m, 2H)
3-13	8,71-8,72 (d,1H), 8,42-8,43(d,1H), 8,34-8,35 (d,1H), 7,37-7,38 (d,1H), 3,04-3,06(q,2H), 1,98-2,05 (m,1H), 1,44-1,47 (t,3H), 1,18-1,21 (m,2H), 0,88-0,90 (m,2H)
7-13	8,26-8,27 (d,1H), 8,16 (s,1H), 7,59-7,60 (dd,1H), 7,48-7,50 (d,1H), 7,37-7,38 (d,1H), 3,90 (s,3H), 2,89-2,94 (q,2H), 1,95-,2,02 (m,1H), 1,29-1,33 (d,3H), 1,11-1,17 (m,2H), 0,82-0,86 (m,2H)
8-15	8,76(d, 1H), 8,12 (m, 2H), 7,78-7,73 (m, 2H), 4,01 (q, 2H), 2,16-2,09 (m, 1H), 1,42 (t, 3H), 1,31-1,25 (m, 2H), 0,99-0,96 (m, 2H)
11-1	8,87 (brs, 1H), 8,76 (brs, 1H), 8,47 (brs, 1H), 8,35 (brs, 1H), 3,83-3,71 (brm, 5H), 1,77 (brs, 2H), 1,27-1,11 (brm, 5H),



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	NMR
11-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	166-167
11-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	131-133
11-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	215-218
11-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
11-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
11-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	192-194
11-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
11-13	CN	H	CF ₃	2	176-177
11-14	CHO	H	CF ₃	2	80-82
11-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
11-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	92-94
11-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
11-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
11-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
11-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
11-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
11-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
11-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	82-83
11-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
11-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
11-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
11-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
11-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
11-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
11-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
11-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
11-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
11-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
11-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
11-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
11-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
11-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
11-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
11-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	194-195
11-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
11-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
11-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	82-83
11-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
11-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
11-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
11-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-60	NH ₂	H	CF ₃	2	83-86
11-61	NHMe	H	CF ₃	2	
11-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-68	NHAc	H	CF ₃	2	240-241
11-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
11-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	101-102
11-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
11-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
11-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
11-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	158-159

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	190-192
11-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	164-165
11-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
11-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	160-164
11-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
11-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
11-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
11-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
11-93	H	CN	CF ₃	2	70-72
11-94	H	CHO	CF ₃	2	50-52
11-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
11-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	77-80
11-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
11-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
11-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
11-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
11-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
11-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
11-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
11-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
11-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
11-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
11-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
11-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
11-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
11-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
11-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
11-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
11-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
11-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
11-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

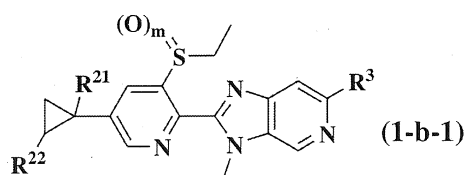
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
11-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
11-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
11-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
11-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
11-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
11-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
11-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
11-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
11-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
11-131	H	CH=NOme	CF ₃	2	50-51
11-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
11-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
11-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
11-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
11-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-140	H	NH ₂	CF ₃	2	54-55
11-141	H	NHMe	CF ₃	2	68-70
11-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
11-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
11-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-148	H	NHAc	CF ₃	2	72-74
11-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
11-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
11-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
11-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
11-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
11-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
11-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
11-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
11-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
11-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
11-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
11-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-173	CN	H	SCF ₃	2	
11-174	CHO	H	SCF ₃	2	
11-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
11-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
11-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
11-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
11-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
11-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
11-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
11-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
11-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
11-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
11-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
11-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
11-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
11-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
11-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
11-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
11-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
11-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
11-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
11-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
11-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
11-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
11-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
11-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
11-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
11-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
11-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
11-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
11-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
11-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
11-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
11-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
11-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
11-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
11-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
11-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
11-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
11-253	H	CN	SCF ₃	2	
11-254	H	CHO	SCF ₃	2	
11-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
11-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
11-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
11-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
11-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
11-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
11-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
11-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
11-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
11-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
11-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
11-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
11-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
11-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
11-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
11-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
11-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
11-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
11-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
11-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
11-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
11-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
11-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
11-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
11-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
11-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
11-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
11-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
11-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
11-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
11-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
11-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
11-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
11-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
11-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
11-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
11-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
11-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
11-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
11-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
11-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
11-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
11-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
11-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
11-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
11-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
11-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	217-221
12-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	172-174
12-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
12-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	207-211
12-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
12-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
12-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
12-13	CN	H	CF ₃	2	196-200
12-14	CHO	H	CF ₃	2	
12-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
12-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
12-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
12-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
12-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
12-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
12-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
12-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
12-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
12-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
12-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
12-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
12-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
12-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
12-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
12-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
12-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
12-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
12-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
12-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
12-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
12-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
12-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
12-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
12-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
12-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
12-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
12-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
12-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
12-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
12-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
12-61	NHMe	H	CF ₃	2	
12-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-68	NHAc	H	CF ₃	2	
12-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
12-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
12-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
12-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
12-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
12-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
12-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
12-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
12-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
12-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
12-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
12-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
12-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
12-93	H	CN	CF ₃	2	
12-94	H	CHO	CF ₃	2	
12-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
12-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
12-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
12-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
12-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
12-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
12-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
12-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
12-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
12-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
12-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
12-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
12-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
12-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
12-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
12-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
12-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
12-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
12-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
12-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
12-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
12-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
12-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
12-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
12-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
12-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
12-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
12-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
12-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
12-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
12-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
12-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
12-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
12-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
12-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
12-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
12-141	H	NHMe	CF ₃	2	
12-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
12-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
12-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-148	H	NHAc	CF ₃	2	
12-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
12-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
12-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
12-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
12-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
12-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
12-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
12-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

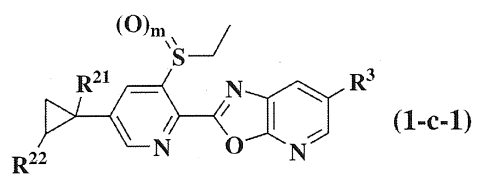
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
12-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
12-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
12-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
12-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-173	CN	H	SCF ₃	2	
12-174	CHO	H	SCF ₃	2	
12-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
12-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
12-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
12-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
12-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
12-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
12-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
12-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
12-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
12-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
12-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
12-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
12-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
12-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
12-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
12-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
12-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
12-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
12-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
12-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
12-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
12-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
12-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
12-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
12-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
12-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
12-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
12-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
12-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
12-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
12-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
12-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
12-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
12-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
12-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
12-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
12-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
12-253	H	CN	SCF ₃	2	
12-254	H	CHO	SCF ₃	2	
12-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
12-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
12-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
12-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
12-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
12-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
12-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
12-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
12-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
12-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
12-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
12-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
12-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
12-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
12-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
12-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
12-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
12-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
12-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
12-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
12-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
12-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
12-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
12-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
12-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
12-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
12-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
12-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
12-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
12-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
12-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
12-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
12-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
12-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
12-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
12-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
12-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
12-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
12-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
12-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
12-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
12-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
12-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
12-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
12-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
12-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
12-321	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
12-322	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-323	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-324	H	NHCONHMe	SCF ₃	2	
12-325	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
12-326	H	N(CONHMe)Me	SCF ₃	2	
12-327	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
13-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
13-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
13-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
13-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
13-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
13-13	CN	H	CF ₃	2	
13-14	CHO	H	CF ₃	2	
13-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
13-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
13-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
13-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
13-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
13-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
13-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
13-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
13-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
13-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
13-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
13-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
13-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
13-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
13-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
13-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
13-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
13-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
13-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
13-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
13-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
13-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
13-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
13-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
13-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
13-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
13-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
13-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
13-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
13-61	NHMe	H	CF ₃	2	
13-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-68	NHAc	H	CF ₃	2	
13-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
13-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
13-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
13-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
13-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
13-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
13-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
13-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
13-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
13-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
13-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
13-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
13-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
13-93	H	CN	CF ₃	2	
13-94	H	CHO	CF ₃	2	
13-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
13-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
13-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
13-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
13-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
13-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
13-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
13-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
13-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
13-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
13-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
13-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
13-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
13-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
13-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
13-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
13-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
13-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
13-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
13-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
13-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

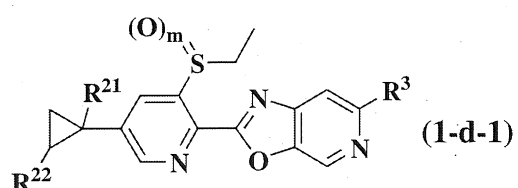
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
13-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
13-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
13-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
13-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
13-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
13-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
13-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
13-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
13-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
13-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
13-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
13-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
13-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
13-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
13-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
13-141	H	NHMe	CF ₃	2	
13-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
13-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
13-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-148	H	NHAc	CF ₃	2	
13-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
13-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
13-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
13-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
13-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
13-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
13-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
13-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
13-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
13-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
13-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
13-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-173	CN	H	SCF ₃	2	
13-174	CHO	H	SCF ₃	2	
13-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
13-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
13-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
13-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
13-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
13-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
13-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
13-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
13-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
13-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
13-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
13-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
13-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
13-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
13-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
13-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
13-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
13-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
13-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
13-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
13-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
13-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
13-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
13-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
13-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
13-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
13-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
13-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
13-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
13-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
13-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
13-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
13-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
13-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
13-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
13-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
13-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
13-253	H	CN	SCF ₃	2	
13-254	H	CHO	SCF ₃	2	
13-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
13-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
13-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
13-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
13-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
13-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
13-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
13-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
13-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
13-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
13-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
13-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
13-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
13-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
13-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
13-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
13-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
13-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
13-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
13-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
13-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
13-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
13-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
13-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
13-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
13-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
13-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
13-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
13-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
13-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
13-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
13-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
13-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
13-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
13-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
13-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
13-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
13-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
13-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
13-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
13-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
13-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
13-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
13-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
13-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
13-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
13-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
14-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
14-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
14-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
14-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
14-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
14-13	CN	H	CF ₃	2	
14-14	CHO	H	CF ₃	2	
14-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
14-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
14-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
14-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
14-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
14-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
14-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
14-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
14-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
14-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
14-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
14-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
14-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
14-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
14-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
14-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
14-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
14-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
14-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
14-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
14-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
14-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
14-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
14-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
14-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
14-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
14-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
14-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
14-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
14-61	NHMe	H	CF ₃	2	
14-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-68	NHAc	H	CF ₃	2	
14-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
14-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
14-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
14-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
14-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
14-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
14-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
14-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
14-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
14-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
14-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
14-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
14-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
14-93	H	CN	CF ₃	2	
14-94	H	CHO	CF ₃	2	
14-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
14-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
14-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
14-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
14-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
14-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
14-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
14-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
14-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
14-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
14-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
14-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
14-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
14-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
14-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
14-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
14-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
14-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
14-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
14-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
14-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

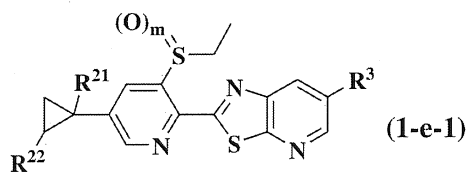
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
14-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
14-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
14-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
14-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
14-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
14-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
14-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
14-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
14-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
14-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
14-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
14-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
14-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
14-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
14-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
14-141	H	NHMe	CF ₃	2	
14-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
14-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
14-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-148	H	NHAc	CF ₃	2	
14-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
14-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
14-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
14-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
14-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
14-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
14-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
14-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
14-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
14-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
14-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
14-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-173	CN	H	SCF ₃	2	
14-174	CHO	H	SCF ₃	2	
14-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
14-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
14-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
14-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
14-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
14-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
14-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
14-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
14-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
14-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
14-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
14-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
14-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
14-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
14-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
14-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
14-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
14-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
14-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
14-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
14-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
14-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
14-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
14-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
14-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
14-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
14-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
14-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
14-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
14-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
14-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
14-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
14-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
14-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
14-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
14-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
14-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
14-253	H	CN	SCF ₃	2	
14-254	H	CHO	SCF ₃	2	
14-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
14-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
14-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
14-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
14-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
14-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
14-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
14-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
14-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
14-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
14-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
14-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
14-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
14-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
14-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
14-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
14-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
14-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
14-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
14-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
14-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
14-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
14-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
14-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
14-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
14-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
14-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
14-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
14-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
14-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
14-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
14-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
14-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
14-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
14-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
14-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
14-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
14-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
14-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
14-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
14-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
14-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
14-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
14-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
14-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
14-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
14-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
15-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
15-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
15-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
15-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
15-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
15-13	CN	H	CF ₃	2	
15-14	CHO	H	CF ₃	2	
15-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
15-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
15-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
15-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
15-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
15-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
15-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
15-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
15-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
15-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
15-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
15-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
15-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
15-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
15-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
15-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
15-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
15-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
15-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
15-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
15-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
15-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
15-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
15-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
15-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
15-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
15-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
15-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
15-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
15-61	NHMe	H	CF ₃	2	
15-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-68	NHAc	H	CF ₃	2	
15-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
15-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
15-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
15-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
15-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
15-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
15-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
15-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
15-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
15-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
15-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
15-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
15-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
15-93	H	CN	CF ₃	2	
15-94	H	CHO	CF ₃	2	
15-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
15-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
15-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
15-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
15-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
15-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
15-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
15-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
15-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
15-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
15-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
15-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
15-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
15-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
15-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
15-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
15-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
15-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
15-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
15-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
15-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
15-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
15-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
15-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
15-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
15-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
15-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
15-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
15-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
15-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
15-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
15-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
15-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
15-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
15-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
15-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
15-141	H	NHMe	CF ₃	2	
15-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
15-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
15-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-148	H	NHAc	CF ₃	2	
15-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
15-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
15-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
15-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
15-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
15-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
15-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
15-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

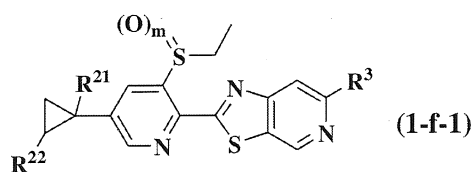
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
15-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
15-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
15-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
15-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-173	CN	H	SCF ₃	2	
15-174	CHO	H	SCF ₃	2	
15-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
15-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
15-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
15-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
15-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
15-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
15-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
15-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
15-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
15-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
15-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
15-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
15-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
15-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
15-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
15-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
15-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
15-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
15-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
15-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
15-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
15-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
15-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
15-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
15-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
15-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
15-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
15-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
15-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
15-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
15-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
15-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
15-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
15-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
15-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
15-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
15-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
15-253	H	CN	SCF ₃	2	
15-254	H	CHO	SCF ₃	2	
15-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
15-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
15-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
15-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
15-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
15-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
15-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
15-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
15-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
15-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
15-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
15-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
15-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
15-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
15-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
15-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
15-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
15-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
15-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
15-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
15-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
15-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
15-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
15-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
15-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
15-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
15-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
15-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
15-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
15-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
15-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
15-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
15-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
15-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
15-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
15-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
15-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
15-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
15-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
15-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
15-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
15-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
15-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
15-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
15-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
15-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
15-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
16-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
16-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
16-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
16-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
16-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
16-13	CN	H	CF ₃	2	
16-14	CHO	H	CF ₃	2	
16-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
16-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
16-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
16-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
16-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
16-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
16-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
16-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
16-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
16-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
16-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
16-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
16-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
16-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
16-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
16-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
16-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
16-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
16-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
16-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
16-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
16-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
16-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
16-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
16-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
16-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
16-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
16-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
16-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
16-61	NHMe	H	CF ₃	2	
16-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-68	NHAc	H	CF ₃	2	
16-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
16-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
16-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
16-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
16-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
16-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
16-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
16-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
16-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
16-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
16-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
16-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
16-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
16-93	H	CN	CF ₃	2	
16-94	H	CHO	CF ₃	2	
16-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
16-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
16-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
16-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
16-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
16-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
16-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
16-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
16-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
16-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
16-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
16-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
16-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
16-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
16-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
16-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
16-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
16-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
16-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
16-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
16-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

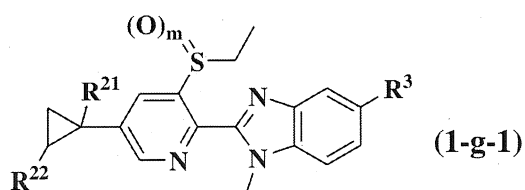
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
16-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
16-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
16-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
16-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
16-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
16-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
16-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
16-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
16-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
16-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
16-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
16-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
16-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
16-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
16-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
16-141	H	NHMe	CF ₃	2	
16-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
16-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
16-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-148	H	NHAc	CF ₃	2	
16-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
16-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
16-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
16-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
16-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
16-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
16-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
16-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
16-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
16-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
16-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
16-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-173	CN	H	SCF ₃	2	
16-174	CHO	H	SCF ₃	2	
16-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
16-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
16-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
16-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
16-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
16-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
16-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
16-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
16-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
16-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
16-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
16-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
16-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
16-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
16-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
16-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
16-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
16-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
16-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
16-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
16-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
16-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
16-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
16-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
16-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
16-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
16-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
16-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
16-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
16-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
16-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
16-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
16-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
16-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
16-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
16-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
16-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
16-253	H	CN	SCF ₃	2	
16-254	H	CHO	SCF ₃	2	
16-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
16-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
16-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
16-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
16-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
16-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
16-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
16-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
16-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
16-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
16-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
16-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
16-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
16-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
16-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
16-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
16-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
16-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
16-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
16-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
16-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
16-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
16-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
16-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
16-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
16-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
16-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
16-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
16-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
16-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
16-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
16-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
16-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
16-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
16-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
16-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
16-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
16-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
16-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
16-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
16-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
16-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
16-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
16-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
16-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
16-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
16-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
17-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
17-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
17-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
17-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
17-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
17-13	CN	H	CF ₃	2	
17-14	CHO	H	CF ₃	2	
17-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
17-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
17-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
17-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
17-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
17-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
17-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
17-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
17-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
17-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
17-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
17-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
17-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
17-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
17-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
17-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
17-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
17-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
17-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
17-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
17-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
17-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
17-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
17-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
17-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
17-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
17-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
17-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
17-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
17-61	NHMe	H	CF ₃	2	
17-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-68	NHAc	H	CF ₃	2	
17-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
17-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
17-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
17-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
17-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
17-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
17-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
17-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
17-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
17-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
17-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
17-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
17-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
17-93	H	CN	CF ₃	2	
17-94	H	CHO	CF ₃	2	
17-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
17-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
17-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
17-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
17-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
17-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
17-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
17-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
17-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
17-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
17-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
17-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
17-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
17-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
17-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
17-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
17-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
17-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
17-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
17-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
17-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

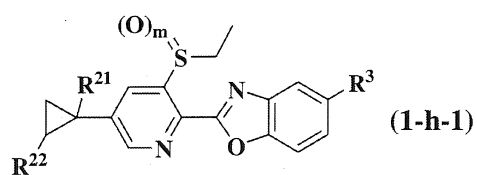
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
17-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
17-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
17-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
17-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
17-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
17-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
17-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
17-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
17-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
17-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
17-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
17-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
17-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
17-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
17-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
17-141	H	NHMe	CF ₃	2	
17-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
17-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
17-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-148	H	NHAc	CF ₃	2	
17-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
17-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
17-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
17-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
17-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
17-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
17-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
17-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
17-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
17-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
17-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
17-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-173	CN	H	SCF ₃	2	
17-174	CHO	H	SCF ₃	2	
17-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
17-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
17-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
17-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
17-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
17-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
17-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
17-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
17-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
17-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
17-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
17-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
17-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
17-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
17-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
17-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
17-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
17-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
17-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
17-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
17-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
17-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
17-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
17-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
17-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
17-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
17-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
17-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
17-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
17-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
17-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
17-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
17-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
17-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
17-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
17-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
17-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
17-253	H	CN	SCF ₃	2	
17-254	H	CHO	SCF ₃	2	
17-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
17-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
17-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
17-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
17-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
17-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
17-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
17-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
17-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
17-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
17-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
17-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
17-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
17-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
17-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
17-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
17-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
17-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
17-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
17-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
17-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
17-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
17-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
17-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
17-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
17-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
17-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
17-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
17-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
17-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
17-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
17-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
17-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
17-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
17-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
17-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
17-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
17-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
17-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
17-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
17-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
17-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
17-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
17-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
17-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
17-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
17-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	208-211
18-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	175-176
18-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
18-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	150
18-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
18-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
18-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
18-13	CN	H	CF ₃	2	212-217
18-14	CHO	H	CF ₃	2	
18-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
18-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
18-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
18-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
18-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
18-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
18-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
18-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
18-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
18-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
18-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
18-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
18-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
18-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
18-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
18-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
18-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
18-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
18-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
18-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
18-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
18-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
18-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
18-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
18-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
18-51	CH=NOme	H	CF ₃	2	
18-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
18-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
18-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
18-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
18-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
18-61	NHMe	H	CF ₃	2	
18-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-68	NHAc	H	CF ₃	2	
18-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
18-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
18-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
18-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
18-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
18-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
18-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
18-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
18-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
18-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
18-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
18-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
18-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
18-93	H	CN	CF ₃	2	
18-94	H	CHO	CF ₃	2	
18-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
18-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
18-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
18-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
18-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
18-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
18-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
18-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
18-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
18-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
18-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
18-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
18-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
18-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
18-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
18-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
18-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
18-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
18-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
18-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
18-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

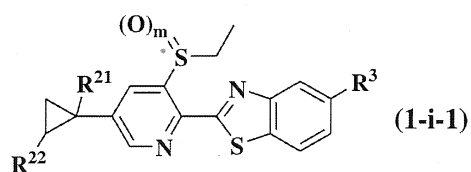
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
18-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
18-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
18-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
18-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
18-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
18-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
18-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
18-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
18-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
18-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
18-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
18-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
18-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
18-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
18-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
18-141	H	NHMe	CF ₃	2	
18-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
18-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
18-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-148	H	NHAc	CF ₃	2	
18-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
18-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
18-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
18-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
18-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
18-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
18-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
18-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	173-176
18-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	113-115
18-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	214-216
18-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
18-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
18-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-173	CN	H	SCF ₃	2	188-189
18-174	CHO	H	SCF ₃	2	135-136
18-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
18-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	126-127
18-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
18-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
18-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
18-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
18-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	151-152
18-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
18-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
18-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
18-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
18-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
18-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
18-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
18-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
18-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
18-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
18-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
18-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
18-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
18-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
18-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	157-159
18-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	155-157
18-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	125-127
18-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
18-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
18-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	153-155
18-221	NHMe	H	SCF ₃	2	90-91
18-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-228	NHAc	H	SCF ₃	2	206-207
18-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
18-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	76-79
18-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	129-131
18-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
18-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
18-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
18-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
18-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
18-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
18-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
18-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
18-253	H	CN	SCF ₃	2	
18-254	H	CHO	SCF ₃	2	
18-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
18-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
18-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
18-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
18-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
18-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
18-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
18-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
18-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
18-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
18-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
18-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
18-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
18-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
18-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
18-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
18-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
18-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
18-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
18-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
18-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
18-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
18-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
18-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
18-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
18-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
18-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
18-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
18-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
18-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
18-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
18-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
18-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
18-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
18-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
18-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
18-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
18-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
18-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
18-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
18-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
18-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
18-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
18-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
18-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
18-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
18-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
19-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
19-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
19-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
19-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
19-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
19-13	CN	H	CF ₃	2	
19-14	CHO	H	CF ₃	2	
19-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
19-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
19-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
19-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
19-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
19-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
19-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
19-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
19-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
19-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
19-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
19-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
19-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
19-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
19-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
19-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
19-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
19-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
19-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
19-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
19-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
19-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
19-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
19-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
19-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
19-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
19-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
19-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
19-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
19-61	NHMe	H	CF ₃	2	
19-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-68	NHAc	H	CF ₃	2	
19-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
19-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
19-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
19-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
19-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
19-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
19-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
19-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
19-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
19-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
19-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
19-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
19-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
19-93	H	CN	CF ₃	2	
19-94	H	CHO	CF ₃	2	
19-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
19-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
19-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
19-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
19-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
19-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
19-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
19-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
19-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
19-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
19-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
19-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
19-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
19-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
19-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
19-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
19-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
19-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
19-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
19-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
19-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

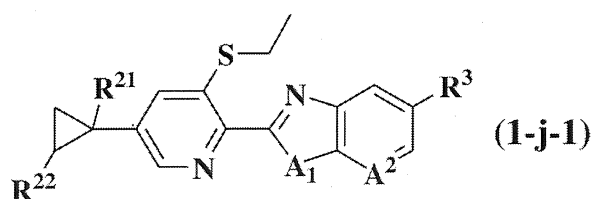
Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
19-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
19-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
19-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
19-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
19-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
19-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
19-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
19-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
19-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
19-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
19-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
19-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
19-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
19-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
19-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
19-141	H	NHMe	CF ₃	2	
19-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
19-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
19-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-148	H	NHAc	CF ₃	2	
19-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
19-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
19-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
19-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
19-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
19-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
19-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
19-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
19-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
19-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
19-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
19-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-173	CN	H	SCF ₃	2	
19-174	CHO	H	SCF ₃	2	
19-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
19-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
19-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
19-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
19-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
19-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
19-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
19-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
19-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
19-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
19-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
19-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
19-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
19-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
19-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
19-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
19-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
19-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
19-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
19-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
19-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
19-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
19-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
19-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
19-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
19-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
19-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
19-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
19-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
19-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
19-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
19-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
19-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
19-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
19-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
19-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
19-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
19-253	H	CN	SCF ₃	2	
19-254	H	CHO	SCF ₃	2	
19-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
19-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
19-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
19-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
19-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
19-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
19-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
19-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
19-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
19-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
19-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
19-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
19-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
19-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
19-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
19-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
19-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
19-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
19-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
19-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
19-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	m	Tính chất vật lý
19-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
19-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
19-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
19-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
19-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
19-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
19-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
19-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
19-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
19-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
19-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
19-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
19-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
19-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
19-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
19-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
19-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
19-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
19-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
19-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
19-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
19-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
19-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
19-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
19-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
19-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	



Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	A ¹	A ²	Tính chất vật lý
20-1	CO ₂ H	H	CF ₃	NMe	N	
20-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	NMe	N	122-124
20-3	CONH ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-4	CN	H	CF ₃	NMe	N	
20-5	CHO	H	CF ₃	NMe	N	
20-6	CH ₂ OH	H	CF ₃	NMe	N	
20-7	CH ₂ OMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-8	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	NMe	N	
20-9	CH ₂ CN	H	CF ₃	NMe	N	
20-10	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-11	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	NMe	N	
20-12	CH ₂ SMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-13	CH=NOH	H	CF ₃	NMe	N	
20-14	CH=NOMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-15	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	NMe	N	
20-16	NH ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-17	NHAc	H	CF ₃	NMe	N	
20-18	NHCOOMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-19	NHCOOt-Bu	H	CF ₃	NMe	N	
20-20	CH ₂ Cl	H	CF ₃	NMe	N	
20-21	H	CO ₂ H	CF ₃	NMe	N	139-141
20-22	H	CO ₂ Me	CF ₃	NMe	N	118-120
20-23	H	CONH ₂	CF ₃	NMe	N	
20-24	H	CN	CF ₃	NMe	N	156-158
20-25	H	CHO	CF ₃	NMe	N	
20-26	H	CH ₂ OH	CF ₃	NMe	N	55-58
20-27	H	CH ₂ OMe	CF ₃	NMe	N	
20-28	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	NMe	N	
20-29	H	CH ₂ CN	CF ₃	NMe	N	
20-30	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	NMe	N	
20-31	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	NMe	N	
20-32	H	CH ₂ SMe	CF ₃	NMe	N	
20-33	H	CH=NOH	CF ₃	NMe	N	
20-34	H	CH=NOMe	CF ₃	NMe	N	
20-35	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	NMe	N	
20-36	H	NH ₂	CF ₃	NMe	N	
20-37	H	NHAc	CF ₃	NMe	N	
20-38	H	NHCOOMe	CF ₃	NMe	N	
20-39	H	NHCOOt-Bu	CF ₃	NMe	N	101-103
20-40	H	CH ₂ Cl	CF ₃	NMe	N	

Số hợp chất	R ²¹	R ²²	R ³	A ¹	A ²	Tính chất vật lý
20-41	CO ₂ H	H	SCF ₃	O	CH	221-225
20-42	CO ₂ Me	H	SCF ₃	O	CH	172-174
20-43	CONH ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-44	CN	H	SCF ₃	O	CH	202-204
20-45	CHO	H	SCF ₃	O	CH	109-110
20-46	CH ₂ OH	H	SCF ₃	O	CH	123-125
20-47	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-48	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	O	CH	
20-49	CH ₂ CN	H	SCF ₃	O	CH	
20-50	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-51	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	O	CH	
20-52	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-53	CH=NOH	H	SCF ₃	O	CH	105-108
20-54	CH=NOMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-55	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	O	CH	
20-56	NH ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-57	NHAc	H	SCF ₃	O	CH	
20-58	NHCOOMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-59	NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	O	CH	
20-60	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	O	CH	
20-61	H	CO ₂ H	SCF ₃	O	CH	
20-62	H	CO ₂ Me	SCF ₃	O	CH	
20-63	H	CONH ₂	SCF ₃	O	CH	
20-64	H	CN	SCF ₃	O	CH	
20-65	H	CHO	SCF ₃	O	CH	
20-66	H	CH ₂ OH	SCF ₃	O	CH	
20-67	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	O	CH	
20-68	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	O	CH	
20-69	H	CH ₂ CN	SCF ₃	O	CH	
20-70	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	O	CH	
20-71	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	O	CH	
20-72	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	O	CH	
20-73	H	CH=NOH	SCF ₃	O	CH	
20-74	H	CH=NOMe	SCF ₃	O	CH	
20-75	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	O	CH	
20-76	H	NH ₂	SCF ₃	O	CH	
20-77	H	NHAc	SCF ₃	O	CH	
20-78	H	NHCOOMe	SCF ₃	O	CH	
20-79	H	NHCOOt-Bu	SCF ₃	O	CH	
20-80	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	O	CH	

Thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính thích hợp để kiểm soát nhiều côn trùng gây hại khác nhau mà có thể phá hoại lúa, cây ăn quả, rau, cây trồng khác và cây ra hoa trang trí. Côn

trùng gây hại cần được kiểm soát là, ví dụ, loài gây hại trong nông nghiệp và lâm nghiệp, loài gây hại trong làm vườn, loài gây hại cho hạt giống bảo quản, loài gây hại trong vệ sinh, giun tròn, v.v...

Các ví dụ cụ thể về loài gây hại, giun tròn, v.v... bao gồm như sau:

các loại của Bộ cánh vảy (Lepidoptera) như *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapularis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *Trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinensis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophera batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia* bao gồm, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo*

suppressalis, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, a species của family Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*, *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthopplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, the species của family Pieridae như *Pieris rapae crucivora* và *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phitheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* và *Earias cupreoviridis*; các loài của bộ Cánh ngửa (Hemiptera) như *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptopsaltria nigrofusca*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosophum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*,

Macrosiphoniella sanborni, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhrerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidiotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticiellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geoica lucifuga*, *Numata muiri*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederarum*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigridorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis glycines*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobiarum*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lopholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nympharum*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhrerites debile*, *Laodelphax striatella*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovium punctatum*, *Empoasca* spp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus disponis*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissima*,

Eysarcoris guttiger, *Lepidosaphes beckii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraecola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishidai*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* và *Aphis gossypii*;

các loài của bộ Cánh cứng (Coleoptera) như *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotha hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*,

Tribolium confusum, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linnaeidea aenea* và *Anthonomus grandis*;

các loài của bộ Hai cánh (Diptera) như *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Clops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, the species của family Phoridae như *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* Forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromuza nigriventris*, *Anastrepha ludens* và *Rhagoletis pomonella*;

các loài của bộ Cánh màng (Hymenoptera) như *Pristomyrmex pungens*, các loài của họ Ong rệp cây (Bethylidae), *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, loài của phân họ ong bắp cày (Vespinidae), *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* và *Ochetellus glaber*;

loài của Bộ cánh thẳng (Orthoptera) như *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* và *Teleogryllus emma*;

loài của bộ cánh viên (Thysanoptera) như *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*,

Microcephalothrips abdominalis, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Franklinella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* và *Liothrips vaneeckei*;

loài của bộ ve giáp (Acari) như *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, loài của bộ ve cứng (Ixodidae) như *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanicus*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvaivum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptreneissus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptura citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* và *Sancassania* sp.;

loài của bộ cánh bọ (Isoptera) như *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guangzhouensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* và *Reticulitermes speratus*;

loài của bộ cánh gián (Blattodea) như *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* và *Periplaneta americana*;

loài của bộ Chết (Siphonaptera) như *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* và *Ceratophyllus gallinae*;

loài của ngành giun tròn (Nematoda) như *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* và *Tylenchus semipenetrans*; và

loài của ngành thân mềm (Mollusca) như *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* và *Acusta despecta sieboldiana*.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn theo sáng chế cũng có hiệu quả trừ sâu mạnh đối với sâu *Tuta absoluta*.

Hơn nữa, ve ký sinh trên động vật cũng được kể đến trong côn trùng gây hại cần được kiểm soát, và các ví dụ bao gồm loài của họ Ve (Ixodidae) như *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinosa*, *Dermacentor reticulatus* và *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; loài của giống Mạt chuột *Ornithonyssus* như *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bursa*; loài của họ Mò (Trombiculidae) như *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* và *Helenicula miyagawai*; loài của họ Ve (Cheyletidae) như *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* và *Cheyletiella blakei*; loài của phân họ Giẻ (Sarcoptoidea) như *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* và *Notoedres cati*; và loài của họ Mò bao lông trên chó (Demodicidae) như *Demodex canis*.

Các côn trùng gây hại khác cần được kiểm soát bao gồm côn trùng không cánh ký sinh ngoài thuộc bộ Chết (Siphonaptera), cụ thể hơn, loài thuộc họ Bọ chó Pulicidae và Ceratophyllidae. Ví dụ về các loài thuộc họ Bọ chết Pulicidae bao gồm *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* và

Monopsyllus anisus.

Các côn trùng gây hại phải kiểm soát bao gồm vật ký sinh ngoài của động vật, ví dụ, loài của phân bộ Chấy rận Anoplura như *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* và *Pediculus capitis*; loài của phân bộ Mallophaga như *Trichodectes canis*; và các côn trùng gây hại hai cánh hút máu như *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* và *Simulium ornatum*. Ngoài ra, ví dụ về các ký sinh trong của động vật bao gồm giun tròn như sán dây, giun tóc, giun đốt, giun ký sinh trong dạ dày, giun đũa và giun chỉ; sán dây như *Spirometra erinacei*, *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* và *Echinococcus multilocularis*; giun tròn như *Schistosoma japonicum* và *Fasciola hepatica*; và ngành động vật nguyên sinh như trùng cầu, *Plasmodium*, *Sarcocystis*, *Toxoplasma* và *Cryptosporidium* trong ruột.

Thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc a muối của chúng làm thành phần hoạt tính có tác dụng kiểm soát rõ rệt đối với côn trùng gây hại nêu trên mà phá hoại cây trồng vùng trũng, cây trồng ở ruộng, cây ăn quả, rau, cây trồng khác, cây ra hoa trang trí, v.v..., và tạo ra tác dụng mong muốn khi được dùng cho các cơ sở ươm mầm vảy giống con, các ruộng lúa, các cánh đồng, cây ăn quả, rau, cây trồng khác, cây ra hoa trang trí, v.v... và hạt giống của chúng, lúa nước, tán lá, môi trường canh tác như đất, hoặc tương tự quanh thời điểm dự tính quấy phá của côn trùng gây hại, ví dụ, trước khi côn trùng gây hại hoặc sau khi xác định được sự quấy phá của côn trùng gây hại. Được ưu tiên đặc biệt là các phương án sử dụng cái gọi là sự xâm nhập và sự chuyển vị của thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn vào cây trồng, cây ra hoa trang trí, v.v... Theo các phương án này, hợp chất theo sáng chế được dùng cho đất vườn ươm, đất trong các lỗ trồng, rễ cây, nước tưới tiêu, nước canh tác trong thuật rỗng cây trong nước, hoặc tương tự, và nhờ đó được hấp thụ qua rễ cây thông qua đất hoặc thành phần khác.

Các cây có ích mà thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế có thể được dùng cho bao gồm, nhưng không bị giới hạn cụ thể ở, ví dụ, ngũ

cốc (ví dụ, lúa, lúa mạch, lúa mì, lúa mạch đen, yến mạch, ngô, v.v...), các loại đậu (ví dụ, đậu nành, đậu azuki, đậu tằm, đậu xanh, đậu đỏ, đậu phộng, v.v...), cây ăn quả và trái cây (ví dụ, táo, cam, quýt, lê, nho, đào, mận, anh đào, quả óc chó, hạt dẻ, hạnh nhân, chuối, v.v...), rau quả và lá (ví dụ, cải bắp, cà chua, rau bina, bông cải xanh, rau diếp, hành tây, hành lá (hệ và hành tây xứ Wales), ớt xanh, cà tím, dâu tây, cây hạt tiêu, đậu bắp, họ Trung Quốc, v.v...), các loại rau củ (ví dụ, cà rốt, khoai tây, khoai lang, khoai môn, củ cải Nhật Bản, củ cải, rễ sen, rễ cây ngưi bàng, tỏi, hành lá Trung Quốc, v.v...), cây trồng để chế biến (như bông, gai, củ cải, hoa bia, mía, củ cải đường, ô liu, cao su, cà phê, thuốc lá, trà, v.v...), trái bầu (ví dụ, bí đỏ Nhật Bản, dưa chuột, dưa hấu, dưa hấu ngọt phương Đông, dưa hấu, v.v...), cỏ đồng cỏ (ví dụ, cỏ ngón, lúa miến, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng, vv), cỏ cỏ (ví dụ, cỏ cỏ Hàn Quốc, cỏ uôn cong, vv), gia vị và cây thơm và cây cảnh (ví dụ, hoa oải hương, hương thảo, húng tây, rau mùi tây, hạt tiêu, gừng, vv), cây hoa cảnh (ví dụ, hoa cúc, hoa hồng, cẩm chướng, hoa lan, tulip, lily, vv), cây vườn (ví dụ, cây bạch quả, cây anh đào, cây ô rô bà Nhật Bản, vv) và cây rừng (ví dụ, *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, cây thông, tuyết tùng vàng, tuyết tùng Nhật Bản, cây bách hinoki, bạch đàn, vv).

“Các cây” nêu trên còn bao gồm các cây được cung cấp tính chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật gây giống cỏ điển hoặc kỹ thuật tái tổ hợp gen. Các ví dụ về tính chịu thuốc trừ sâu bao gồm tính chịu các chất ức chế HPPD như isoxaflutol; các chất ức chế ALS như imazethapyr và thifensulfuron-metyl; các chất ức chế EPSP synthaza như glyphosat; các chất ức chế glutamin synthetaza như glufosinat; các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza như setoxydim; hoặc các thuốc diệt cỏ khác như bromoxynil, dicamba và 2,4-D.

Ví dụ về các cây được cung cấp tính chịu thuốc trừ sâu bằng kỹ thuật gây giống cỏ điển bao gồm các giống hạt cải dầu, cây lúa mì, cây hướng dương và cây lúa dung nạp họ imidazolinon của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như imazethapyr, và các cây này được bán dưới tên thương mại của Clearfield (nhãn hiệu đã đăng ký). Ngoài ra, giống đậu tương mà được cung cấp tính chịu họ sulfonyl ure của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như thifensulfuron-metyl bằng kỹ thuật gây giống cỏ điển cũng

được kể đến, và giống đậu tương này được bán dưới tên thương mại là đậu tương STS. Các cây mà được cung cấp tính chịu chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza như các thuốc diệt cỏ trion oxim và các thuốc diệt cỏ chứa axit aryloxy phenoxy propionic bằng kỹ thuật gây giống cổ điển, ví dụ, cây ngô SR và các cây tương tự cũng được kể đến. Các cây được cung cấp tính chịu các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza được mô tả trong Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), và tài liệu tương tự. Hơn nữa, các đột biến axetyl-CoA carboxylaza kháng các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza được báo cáo trong Weed Science, 53, 728-746 (2005), và tài liệu tương tự, và bằng cách đưa gen đột biến axetyl-CoA carboxylaza vào các cây bằng kỹ thuật tái tổ hợp gen, hoặc đưa đột biến truyền tính kháng vào axetyl-CoA carboxylaza của các cây, các cây chịu các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza có thể được tạo ra. Theo cách khác, bằng cách đưa axit nucleic gây đột biến thể bazơ vào trong tế bào cây (ví dụ điển hình của kỹ thuật này là kỹ thuật chỉnh sửa gen (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318.)) để cho phép sự đột biến thể đặc hiệu vị trí trong các axit amin được mã hóa bởi gen axetyl-CoA carboxylaza, gen ALS hoặc gen tương tự của cây, cây chịu các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza, các chất ức chế ALS hoặc các chất tương tự có thể được tạo ra. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế cũng có thể được dùng cho các loại cây này.

Hơn nữa, các độc tố ví dụ biểu hiện trong cây biến đổi gen bao gồm các protein trừ sâu được lấy từ *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; các delta-endotoxin được lấy từ *Bacillus thuringiensis* như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 và Cry9C, và các protein trừ sâu khác như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A; các protein trừ sâu lấy từ giun tròn; các độc tố được tạo ra từ động vật như độc tố bọ cạp, độc tố nhện, độc tố ong và độc tố thần kinh đặc hiệu côn trùng; các độc tố của nấm sợi; các lectin từ cây; agglutinin; các chất ức chế proteaza như các chất ức chế trypsin, các chất ức chế serin proteaza, patatin, các chất ức chế cystatin và papain; các protein bất hoạt ribosome (ribosome inactivating proteins-RIP) như ricin, ngô RIP, abrin, luffin, saporin và bryodin; các enzym chuyển hóa steroid như 3-hydroxy steroid oxidaza, ecdysteroid-UDP-

glucosyltransferaza và cholesterol oxidaza; các chất ức chế ecdyson; HMG-CoA reductaza; các chất ức chế kênh ion như các chất ức chế kênh natri và các chất ức chế kênh canxi; hocmon esteraza mới sinh; các thụ thể hocmon lợi tiểu; xtilben synthaza; bibenzyl synthaza; chitinaza; và glucanaza.

Các độc tố lai, các độc tố thiếu hụt một phần và các độc tố biến đổi lấy từ: các protein delta-endotoxin như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab và Cry35Ab, và các protein trừ sâu khác như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A cũng được kể đến. Độc tố lai có thể được tạo ra bằng cách kết hợp các vùng được lấy từ các protein này khác với dạng kết hợp ban đầu về bản chất bằng cách sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp. Độc tố Cry1Ab được biết đến là độc tố thiếu hụt một phần mà trong đó phần trình tự axit amin được xóa bỏ. Trong độc tố biến đổi, một hoặc nhiều axit amin của độc tố xảy ra trong tự nhiên được thế.

Ví dụ về các độc tố nêu trên và các cây biến đổi gen có khả năng tổng hợp các độc tố này được mô tả trong EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073, v.v...

Nhờ các độc tố chứa trong các cây biến đổi gen này, cây thể hiện tính kháng loài gây hại, cụ thể là côn trùng gây hại thuộc bộ Cánh cứng (Coleopteran), côn trùng gây hại thuộc bộ Cánh nửa (Hemipteran), côn trùng gây hại thuộc bộ Hai cánh (Dipteran), côn trùng gây hại thuộc bộ Cánh vảy (Lepidopteran) và giun tròn. Các công nghệ và thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn nêu trên của sáng chế có thể được dùng ở dạng kết hợp hoặc được dùng một cách hệ thống.

Để kiểm soát các loại côn trùng gây hại khác nhau, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế, ở dạng pha loãng phù hợp hoặc không pha loãng hoặc ở dạng huyền phù trong nước, v.v..., được dùng cho cây có khả năng bị nhiễm côn trùng gây hại và giun tròn trong lượng hữu hiệu để kiểm soát côn trùng gây hại hoặc giun tròn. Ví dụ, để kiểm soát côn trùng gây hại và giun tròn mà có thể phá hoại cây trồng như cây ăn quả, ngũ cốc và rau, cách dùng cho lá và xử lý hạt giống như nhúng, phủ lan truyền và phủ canxi peroxit có thể được thực hiện. Hơn nữa, sự xử lý đất hoặc yếu tố tương tự cũng có thể được thực hiện để giúp cây hấp thụ các sản phẩm nông hóa học qua rễ của chúng. Các ví dụ về sự xử lý này bao

gồm chôn vùi toàn bộ trong đất, xử lý hàng trồng cây, chôn vùi trong đất nền, xử lý cây giống con trồng trong các khay, xử lý lỗ trồng, xử lý rễ cây, bón phân trên mặt đất, xử lý các hộp ươm lúa, và cách dùng ngập trong nước. Ngoài ra, cách dùng cho môi trường canh tác trong thuật trồng cây trong nước, xử lý tạo khối, tiêm vào thân cây và cách tương tự cũng có thể được thực hiện.

Hơn nữa, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế, ở dạng pha loãng phù hợp hoặc không pha loãng hoặc ở dạng huyền phù trong nước, v.v... có thể được phun các vị trí có khả năng bị nhiễm côn trùng gây hại trong lượng hữu hiệu để kiểm soát các côn trùng gây hại. Ví dụ, nó có thể được phun thẳng vào loài gây hại trong hạt giống bảo quản, loài gây hại trong nhà, loài gây hại trong vệ sinh, loài gây hại trong rừng, v.v..., và cũng có thể được dùng để phủ lên vật liệu làm nhà ở, để xử lý khối, hoặc dưới dạng chế phẩm môi.

Các phương pháp ví dụ về xử lý hạt giống bao gồm nhúng hạt giống trong dung dịch pha loãng hoặc không pha loãng của chế phẩm lỏng hoặc rắn để các sản phẩm nông hóa học ngấm vào trong hạt giống; trộn và rắc phủ hạt giống bằng chế phẩm lỏng hoặc rắn để chế phẩm bám dính lên trên bề mặt của hạt giống; phủ hạt giống bằng hỗn hợp của chế phẩm lỏng hoặc rắn và chất mang dính như nhựa và các polyme; và phun chế phẩm lỏng hoặc rắn vào các vùng lân cận của hạt giống tại cùng thời điểm gieo hạt.

Thuật ngữ “hạt giống” trong phương pháp xử lý hạt giống nêu trên là để chỉ thân cây ở giai đoạn trồng sớm và được sử dụng để nhân giống cây. Các ví dụ bao gồm, ngoài cái gọi là hạt giống, thân cây để nhân giống sinh dưỡng như củ, thân củ, khoai tây giống, hành con, cây con, thân cây hình đĩa và thân cây được sử dụng để cắt.

Theo phương pháp của sáng chế để sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn, thuật ngữ “đất” hoặc “môi trường canh tác” là để chỉ môi trường hỗ trợ cho công việc trồng cây, cụ thể là môi trường hỗ trợ giúp cây trồng phát triển rễ ở trong môi trường đó, và các vật liệu không bị giới hạn cụ thể miễn là cây trồng có thể phát triển. Ví dụ về môi trường hỗ trợ bao gồm cái gọi là đất, thảm gieo giống và nước, và ví dụ cụ thể về các vật liệu bao gồm đất, đá bọt, vermiculit,

diatomit, thạch trắng, các chất dạng keo, các chất trọng lượng phân tử cao, bông khoáng, len thủy tinh, vỏ bào và vỏ cây.

Các phương án ví dụ về sự phun vào tán lá cây trồng hoặc vào loài gây hại hạt giống bảo quản, loài gây hại trong nhà, loài gây hại trong vệ sinh, loài gây hại trong rừng, v.v... bao gồm cách phun chế phẩm lỏng như chất được cô đặc nhũ hóa được và chất chảy được hoặc chế phẩm rắn như bột ướt và hạt phân tán trong nước sau khi pha loãng phù hợp trong nước; phun rắc; và tạo khói.

Các phương pháp ví dụ về sự phun vào đất bao gồm phun chế phẩm lỏng pha loãng trong nước hoặc không pha loãng vào rễ của cây, nền ươm cây giống con, hoặc tương tự; phun bột, bột ướt, hạt phân tán trong nước hoặc dạng tương tự lên trên đất và sau đó chôn vùi chế phẩm ở trong toàn bộ đất trước khi gieo hoặc trồng; và phun bột, bột ướt, hạt phân tán trong nước, hạt hoặc chế phẩm tương tự vào các lỗ trồng cây, hàng trồng cây hoặc tương tự trước khi gieo hoặc trồng.

Ví dụ, bột, hạt phân tán trong nước, hạt hoặc chế phẩm tương tự có thể được dùng cho các hộp ươm lúa mặc dù chế phẩm thích hợp có thể thay đổi tùy thuộc vào thời gian dùng, nói cách khác, phụ thuộc vào giai đoạn canh tác như thời gian gieo, giai đoạn tạo diệp lục và thời gian trồng. Chế phẩm như bột, hạt phân tán trong nước, hạt hoặc chế phẩm tương tự có thể được trộn với đất. Ví dụ, chế phẩm như vậy được chôn vùi trong đất nền, phủ lên đất hoặc toàn bộ đất. Một cách đơn giản, theo cách khác đất và chế phẩm như vậy có thể được xếp lớp.

Trong phương pháp dùng cho các ruộng lúa, chế phẩm rắn như ở dạng túi lớn, gói, hạt và hạt phân tán trong nước, hoặc chế phẩm lỏng như chất chảy được và chất được cô đặc nhũ hóa được thường được dùng cho các ruộng lúa ngập nước. Trong giai đoạn trồng lúa, chế phẩm thích hợp ở dạng nguyên thủy hoặc sau khi được trộn với phân bón hoặc chế phẩm tương tự có thể được dùng ở trên đất hoặc được phun vào đất. Ngoài ra, dung dịch của chất được cô đặc nhũ hóa được, chất chảy được hoặc chất tương tự có thể được dùng cho nguồn cấp nước của ruộng lúa như đầu nước vào và thiết bị tưới tiêu. Trong trường hợp này, quá trình xử lý có thể được thực hiện bằng cách cấp nước và do đó đạt được sự tiết kiệm nhân công.

Đối với các cây trồng trên ruộng, hạt giống của chúng, môi trường canh tác

trong khu vực lân cận của chúng hoặc tương tự có thể được xử lý trong giai đoạn gieo hạt đến giai đoạn trồng cây con. Đối với trường hợp cây trồng mà hạt giống của chúng được gieo trực tiếp vào ruộng, ngoài việc xử lý hạt giống trực tiếp, ưu tiên xử lý rễ cây trong quá trình canh tác. Cụ thể, sự xử lý có thể được thực hiện bằng cách, ví dụ, rắc hạt lên trên đất, hoặc làm đất ướt sũng với chế phẩm ở dạng lỏng pha loãng hoặc không pha loãng trong nước. Phương pháp xử lý ưu tiên khác là chôn vùi hạt vào trong môi trường canh tác trước khi gieo.

Đối với trường hợp cây trồng cần được trồng, ngoài phương pháp xử lý hạt giống trực tiếp, ví dụ ưu tiên về phương pháp xử lý trong giai đoạn gieo hạt đến trồng cây giống con bao gồm phương pháp xử lý làm ướt sũng nền ươm cây giống bằng chế phẩm ở dạng lỏng; và rắc hạt vào nền ươm cây giống con. Phương pháp xử lý các lỗ trồng cây bằng hạt, và chôn vùi hạt vào trong môi trường canh tác trong khu vực lân cận của điểm trồng cây tại thời điểm trồng cây cố định cũng được kể đến.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế thường được sử dụng dưới dạng chế phẩm thuận tiện cho việc sử dụng mà được điều chế theo phương pháp điều chế các chế phẩm nông hóa học thông thường.

Tức là, hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của nó và chất mang bất hoạt phù hợp, và nếu cần, tá dược, được trộn theo tỷ lệ phù hợp, và qua bước hòa tan, tách, tạo huyền phù, trộn, tẩm, hấp phụ và/hoặc bám dính, được bào chế thành dạng phù hợp để sử dụng, như chất được cô đặc huyền phù, chất được cô đặc nhũ hóa được, chất được cô đặc hòa tan, bột ướt, hạt phân tán trong nước, hạt, bột, viên và gói.

Chế phẩm (chất trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn hoặc chất kiểm soát ký sinh động vật) của sáng chế có thể tùy ý chứa chất phụ gia thường được sử dụng cho các chế phẩm nông hóa học hoặc các chất kiểm soát ký sinh động vật ngoài thành phần hoạt tính. Ví dụ về chất phụ gia bao gồm các chất mang như các chất mang rắn hoặc lỏng, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất thấm ướt, chất liên kết, chất dính, chất được cô đặc, chất tạo màu, chất lan truyền, chất gắn/lan truyền, chất chống đóng băng, chất chống đóng bánh, chất phân hủy và chất ổn định.

Nếu cần, các chất bảo quản, mẫu cây, v.v... cũng có thể được sử dụng làm chất phụ gia. Các chất phụ gia này có thể được sử dụng một mình hoặc ở dạng kết hợp của hai hoặc nhiều loại.

Ví dụ về các chất mang rắn bao gồm các khoáng tự nhiên như thạch anh, đất sét, kaolinit, pyrophyllit, sericit, đá tan, bentonit, sét axit, attapulgit, zeolit và diatomit; các muối vô cơ như canxi cacbonat, amoni sulfat, natri sulfat và kali clorua; các chất mang rắn hữu cơ như axit silicat tổng hợp, các silicat tổng hợp, tinh bột, xenluloza và bột cây (ví dụ, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô, thân cây thuốc lá, v.v...); các chất mang dẻo như polyetylen, polypropylen và polyvinyliden clorua; ure; các vật liệu hữu cơ rỗng; các vật liệu dẻo rỗng; và silica được hun khói (cacbon trắng). Các chất mang rắn này có thể được sử dụng một mình hoặc ở dạng kết hợp của hai hoặc nhiều loại.

Ví dụ về chất mang lỏng bao gồm các rượu bao gồm các rượu monohydric như metanol, etanol, propanol, isopropanol và butanol, và các rượu polyhydric như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, hexylen glycol, polyetylen glycol, polypropylen glycol và glyxerin; các hợp chất polyol như propylen glycol ete; các keton như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton, diisobutyl keton và xyclohexanon; các ete như etyl ete, dioxan, etylen glycol monoetyl ete, dipropyl ete và tetrahydrofuran; các hydrocacbon béo như parafin thông thường, naphthen, isoparaffin, kerosen và dầu khoáng; các hydrocacbon thơm như benzen, toluen, xylen, dung môi naphtha và alkyl naphtalen; các hydrocacbon được halogen hóa, như diclometan, cloform và cacbon tetraclorea; các este như etyl axetat, diisopropyl phthalat, dibutyl phthalat, dioctyl phthalat và dimetyl adipat; các lacton như gamma-butyrolacton; các amit như dimetylformamit, dietylformamit, dimetylaxetamit và N-alkyl pyrrolidinon; các nitril như axetonitril; các hợp chất lưu huỳnh như dimetyl sulfoxit; dầu thực vật như dầu đậu nành, dầu hạt cải, dầu hạt bông và dầu thầu dầu; và nước. Các chất mang lỏng này có thể được sử dụng một mình hoặc ở dạng kết hợp của hai hoặc nhiều loại.

Các chất hoạt động bề mặt ví dụ được sử dụng như chất phân tán hoặc chất thấm ướt/lan truyền bao gồm các chất hoạt động không ở dạng ion như este của axit

béo sorbitan, các este của axit béo polyoxyetylen sorbitan, este của axit béo sucroza, các este của axit béo polyoxyetylen, các este của axit nhựa polyoxyetylen, dieste của axit béo polyoxyetylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkyl aryl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete, polyoxyetylen dialkyl phenyl ete, các chất được cô đặc polyoxyetylen alkyl phenyl ete-formaldehyt, các copolyme khối polyoxyetylen-polyoxypropylen, các polyme khối polystyren-polyoxyetylen, các copolyme ete khối alkyl polyoxyetylen-polypropylen, polyoxyetylen alkylamin, amit của axit béo polyoxyetylen, bis(phenyl ete) của axit béo polyoxyetylen, polyalkylen benzyl phenyl ete, polyoxyalkylen styryl phenyl ete, axetylen diol, axetylen diol được bổ sung polyoxyalkylen, silicaon loại polyoxyetylen ete, silicacon loại este, các chất hoạt động bề mặt flo, dầu thầu dầu polyoxyetylen và dầu thầu dầu được hydro hóa polyoxyetylen; các chất hoạt động bề mặt ở dạng anion như các alkyl sulfat, các polyoxyetylen alkyl ete sulfat, các polyoxyetylen alkyl phenyl ete sulfat, các polyoxyetylen styryl phenyl ete sulfat, các alkylbenzen sulfonat, các alkylaryl sulfonat, các lignosulfonat, các alkyl sulfosuccinat, các naphthalen sulfonat, các alkyl naphthalen sulfonat, các muối của chất được cô đặc axit naphthalensulfonic-formaldehyt, các muối của các chất được cô đặc axit alkyl naphthalensulfonic-formaldehyt, các muối của axit béo, các muối của axit polycarboxylic, các polyacrylat, các sarcosinat của axit béo N-metyl, các resinat, các phosphat của polyoxyetylen alkyl ete và các phosphat của polyoxyetylen alkyl phenyl ete; các chất hoạt động bề mặt dạng cation bao gồm các muối alkyl amin như lauryl amin hydroclorua, stearyl amin hydroclorua, oleyl amin hydroclorua, stearyl amin axetat, stearyl aminopropyl amin axetat, alkyl trimetyl amoni clorua và alkyl dimetyl benzalkonium clorua; và các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính như các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính dạng axit amin hoặc dạng betain. Các chất hoạt động bề mặt này có thể được sử dụng một mình hoặc ở dạng kết hợp của hai hoặc nhiều loại.

Ví dụ về các chất liên kết hoặc các chất dính bao gồm carboxymetyl xenluloza hoặc các muối của chúng, dextrin, tinh bột hòa tan, gồm xanthan, gồm guar, sucroza, polyvinyl pyrrolidon, gồm arabic, rượu polyvinyl, polyvinyl axetat, natri polyacrylat, các polyetylen glycol với trọng lượng phân tử trung bình là từ 6000 đến

20000, các polyetylen oxit với trọng lượng phân tử trung bình từ 100,000 đến 5000000, các phospholipit (ví dụ, cephalin, lecithin, v.v...), bột xenluloza, dextrin, tinh bột biến đổi, các hợp chất chelat hóa axit polyaminocarboxylic, polyvinyl pyrrolidon liên kết ngang, các copolyme styren-axit maleic, các copolyme axit (meth)acrylic, các nửa este của polyme rượu polyhydric và dicarboxylic anhydrua, các polystyren sulfonat hòa tan trong nước, parafin, terpen, các nhựa polyamit, các polyacrylat, polyoxyetylen, sáp, polyvinyl alkyl ete, các chất được cô đặc alkylphenol-formaldehyt và các chất nhũ tương nhựa tổng hợp.

Ví dụ về các chất làm đặc bao gồm các polyme tan được trong nước như gồm xanthan, gồm guar, gồm diutan, carboxymetyl xenluloza, polyvinyl pyrrolidon, các carboxyvinyl polyme, các acrylic polyme, các hợp chất tinh bột và các polysaccarit; và các bột mịn hữu cơ như bentonit bậc cao và silica được hun khói (cacbon trắng).

Ví dụ về các chất tạo màu bao gồm các chất màu vô cơ như sắt oxit, titani oxit và màu xanh Phổ; và các thuốc nhuộm hữu cơ như các thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm phthaloxyanin kim loại.

Ví dụ về các chất chống đóng băng bao gồm các rượu polyhydric như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol và glycerin.

Ví dụ về các tá dược có tác dụng ngăn đóng băng hoặc tạo thuận lợi cho sự phân hủy bao gồm các polysaccarit (tinh bột, axit alginic, mannoza, galactoza, v.v...), polyvinyl pyrrolidon, silica được hun khói (cacbon trắng), gồm este, nhựa dầu mỏ, natri tripolyphosphat, natri hexametaphosphat, các stearat kim loại, bột xenluloza, dextrin, các methacrylat copolyme, polyvinyl pyrrolidon, các hợp chất chelat hóa axit polyaminocarboxylic, các copolyme anhydrua styren-isobutylen-maleic được sulfonat hóa và các copolyme ghép tinh bột-polyacrylonitril.

Ví dụ về các chất ổn định bao gồm các chất làm khô như zeolit, vôi sống và magie oxit; các chất chống oxy hóa như các hợp chất phenolic, các hợp chất amin, các hợp chất lưu huỳnh và các hợp chất axit phosphoric; và các chất hấp thụ cực tím như các hợp chất axit salixylic và các hợp chất benzophenon.

Ví dụ về các chất bảo quản bao gồm kali sorbat và 1,2-benzothiazolin-3-on.

Hơn nữa, các tá dược khác bao gồm các chất lan truyền có chức, các chất tăng

cường hoạt tính như các chất ức chế chuyển hóa (piperonyl butoxit v.v...), các chất chống đông băng (propylen glycol etc.), các chất chống oxy hóa (BHT v.v...) và các chất hấp thụ cực tím cũng có thể được sử dụng nếu cần.

Hàm lượng của hợp chất chứa thành phần hoạt tính trong thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế có thể được điều chỉnh khi cần, và ví dụ, được chọn phù hợp từ khoảng từ 0,01 đến 90 phần trọng lượng phần trọng lượng trong 100 phần trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn. Ví dụ, trong trường hợp trong đó thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn là bột, hạt, chất được cô đặc nhũ hóa hoặc bột ướt, thích hợp là hàm lượng của hợp chất chứa thành phần hoạt tính là từ 0,01 đến 50 phần trọng lượng (0,01 đến 50% trọng lượng đối với tổng trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn).

Lượng dùng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế có thể thay đổi theo các yếu tố khác nhau, ví dụ, mục đích, côn trùng gây hại đích, điều kiện tăng cường của cây trồng, xu hướng phá hoại của côn trùng gây hại, thời tiết, điều kiện môi trường, dạng liều dùng, phương pháp dùng, vị trí dùng, thời gian dùng, v.v..., nhưng ví dụ lượng dùng khoảng từ 0,001g đến 10kg, và tốt hơn là từ 0,01g đến 1kg hợp chất chứa thành phần hoạt tính trên 1000m² (10 A) được lựa chọn phù hợp tùy thuộc vào mục đích.

Hơn nữa, để mở rộng phạm vi của côn trùng gây hại đích cần được kiểm soát và thời gian dùng phù hợp để kiểm soát côn trùng gây hại, hoặc để giảm liều lượng, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế có thể được sử dụng sau khi được trộn với các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn khác, các tác nhân diệt ve bét, thuốc diệt giun tròn, chất khử vi trùng, thuốc trừ sâu sinh học và/hoặc các thuốc tương tự. Hơn nữa, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn có thể được sử dụng sau khi được trộn với các thuốc diệt cỏ, các chất điều tiết sự phát triển của cây, phân bón và/hoặc các chất tương tự phụ thuộc vào phương pháp dùng của nó.

Các ví dụ về các thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve bét và thuốc diệt côn trùng nông nghiệp và làm vườn khác này mà được sử dụng cho các mục đích nêu trên bao gồm

3,5-xylyl metylcarbamat (XMC), các độc tố protein tinh thể được tạo ra bởi khuẩn *Bacillus thuringiensis* như *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* và *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, các hợp chất trừ sâu lấy từ độc tố Bt, chlorfenson (CPCBS), diclodiisopropyl ete (DCIP), 1,3-diclopropen (D-D), DDT, NAC, O-4-dimetylsulfamoylphenyl O,O-dietyl phosphorothioat (DSP), O-etyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat (EPN), tripropylisoxyanurat (TPIC), acrinathrin, azadirachtin, azinphos-metyl, axequinocyl, axetamiprid, axetoprol, axephat, abamectin, avermectin-B, amidoflomet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, alpha-endosulfan, alpha-xypermethrin, albendazol, allethrin, isazofos, isamidofos, isoamidofos, isoxathion, isofenphos, isoprocarb (MIPC), ivermectin, imicyafos, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, esfenvalerat, ethiofencarb, ethion, ethiprol, etoxazol, ethofenprox, ethoprophos, etrimfos, emamectin, emamectin-benzoat, endosulfan, empenethrin, oxamyl, oxydemeton-metyl, oxydeprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, kali oleat, natri oleat, cadusafos, cartap, carbaryl, carbosulfan, carbofuran, gamma-cyhalothrin, xylylcarb, quinalphos, kinopren, chinomethionat, cloethocarb, clothianidin, clofentezin, chromafenozit, chlorantraniliprol, chloretoxyfos, chlordimeform, chlordan, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chlorphenapyr, chlorfenson, chlorfenvinphos, chlorfluazuron, clobenzilat, clobenzoat, kelthan (dicofol), salithion, xyanophos (CYAP), diafenthiuron, diamidafos, xyantraniliprol, theta-xypermethrin, dienochlor, xyenopyrafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-xypermethrin, diclofenthion (ECP), xycloprothrin, dichlorvos (DDVP), disulfoton, dinotefuran, xyhalothrin, xyphenothrin, xyfluthrin, diflubenzuron, xyflumetofen, diflovidazin, xyhexatin, xypermethrin, dimetylvinphos, dimethoat, dimefluthrin, silafluofen, xyromazin, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spirotetramat, spiromesifen, sulfluramid, sulprofos, sulfoxaflor, zeta-xypermethrin, diazinon, tau-fluvalinat, dazomet, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thioxyclam, thiosultap, thiosultap-natri, thionazin, thiometon, deet, dieldrin, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetrametylfluthrin, tetramethrin, tebupirimfos, tebufenozit, tebufenpyrad, tefluthrin, teflubenzuron,

demeton-S-metyl, temephos, deltamethrin, terbufos, tralopyril, tralomethrin, transfluthrin, triazamat, triazuron, trichlomit, trichlorphon (DEP), triflumuron, tolfenpyrad, naled (BRP), nithiazin, nitenpyram, novaluron, noviflumuron, hydropren, vaniliprol, vamidothion, parathion, parathion-metyl, halfenprox, halofenozit, bistrifluron, bisultap, hydrametylnon, tinh bột hydroxy propyl, binapacryl, bifenazat, bifenthrin, pymetrozin, pyraclofos, pyrafluprol, pyridafenthion, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprol, pyriproxifen, pirimicarb, pyrimidifen, pirimiphos-metyl, các pyrethrin, fipronil, fenazaquin, fenamiphos, phenisobromolat, fenitrothion (MEP), fenoxycarb, fenothiocarb, phenothrin, fenobucarb, fensulfothion, fenthion (MPP), phenthoat (PAP), fenvalerat, fenpyroximat, fenpropathrin, fenbendazol, fosthiazat, formetanat, butathiofos, buprofezin, furathiocarb, prallethrin, fluacrypyrim, fluazinam, fluazuron, fluensulfon, fluxycloxuron, flucythrinat, fluvalinat, flupyrazofos, flufenerim, flufenoxuron, flufenzin, flufenprox, fluproxyfen, flubrocycythrinat, flubendiamit, flumethrin, flurimfen, prothiofos, protrifenbut, flonicamid, propaphos, propargite (BPPS), profenofos, profluthrin, propoxur (PHC), bromopropylat, beta-xyfluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, heptenophos, permethrin, benclothiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximat, benfuracarb, phoxim, phosalon, fosthiazat, fosthietan, phosphamidon, phosphocarb, phosmet (PMP), các polynactin, formetanat, formothion, phorat, dầu máy, malathion, milbemycin, milbemycin-A, milbemectin, mecarbam, mesulfenfos, methomyl, metaldehyt, metaflumizon, methamidophos, metam-amoni, metam-natri, methiocarb, methidathion (DMTP), metylisothioxyanat, metylneodecanamit, metylparathion, metoxadiazon, metoxychlor, metoxyfenozit, metofluthrin, methopren, metolcarb, meperfluthrin, mevinphos, monocrotophos, monosultap, lambda-xyhalothrin, ryanodin, lufenuron, resmethrin, lepimectin, rotenon, levamisol hydroclorua, fenbutatin oxit, morantel tartarat, metyl bromit, trixyclohexyltin hydroxit (xyhexatin), canxi xyanamit, canxi polysulfua, lưu huỳnh và nicotin-sulfat.

Ví dụ về các thuốc khử vi trùng trong nông nghiệp và làm vườn được sử dụng cho cùng mục đích nêu trên bao gồm aureofungin, azaconazol, azithiram, acypetacs,

acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, azoxystrobin, anilazin, amisulbrom, ampropylfos, ametotradin, allyl alcohol, aldimorph, amobam, isotianil, isovaledion, isopyrazam, isoprothiolan, ipconazol, iprodion, iprovalicarb, iprobenfos, imazalil, iminoctadin, iminoctadin-albesilat, iminoctadin-triaxetat, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, echlomezol, edifenphos, etaconazol, ethaboxam, ethirimol, etem, etoxyquin, etridiazol, enestroburin, epoxiconazol, oxadixyl, oxycarboxin, đồng-8-quinolinolat, oxytetraxyclin, đồng-oxinat, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarat, axit oxolinic, oclthilidon, ofurace, orysastrobin, metam-natri, kasugamycin, carbamorph, carpropamit, carbendazim, carboxin, carvon, quinazamid, quinaxetol, quinoxifen, quinomethionat, captafol, captan, kiralaxyl, quinconazol, quintozen, guazatin, cufraneb, cuproban, glyodin, griseofulvin, climbazol, cresol, kresoxim-metyl, chlozolinet, clotrimazol, chlobenthiazon, chloraniformethan, chloranil, chlorquinox, clopicrin, chlorfenazol, clodinitronaphthalen, clothalonil, cloneb, zarilamid, salixylanilit, xyazofamid, diethyl pyrocacbonat, diethofencarb, xyclafuramid, diclocymet, diclozolin, diclobutrazol, dichlofluanid, xycloheximit, diclomezin, dicloran, diclophen, dichlon, disulfiram, ditalimfos, dithianon, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinoceton, dinosulfon, dinoterbon, dinobuton, dinopenton, dipyrithion, diphenylamin, difenoconazol, xyflufenamid, diflumetorim, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, xypendazol, simeconazol, dimethirimol, dimethomorph, xymoxanil, dimoxystrobin, metyl bromua, ziram, silthiofam, streptomycin, spiroxamin, sultropen, sedaxan, zoxamit, dazomet, thiadiazin, tiadinil, thiadifluor, thiabendazol, tioxyimid, thiochlorfenphim, thiophanat, thiophanat-metyl, thicyofen, thioquinox, chinomethionat, thifluzamit, thiram, decafentin, tecnazen, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, dehydroaxit axetic, tebuconazol, tebufloquin, dodixin, dodin, dodexyl benzensulfonat bis-etylen diamin đồng(II) (DBEDC), dodemorph, drazoxolon, triadimenol, triadimefon, triazbutil, triazoxit, triamiphos, triarimol, trichlamit, trixyclozol, triticonazol, tridemorph, tributyltin oxit, triflumizol, trifloxystrobin, triforin, tolylfluanid, tolclofos-metyl, natamycin, nabam, nitrothal-isopropyl, nitrostyren, nuarimol, đồng nonylphenol sulfonat, halacrinat, validamycin, valifenalat, harpin protein, bixafen, picoxystrobin,

picobenzamit, bithionol, bitertanol, hydroxyisoxazol, hydroxyisoxazol-kali, binapacryl, biphenyl, piperalin, hymexazol, pyraoxystrobin, pyracarbolid, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrametostrobin, pyrioferon, pyridinitril, pyrifenox, pyribencarb, pyrimethanil, pyroxychlor, pyroxyfur, pyroquilon, vinclozolin, famoxadon, fenapanil, fenamidon, fenaminosulf, fenarimol, fenitropan, fenoxanil, ferimzon, ferbam, fentin, fencpiclonil, fenpyrazamin, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fenhexamid, phthalit, buthiobat, butylamin, bupirimat, fuberidazol, blasticidin-S, furametpyr, furalaxyl, fluacrypyrim, fluazinam, fluoxastrobin, fluotrimazol, fluopicolit, fluopyram, fluoroimit, furcarbanil, fluxapyroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonil, flusilazol, flusulfamid, flutianil, flutolanil, flutriafol, furfural, furmexyclox, flumetover, flumorph, proquinazid, prochloraz, procymidon, prothiocarb, prothioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furophanat, probenazol, bromuconazol, hexaclobutadien, hexaconazol, hexylthiofos, bethoxazin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, pefurazoat, benquinox, penconazol, benzamorf, penxycuron, axit benzohydroxamic, bentaluron, benthiazol, benthiavalicarb-isopropyl, penthiopyrad, penflufen

boscalid, phosdiphen, fosetyl, fosetyl-Al, polyoxins, polyoxorim, polycarbamat, folpet, formaldehyt, dầu máy, maneb, mancozeb, mandipropamid, myclozolin, myclobutanil, mildiomyxin, milneb, mecarbinzid, methasulfocarb, metazoxolon, metam, metam-natri, metalaxyl, metalaxyl-M, metiram, metyl isothioxyanat, meptyldinocap, metconazol, metsulfovax, methfuroxam, metominostrobin, metrafenon, mepanipyrin, mefenoxam, meptyldinocap, mepronil, mebenil, iodometan, rabenzazol, benzalkoni clorua, thuốc khử vi trùng vô cơ như đồng clorua bazơ, đồng sulfat bazơ và bạc, natri hypochlorit, cupric hydroxit, lưu huỳnh ướt, canxi polysulfua, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, lưu huỳnh, đồng sulfat anhydrua, niken dimetyldithiocarbamat, các hợp chất đồng như đồng-8-quinolinolat (đồng oxin), kẽm sulfat và đồng sulfat pentahydrat.

Hơn nữa, ví dụ về thuốc diệt cỏ bao gồm hợp chất 1-naphthylaxetamid, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB,

3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-thioethyl, MCPB, ioxynil, aclonifen, azafenidin, acifluorfen, aziprotryn, azimsulfuron, asulam, axetochlor, atrazin, atraton, anisuron, anilofos, aviglyxin, axit abscisic, amicarbazon, amidosulfuron, amitrol, aminoxyclopyrachlor, aminopyralid, amibuzin, amiprofos-metyl, ametrion, ametryn, alachlor, allidochlor, alloxydim, alorac, isouron, isocarbamid, isoxachlortol, isoxapyrifop, isoxaflutol, isoxaben, isoxil, isonoruron, isoproturon, isopropalin, isopolinat, isomethiozin, inabenfit, ipazin, ipfencarbazon, iprymidam, imazaquin, imazapic, imazapyr, imazamethapyr, imazamethabenz, imazamethabenz-metyl, imazamox, imazethapyr, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, axit indolebutyric, uniconazol-P, eglinazin, esprocarb, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethalfluralin, ethiolat, ethychlozat-ethyl, ethidimuron, etinofen, ethephon, etoxysulfuron, etoxyfen, etnipromid, ethofumesat, etobenzanid, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargyl, oxaziclomefon, oxasulfuron, oxapyrazon, oxyfluorfen, oryzalin, orthosulfamuron, orbencarb, cafenstrol, cambendichlor, carbasulam, carfentrazon, carfentrazon-ethyl, karbutilat, carbetamit, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-ethyl, xylachlor, quinoclamin, quinonamid, quinclorac, quinmerac, cumyluron, clidinat, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P, credazin, clethodim, cloxyfonac, clodinafop, clodinafop-propargyl, clotoluron, clopyralid, cloproxydim, cloprop, chlorbromuron, clofop, clomazon, chlometoxynil, chlometoxyfen, clomeprop, chlorazifop, chlorazine, cloransulam, chloranocryl, chloramben, cloransulam-metyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-ethyl, chlorsulfuron, chlorthal, chlorthiamid, chlortoluron, chlornitrofen, chlorfenac, chlorfenprop, chlorbufam, chlorflurazol, chlorflurenol, chlorprocarb, chlorpropham, chlormequat, chloreturon, cloxynil, cloxuron, clopon, saflufenaxil, xyanazin, xyanatryn, di-allat, diuron, diethamquat, dicamba, xycluron, xycloat, xycloxydim, diclosulam, xyclosulfamuron, dichlorprop, dichlorprop-P, dichlobenil, diclofop, diclofop-metyl, dichlormat, dichloralure, diquat, cisanilit, disul, siduron, dithiopyr, dinitramin, cinidon-ethyl, dinosam, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenat, dinoprop, xyhalofop-butyl, diphenamid, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, xybutryn, xyprazin, xyprazol, diflufenican,

diflufenzopryr, dipropetryn, xypromid, xyperquat, gibberellin, simazin, dimexano,
 dimethachlor, dimidazon, dimethametryn, dimethenamid, simetryn, simeton,
 dimepiperat, dimefuron, xinmetylin, swep, sulglycapin, sulcotrion, sulfallat,
 sulfentrazon, sulfosulfuron, sulfometuron, sulfometuron-metyl, sebumeton,
 setoxydim, sebuthylazin, terbaxil, daimuron, dazomet, dalapon, thiazafluron,
 thiazopryr, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, tiocarbazil, tioclorim, thiobencarb,
 thidiazimin, thidiazuron, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, desmedipham,
 desmetryn, tetrafluron, thenylchlor, tebutam, tebuthiuron, terbumeton, tepraloxym,
 tefuryltrion, tembotrion, delachlor, terbaxil, terbucarb, terbuchlor, terbuthylazin,
 terbutryn, topramezone, tralkoxydim, triaziflam, triasulfuron, tri-allat, trietazin,
 tricamba, triclopyr, tridiphan, tritac, tritosulfuron, triflusulfuron, triflusulfuron-
 metyl, trifluralin, trifloxysulfuron, tripropindan, tribenuron-metyl, tribenuron, trifop,
 trifopsim, trimeturon, naptalam, naproanilit, napropamit, nicosulfuron, nitralin,
 nitrofen, nitrofluorfen, nipyraclufen, neburon, norflurazon, noruron, barban,
 paclobutrazol, paraquat, parafluron, haloxydine, haloxyfop, haloxyfop-P,
 haloxyfop-metyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, picloram,
 picolinafen, bixyclopyron, bispyribac, bispyribac-natri, pydanon, pinoxaden,
 bifenox, piperophos, hymexazol, pyraclonil, pyrasulfotol, pyrazoxyfen,
 pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazolat, bilanafos, pyraflufen-etyl, pyriclor,
 pyridafol, pyriothiobac, pyriothiobac-natri, pyridat, pyriftalid, pyributicarb,
 pyribenzoxim, pyrimisulfan, primisulfuron, pyriminobac-metyl, pyroxasulfon,
 pyroxsulam, fenasulam, phenisopham, fenuron, fenoxasulfon, fenoxaprop,
 fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, phenothiol, fenoprop, phenobenzuron, fenthiaaprop,
 fenteracol, fentrazamit, phenmedipham, phenmedipham-etyl, butachlor, butafenaxil,
 butamifos, buthiuron, buthidazol, butylat, buturon, butenachlor, butroxydim,
 butralin, flazasulfuron, flamprop, furyloxyfen, prynachlor, primisulfuron-metyl,
 fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazolat, fluroxypry, fluothiuron,
 fluometuron, fluoroglycofen, flurochloridon, fluorodifen, fluoronitrofen,
 fluoromidin, flucarbazon, flucarbazon-natri, fluchloralin, flucetosulfuron, fluthiacet,
 fluthiacet-metyl, flupyrasulfuron, flufenacet, flufenican, flufenpry, flupropacil,

flupropanate, flupoxam, flumioxazin, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumipropyn, flumezin, fluometuron, flumetsulam, fluridon, flurtamon, fluroxypyr, pretilachlor, proxan, proglinazin, procyazin, prodiamin, prosulfalin, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propachlor, propazin, propanil, propyzamit, propisochlor, prohydrojasmon, propyrisulfuron, propham, profluazol, profluralin, prohexadion-canxi, propoxycarbazon, propoxycarbazon-natri, profoxydim, bromaxil, brompyrazon, prometryn, prometon, bromoxynil, bromofenoxim, bromobutit, bromobonil, florasulam, hexacloaxeton, hexazinon, pethoxamid, benazolin, penoxsulam, pebulat, beflubutamid, vernolat, perfluidon, bencarbazon, benzadox, benzipram, benzylaminopurin, benzthiazuron, benzfendizone, bensulide, bensulfuron-metyl, benzoylprop, benzobixyclon, benzofenap, benzofluor, bentazon, pentanochlor, benthioncarb, pendimethalin, pentoxazon, benfluralin, benfuresat, fosamin, fomesafen, foramsulfuron, forchlorfenuron, maleic hydrazit, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, mesoprazin, methoprotryn, metazachlor, methazol, metazosulfuron, methabenzthiazuron, metamitron, metamifop, metam, methalpropalin, methiuron, methiozolin, methiobencarb, metyldymron, metoxuron, metosulam, metsulfuron, metsulfuron-metyl, metflurazon, metobromuron, metobenzuron, methometon, metolachlor, metribuzin, mepiquat-clorua, mefenacet, mefluidide, monalide, monisouron, monuron, monocloaxit axetic, monolinuron, molinat, morfamquat, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, iodobonil, iodometan, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenaxil, rhodethanil, canxi peroxit và metyl bromua.

Ví dụ về các thuốc trừ sâu sinh học bao gồm các chế phẩm virút như virút đa điện nhân gây bệnh bùng tằm (nuclear polyhedrosis viruses-NPV), virút hạt (granulosis viruses-GV), virút đa điện tế bào chất (cytoplasmic polyhedrosis viruses-CPV) và virút entomopox (EPV); thuốc trừ sâu vi khuẩn được sử dụng làm thuốc trừ sâu hoặc thuốc diệt giun tròn như khuẩn *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* và *Pasteuria penetrans*; các thuốc trừ sâu vi khuẩn được sử dụng làm thuốc khử vi khuẩn như

Trichoderma lignorum, *Agrobacterium radiobacter*, *Erwinia carotovora* và *Bacillus subtilis* không có khả năng gây bệnh; và các thuốc trừ sâu sinh học được sử dụng làm thuốc diệt cỏ như *Xanthomonas campestris*. Việc sử dụng kết hợp thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và làm vườn của sáng chế với thuốc trừ sâu sinh học nêu trên dưới dạng hỗn hợp có thể hi vọng tạo ra tác dụng tương tự như trên.

Ví dụ khác về các thuốc trừ sâu sinh học bao gồm các côn trùng ăn mồi sống trong tự nhiên như *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* và *Orius sauteri*; thuốc trừ sâu vi khuẩn như *Beauveria brongniartii*; và các pheromon như (Z)-10-tetradecenyl axetat, (E,Z)-4,10-tetradecadienyl axetat, (Z)-8-dodecenyl axetat, (Z)-11-tetradecenyl axetat, (Z)-13-icosen-10-on và 14-metyl-1-octadexen.

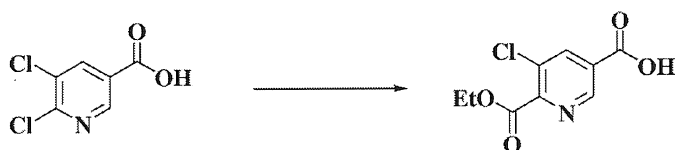
Ví dụ thực hiện sáng chế

Sau đây, các ví dụ điều chế các hợp chất tiêu biểu của sáng chế và các chất trung gian của chúng sẽ được mô tả chi tiết hơn, nhưng sáng chế không bị giới hạn chỉ ở các ví dụ này.

Các ví dụ tham khảo

Ví dụ điều chế chất trung gian (2)

Phương pháp điều chế axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic

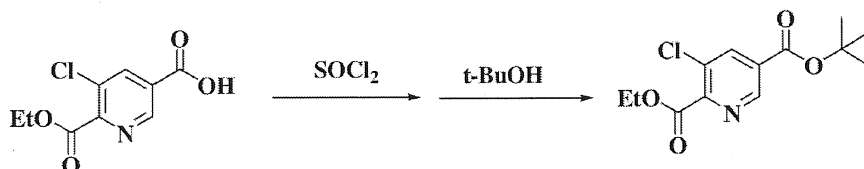


Bổ sung hỗn hợp DPPB (1,4-bis(diphenylphosphin)butan) (2,2 g, 10 mol%), triethylamin (14 g, 2,5 eq.) và $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (911 mg, 2,5 mol%) vào dung dịch axit 5,6-diclonicotinic (10 g, 52 mmol) trong etanol (60 mL) trong nồi chưng. Thay thế hệ phản ứng bằng carbon monoxit (CO áp suất: 4,0 MPa) và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 135°C trong thời gian 4 giờ. Bổ sung nước và axit clohydric 3N vào hỗn hợp phản ứng để axit hóa lớp nước, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc. Làm sạch chất rắn thu được bằng dung dịch hexan và etyl axetat theo tỷ lệ 2:1 (v/v) để tạo ra sản phẩm mong muốn,

axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic (10,9 g, 76%).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 9,02 (d, 1H), 8,44 (d, 1H), 4,42 (dd, 2H), 1,33 (t, 3H)

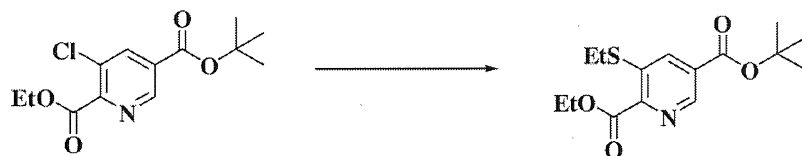
Phương pháp điều chế t-butyl este của axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic



Hòa tan axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic (10,9 g, 47,6 mmol) được điều chế theo bước trước đó trong toluen (30 mL). Bổ sung vào dung dịch, DMF (N,N-dimetylformamit) (4 mL). Sau khi bổ sung thionyl clorua (11 g, 2 eq.), làm nóng hỗn hợp trong khi khuấy ở nhiệt độ 90°C trong thời gian 3 giờ. Cho hỗn hợp phản ứng làm nguội lại đến nhiệt độ trong phòng, và sau đó cô đặc. Trong vật chứa tách rời, điều chế dung dịch hỗn hợp của t-butanol (35 mL, 10 eq.), THF (tetrahydrofuran) (100 mL), diisopropyletylamin (50 mL, 7 eq.) và DMAP (N,N-dimetyl-4-aminpyridin) (6 g, 1 eq.). Sau đó, bổ sung chậm lượng còn lại cô đặc nêu trên vào dung dịch dưới điều kiện làm mát bằng đá. Làm nóng hỗn hợp phản ứng trong điều kiện hồi lưu trong thời gian 3 giờ. Cho phép hỗn hợp phản ứng để làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước và etyl axetat và thực hiện chiết tách nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc. Đưa lượng còn lại vào sắc ký cột (hexan:etyl axetat = 5:1 (v/v)) để tạo ra sản phẩm mong muốn, t-butyl este của axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic (8,43 g, 62%).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 9,05 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 4,50 (dd, 2H), 1,61 (s, 9H), 1,44 (t, 3H)

Phương pháp điều chế t-butyl este của axit 5-etylthio-6-etoxycarbonylnicotinic

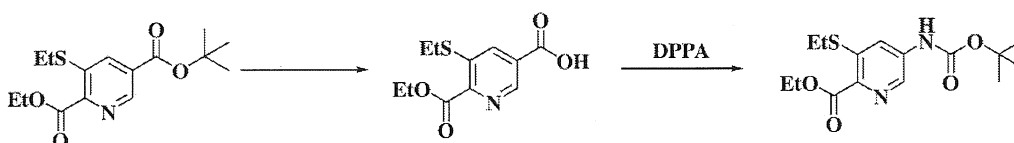


Hòa tan t-butyl este của axit 5-clo-6-etoxycarbonylnicotinic trong DMF (100 mL) (8,43 g, 21,65 mmol). Bổ sung chậm natri etanthiolat (2,27 g, 1 eq.) vào dung dịch dưới điều kiện làm mát bằng nước đá. Sau khi khuấy 5 phút, bổ sung nước vào

hỗn hợp, và sau đó bổ sung axit clohydric 0,5 N. Thực hiện chiết tách bằng etyl axetat nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc. Đưa lượng còn lại vào sắc ký cột (hexan:AcOEt = 5:1 (v/v)) để tạo ra sản phẩm mong muốn, t-butyl este của axit 5-ethylthio-6-etoxycarbonylnicotinic (6,17 g, 92%).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,91 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 4,49 (dd, 2H), 2,99 (dd, 2H), 1,61 (s, 9H), 1,45 (t, 3H), 1,40 (t, 3H)

Phương pháp điều chế etyl este của axit 3-ethylthio-5-t-butoxycarbonylaminipicolinic



Hòa tan t-butyl este của axit 5-ethylthio-6-etoxycarbonylnicotinic (6,17 g, 19,9 mmol) trong axit trifloaxetic (30 mL). Dung dịch được làm nóng dưới điều kiện hồi lưu trong thời gian 30 phút. Cô đặc hỗn hợp phản ứng, và bổ sung toluen và etyl axetat. Cô đặc lại hỗn hợp. Bổ sung vào lượng còn lại hỗn hợp t-butanol (100 mL), triethylamin (6,5 g, 3 eq.) và diphenylphosphoryl azit (DPPA) (11,74 g, 2 eq.). Sau khi khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 giờ, hồi lưu hỗn hợp trong thời gian 4 giờ. Cô đặc hỗn hợp phản ứng và đưa lượng còn lại vào sắc ký cột (hexan:etyl axetat = 2:1 (v/v)) để tạo ra sản phẩm mong muốn, etyl este của axit 3-ethylthio-5-t-butoxycarbonylaminipicolinic (3,63 g, 56 %).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,25 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 6,74 (s, 1H), 4,46 (dd, 2H), 2,97 (dd, 2H), 1,53 (s, 9H), 1,44 (t, 3H), 1,41 (t, 3H)

Phương pháp điều chế etyl este của axit 5-amin-3-ethylthiopicolinic

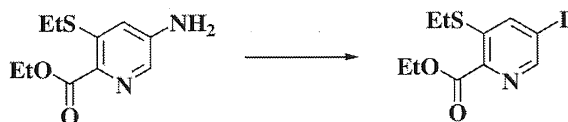


Hòa tan trong axit trifloaxetic (30 mL) hỗn hợp etyl este của axit 3-ethylthio-5-t-butoxycarbonylaminipicolinic (670 mg, 2,06 mmol), và khuấy dung dịch ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 30 phút. Cô đặc hỗn hợp phản ứng, và bổ sung nước, etyl axetat và kali cacbonat. Sau khi thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat

nhiều lần, làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột (hexan:AcOEt = 1:3 (v/v)) để tạo ra sản phẩm mong muốn, etyl este của axit 5-amin-3-ethylthiopicolinic (358 mg, 77%).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 7,89 (d, 1H), 6,80 (s, 1H), 4,43 (dd, 2H), 4,08 (s, 2H), 2,88 (dd, 2H), 1,56 (s, 9H), 1,42 (t, 3H), 1,40 (t, 3H)

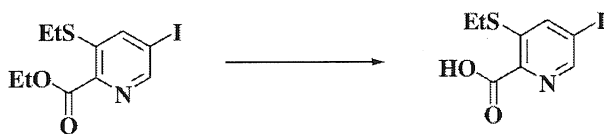
Phương pháp điều chế etyl este của axit 3-ethylthio-5-iodopicolinic



Hòa tan trong axetonitril (10 mL) etyl este của axit 5-amin-3-ethylthiopicolinic (1 g, 4,44 mmol). Bổ sung vào dung dịch dung dịch axit trifloaxetic (500 mg, 1 eq.) và axit p-toluensulfonic (2,6 g, 3 eq.). Làm mát hỗn hợp trong bể nước trong nhiệt độ khoảng 5°C . Trong vật chứa tách rời, điều chế dung dịch nước (10 mL) của kali iodua (2,25 g, 3 eq.) và natri nitrit (612 mg, 2 eq.). Bổ sung chậm hỗn hợp phản ứng nêu trên vào dung dịch và khuấy hỗn hợp trong thời gian 30 phút. Khuấy hỗn hợp thêm ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 30 phút. Bổ sung dung dịch nước natri thiosulfat vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ và cô đặc. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra sản phẩm mong muốn, etyl este của axit 3-ethylthio-5-iodopicolinic (761 mg, 51%).

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,61 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 4,45 (dd, 2H), 2,91 (dd, 2H), 1,43 (t, 3H), 1,39 (t, 3H)

Phương pháp điều chế axit 3-ethylthio-5-iodopicolinic

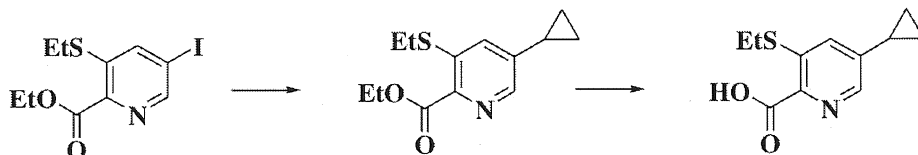


Hòa tan trong etanol (5 mL) etyl este của 3-ethylthio-5-iodo-2-pyridinaxit carboxylic (761 mg, 2,26 mmol). Bổ sung vào dung dịch, dung dịch nước natri hydroxit 3 M (1,2 mL, 1,5 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 5 phút, và bổ sung vào đó nước và axit clohydric 3 N. Thực hiện chiết tách bằng etyl axetat nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ và cô đặc để tạo ra sản phẩm mong

muốn, 3-ethylthio-5-iodopicolinic axit theo hiệu suất định lượng.

Tính chất vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 13,30 (brs, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 3,00 (dd, 2H), 1,24 (t, 3H)

Phương pháp điều chế axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic



Hòa tan trong dung môi hỗn hợp của toluen (40 mL) và nước (10 mL) etyl este của axit 3-ethylthio-5-iodopicolinic (2 g, 5,9 mmol), axit xyclopropylboronic (1,0 g, 2 eq.), kali phosphate (tribasic) (6,3 g, 5 eq.) và phức $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ -axeton (1,0 g, 0,2 eq.). Làm nóng hỗn hợp trong điều kiện hồi lưu trong thời gian 2 giờ. Sau khi làm mát, tôi hóa phản ứng bằng HCl 1 N. Thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat, và làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và sau đó cô đặc. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra etyl este của axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (1,32 g, 89%).

$^1\text{H-NMR}$: 8,19 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 4,46 (q, 2H), 2,92 (q, 2H), 1,97-1,90 (m, 1H), 1,46-1,37 (m, 6H), 1,13-1,10 (m, 2H), 0,82-0,78 (m, 2H)

Tổng hợp metyl este tương ứng, isopropyl este, n-butyl este, amit và metyl amit theo cách nêu trên.

Metyl este

$^1\text{H-NMR}$: 8,18 (d, 1H), 7,263 (s, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,93 (2H, q), 1,97-1,92 (m, 1H), 1,39 (t, 3H), 1,17-1,12 (m, 2H), 0,84-0,80 (m, 2H)

Isopropyl este

$^1\text{H-NMR}$: 8,20 (d, 2H), 2,27 (d, 2H), 5,33(m, 1H), 2,97-2,89(m, 2H), 1,96-1,91 (m, 1H), 1,45-1,37 (m, 9H), 1,14-1,10 (m, 2H), 0,92-0,82 (m, 2H)

N-butyl este

$^1\text{H-NMR}$: 8,19 (d, 2H), 7,27 (d, 1H), 4,40 (t, 2H), 2,92 (q, 2H), 1,94-1,91 (m, 1H), 1,82-1,77 (m, 2H), 1,46-1,39 (m, 5H), 1,15-1,10 (m, 2H), 0,98 (t, 3H), 0,83-0,78 (m, 2H)

Amit

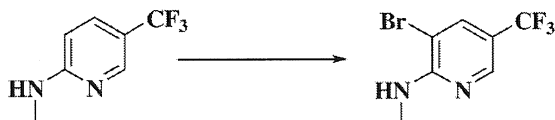
¹H-NMR: 8,00 (d, 1H), 7,77 (brs, 1H), 5,41 (brs, 1H), 2,90 (q, 2H), 1,944 (m, 1H), 1,41 (t, 3H), 1,13-1,11 (m, 2H), 0,81-0,80 (m, 2H)

Metyl amit

¹H-NMR: 7,97 (d, 2H), 7,92 (brs, 1H), 7,23 (s, 2H), 3,00 (d, 3H), 2,88 (q, 2H), 1,96-1,89 (m, 1H), 1,39 (t, 3H), 1,12-1,08 (m, 2H), 0,81-0,77 (m, 2H)

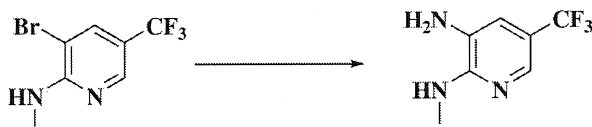
Hòa tan trong ethanol (10 mL) etyl este của axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (1,12 g, 4,5 mmol). Bổ sung vào dung dịch, dung dịch nước NaOH 15% (2,4 g, 2 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ, và hóa hơi ethanol. Bổ sung nước vào phần còn lại để hòa tan hoàn toàn nó. Bổ sung từng giọt vào dung dịch, HCl 1 N để điều chỉnh pH từ 3 đến 4. Thu chất rắn thu được bằng cách lọc, và hòa tan trong etyl axetat. Làm khô dung dịch qua natri sulfat khan và cô đặc để tạo ra axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (0,91 g, 91%).
¹H-NMR: 8,01 (d, 1H), 7,31 (d, 1H), 2,95 (q, 2H), 2,00-1,94 (m, 1H), 1,42 (t, 3H), 1,21-1,16 (m, 2H), 0,87-0,84 (m, 2H)

Ví dụ điều chế chất trung gian (3)



Bổ sung N-bromosuccinimide (4,27 g) vào hỗn hợp N-methyl-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-amin (3,48 g) và DMF (20 mL), và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 giờ. Bổ sung dung dịch nước amoni clorua bão hòa vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào silica gel sắc ký cột để tạo ra N-methyl-(3-bromo-5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-amin (4,8 g).

¹H-NMR (CDCl₃) δ : 3,08 (3H, d), 5,40 (1H, brs), 7,78 (1H, d), 8,34 (1H, s).

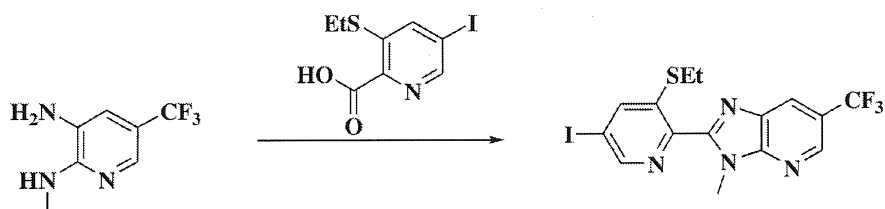


Đặt vào trong lò phản ứng chịu được áp suất hợp chất N-methyl-(3-bromo-5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-amin (0,51 g), đồng (II) axetylaxetonat (0,11 g),

axetylaxeton (0,20 g), xesi cacbonat (1,30 g), NMP (N-metylpyrrolidon) (2 mL) và amoni chứa nước 28% (1 mL). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 120°C trong thời gian 7 giờ và sau đó là 130°C trong thời gian 3 giờ. Sau khi hỗn hợp phản ứng được giữ lại để làm mát xuống nhiệt độ trong phòng, bổ sung dung dịch nước amoni clorua bão hòa vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào silica gel sắc ký cột để tạo ra N2-metyl-5-triflometylpyridin-2,3-diamin (0,28 g).

Các ví dụ tham khảo 1

Điều chế hợp chất 2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin



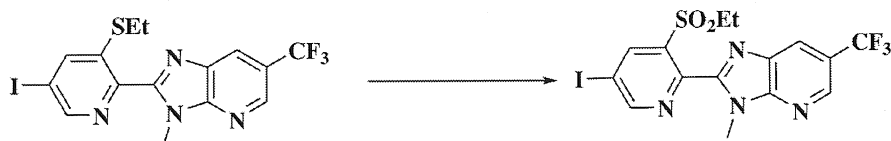
Hòa tan trong THF (5 mL) hỗn hợp pyridinaxit carboxylic (856 mg, 2,8 mmol) và 3-amin-2-metylamin-5-triflometylpyridin (690 mg). Bổ sung liên tục vào hỗn hợp trietylamin (1 mL), 4-dimetylaminpyridin (683 mg) và 1-metyl-2-clopyridinium iodua (1,1 g). Khuấy hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 30 phút và sau đó làm nóng dưới điều kiện hồi lưu trong thời gian 3 giờ. Sau khi cho phép hỗn hợp phản ứng để làm mát xuống nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat nhiều lần. Làm khô lớp hữu cơ và cô đặc. Hòa tan phần còn lại trong NMP (5 mL), và bổ sung axit p-toluensulfonic (1,5 g) vào dung dịch, sau đó khuấy ở nhiệt độ 150°C trong thời gian 1 giờ. Cho phép vật chứa phản ứng làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng và đưa hỗn hợp vào sắc ký cột để tạo ra imidazopyridin mong muốn (411 mg, 32%, mp: từ 89 đến 90°C).

Theo cách giống như nêu trên, tổng hợp 2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-3-metyl-6-tetrafloetyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (mp: từ 110 đến 112°C).

Các ví dụ tham khảo 2

Điều chế hợp chất 2-(3-ethylsulfonyl-5-iodopyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometyl-3H-

imidazo[4,5-b]pyridin

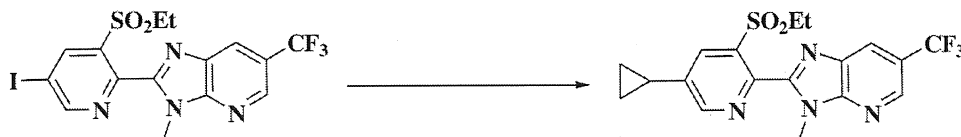


Hòa tan imidazopyridin (361 mg, 0,776 mmol) được tạo ra trong phản ứng trước trong ethyl axetat (5 mL). Bổ sung vào dung dịch, m-cloperaxit benzoic (455 mg), và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 2 giờ. Bổ sung một vài giọt FAMSO (metyl (metylsulfinyl)metyl sulfit) và triethylamin (1 mL) vào hỗn hợp phản ứng. Sau khi cô đặc, đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra sulfon mong muốn (378 mg, 98%, mp: từ 174 đến 175°C).

Theo cách giống như nêu trên, tổng hợp 2-(3-ethylsulfonyl-5-iodopyridin-2-yl)-3-metyl-6-tetrafloetyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (mp: từ 138 đến 140°C).

Ví dụ 1

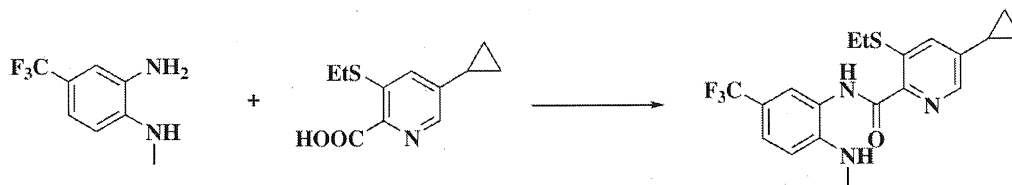
Điều chế hợp chất 2-(3-ethylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-3-metyl-6-pentafoetyl-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (Số hợp chất 1-15)



Hòa tan hỗn hợp sulfon (110 mg, 0,22 mmol) được tạo ra trong phản ứng trước và muối natri xyclopropylxyclic-triolborat (127 mg) trong DMF (2 mL). Bổ sung nước (400 μ L) vào dung dịch. Bổ sung vào hỗn hợp, [(diphenylphosphin)ferroxen]diclo paladi (18 mg) dưới điều kiện khí, và làm nóng hỗn hợp dưới điều kiện khuấy ở nhiệt độ 100°C trong thời gian 1 giờ. Cho phép hỗn hợp phản ứng làm mát xuống nhiệt độ trong phòng và sau đó cô đặc. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra xyclopropan mong muốn (75 mg, 82%).

Các ví dụ tham khảo 3

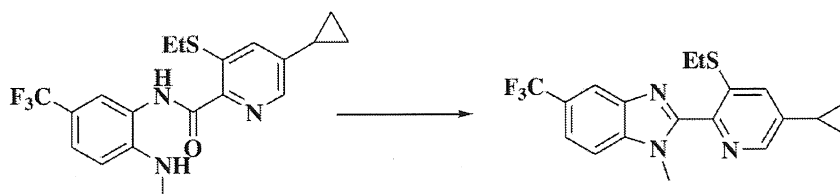
Điều chế hợp chất amit của axit N-(5-triflometyl-2-aminmetylphenyl)-3-etylthio-5-xyclopropyl-picolinic



Hòa tan axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (230 mg) trong pyridin (2 mL). Bổ sung hỗn hợp 1-hydroxybenzotriazole (13 mg, 0,1 eq.) và EDC (1-ethyl-3-(3-dimethylaminpropyl)carbodiimit hydroclorua) (400 mg, 2,0 eq.) vào dung dịch. Sau khi khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 10 phút, bổ sung 2-metylamin-6-triflometylanilin (200 mg, 1,0 eq.), và khuấy hỗn hợp thêm trong thời gian 2,5 giờ. Bổ sung dung dịch nước amoni clorua vào hỗn hợp, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và hóa hơi dung môi trong chân không để tạo ra amit của axit N-(5-triflometyl-2-aminmetylphenyl)-3-ethylthio-5-xyclopropyl-picolinic (470 mg, năng suất định lượng).

Ví dụ điều chế 1

Phương pháp điều chế hợp chất 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (Số hợp chất 7-13)

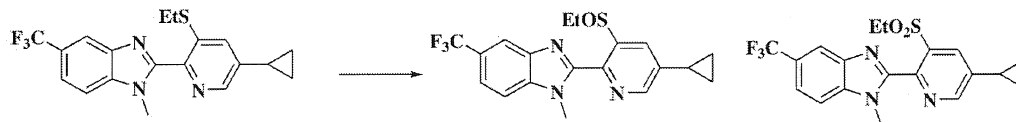


Hòa tan amit của axit N-(5-triflometyl-2-aminmetylphenyl)-3-ethylthio-5-xyclopropyl-picolinic (470 mg) trong toluen (1,5 mL). Bổ sung vào dung dịch dung dịch, axit axetic (1,5 mL). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 100°C trong thời gian 1,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (395 mg, 81%).

Ví dụ điều chế 2

Điều chế hợp chất 2-(3-ethylsulfinyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-

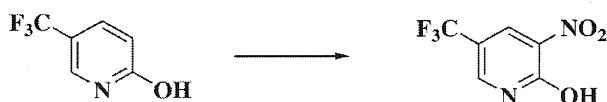
triflometyl-1H-benzimidazol (Số hợp chất 7-14) và 2-(3-ethylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (Số hợp chất 7-15)



Hòa tan 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (190 mg) trong etyl axetat (2ml). Bổ sung vào dung dịch, m-CPBA (axit m-cloperbenzoic) (185 mg, 1,5 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung dung dịch chứa nước natri thiosulfat vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylsulfinyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (55 mg, 30%) và 2-(3-ethylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-1-metyl-5-triflometyl-1H-benzimidazol (84 mg, 45%).

Các ví dụ tham khảo 4

Điều chế hợp chất 5-triflometylpyridin-3-nitro-2-ol



Hòa tan 5-triflometylpyridin-2-ol (500 mg) trong axit sulfuric (6 mL). Bổ sung axit nitric vào dung dịch dưới điều kiện làm mát bằng nước đá. Sau khi nâng nhiệt độ lên đến nhiệt độ trong phòng, khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 1,5 giờ, và sau đó làm nóng dưới điều kiện khuấy ở nhiệt độ 70°C trong thời gian 4 giờ. Bổ sung nước vào hỗn hợp, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng cách bổ sung natri sulfat và hóa hơi dung môi để tạo ra 5-triflometylpyridin-3-nitro-2-ol (426 mg, độ tinh khiết: khoảng 50%).

Các ví dụ tham khảo 5

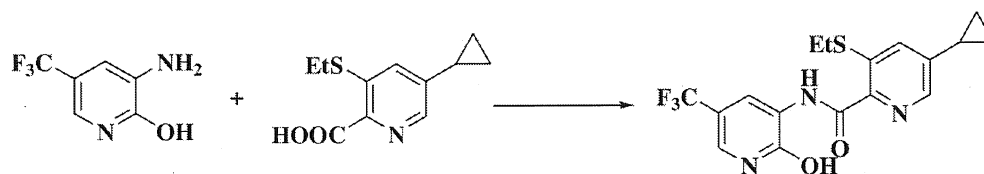
Điều chế hợp chất 3-amin-5-triflometylpyridin-2-ol



Hòa tan 5-triflometylpyridin-3-nitro-2-ol (420 mg) vào etanol (4 mL). Bỏ sung vào dung dịch, dung dịch ammoni clorua (110 mg, 1,0 eq.) trong nước (1 mL). Bỏ sung bột sắt (560 mg, 5,0 eq.) vào dung dịch dưới điều kiện khuấy ở nhiệt độ trong phòng, và khuấy hỗn hợp dưới điều kiện làm nóng và hồi lưu trong thời gian 1,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của nguyên liệu, loại bỏ kim loại và các tạp chất khác bằng cách lọc qua Celite. Hóa hơi dung môi và làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 3-amin-5-triflometylpyridin-2-ol (102 mg, 19%).

Các ví dụ tham khảo 6

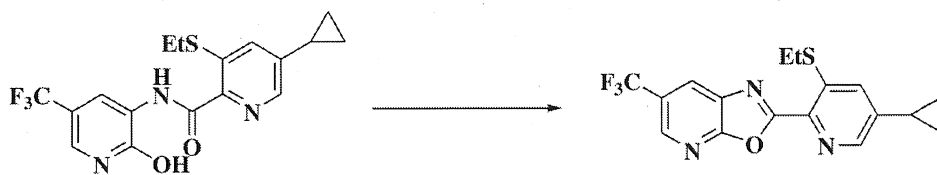
Phương pháp điều chế hợp chất amit của axit N-(5-triflometyl-2-hydroxypyridin-3-yl)-3-etylthio-5-xyclopropyl-picolinic



Hòa tan axit 3-etylthio-5-xyclopropylpicolinic (140 mg) trong pyridin (2 mL). Bỏ sung vào dung dịch, hỗn hợp 1-hydroxybenzotriazol (8 mg, 0,1 eq.) và EDC (215 mg, 2,0 eq.). Sau khi khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 10 phút, bỏ sung 3-amin-5-triflometylpyridin-2-ol (100 mg, 1,0 eq.) vào hỗn hợp, và khuấy hỗn hợp thêm trong thời gian 2,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu, bỏ sung dung dịch chứa nước amoni clorua vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat và hóa hơi dung môi trong chân không để tạo ra amit của axit N-(5-triflometyl-2-hydroxypyridin-3-yl)-3-etylthio-5-xyclopropyl-picolinic (132 mg, 62%).

Ví dụ 2

Điều chế hợp chất 2-(3-etylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-oxazolo[5,4-b]pyridin (Số hợp chất 3-13)



Hòa tan amit của axit N-(5-triflometyl-2-hydroxypyridin-3-yl)-3-etylthio-5-xylopropyl-picolinic (130 mg) trong toluen (1 mL). Bổ sung vào dung dịch triphenylphosphin (270 mg, 3,0 eq.) và bis(2-metoxetyl) azodicarboxylat (240 mg, 3,0 eq.) ở nhiệt độ trong phòng. Khuấy hỗn hợp dưới điều kiện làm nóng ở nhiệt độ 50°C trong thời gian 3 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra hợp chất mong muốn (64 mg, 52%).

Ví dụ 3

Phương pháp điều chế hợp chất 2-(3-ethylsulfonyl-5-xylopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-oxazolo[5,4-b]pyridin (Số hợp chất 3-15)



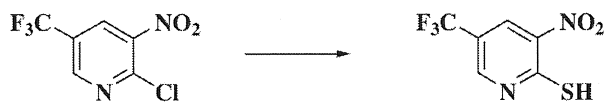
Hòa tan hợp chất 2-(3-etylthio-5-xylopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-oxazolo[5,4-b]pyridin (130 mg, 1,0 eq.) trong etyl axetat (1 mL). Bổ sung vào dung dịch, m-CPBA (106 mg, 2,5 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung dung dịch chứa nước natri thiosulfat vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylsulfonyl-5-xylopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-oxazolo[5,4-b]pyridin (60 mg, 94%).

Điều chế hợp chất số 8-12, 8-15, 8-18 và 2-15 từ các hợp chất đã biết, lần lượt là 2-amin-4-(triflometylthio)phenol, 2-amin-4-(triflometyl)phenol, 2-amin-4-

(pentafluorophenyl)phenol, và N3-methyl-6-(trifluoromethyl)pyridin-3,4-diamin, theo cách giống như Ví dụ nêu trên.

Các ví dụ tham khảo 7

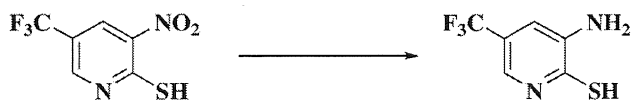
Điều chế hợp chất 5-trifluoromethyl-2-mercapto-3-nitropyridin



Hòa tan 2-clo-5-trifluoromethyl-3-nitropyridin (500 mg) vào DMF (4 mL). Bổ sung vào dung dịch, natri hydrogen sulfit (150 mg, 1,2 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng ethyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfate, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 5-trifluoromethyl-2-mercapto-3-nitropyridin (193 mg, 39%).

Các ví dụ tham khảo 8

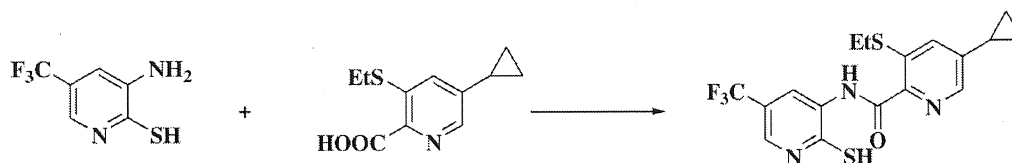
Điều chế hợp chất 3-amin-5-trifluoromethyl-2-mercaptopyridin



Hòa tan 5-trifluoromethyl-2-mercapto-3-nitropyridin (190 mg) trong etanol (2 mL). Bổ sung vào dung dịch, dung dịch ammoni clorua (45 mg, 1 eq.) trong nước (0,5 mL). Bổ sung bột sắt (240 mg, 5,0 eq.) vào dung dịch dưới điều kiện khuấy ở nhiệt độ trong phòng, và khuấy hỗn hợp dưới điều kiện hồi lưu trong thời gian 5,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của nguyên liệu bằng TLC, loại bỏ các kim loại bằng cách lọc qua Celite. Hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 3-amin-5-trifluoromethyl-2-mercaptopyridin (70 mg, 46%).

Các ví dụ tham khảo 9

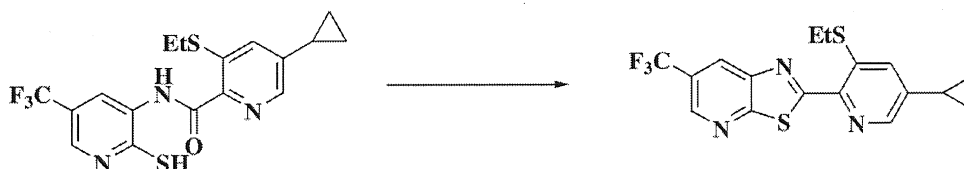
Phương pháp điều chế hợp chất amit của axit N-(5-trifluoromethyl-2-mercaptopyridin-3-yl)-3-ethylthio-5-cyclopropyl-picolinic



Hòa tan axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (96 mg) trong pyridin (1,5 mL). Bổ sung vào dung dịch, hỗn hợp 1-hydroxybenzotriazol (5 mg, 0,1 eq.) và EDC (165 mg, 2,4 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 20 phút. Bổ sung từng giọt vào hỗn hợp, dung dịch 3-amin-5-triflometyl-2-mercaptopyridin (70 mg, 1,0 eq.) trong pyridin (2 mL) và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 4 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phân chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat và hóa hơi dung môi để tạo ra hợp chất amit của axit N-(5-triflometyl-2-mercaptopyridin-3-yl)-3-ethylthio-5-xyclopropyl-picolinic thô (160 mg).

Ví dụ 4

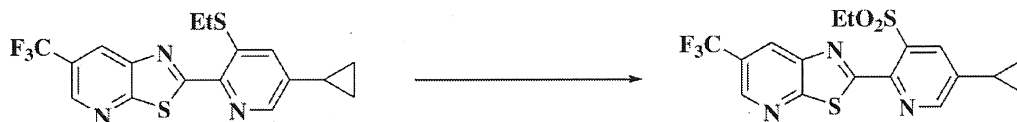
Phương pháp điều chế hợp chất 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-thiazolo[5,4-b]pyridin (Số hợp chất 5-13)



Hòa tan hợp chất amit của axit N-(5-triflometyl-2-mercaptopyridin-3-yl)-3-ethylthio-5-xyclopropyl-picolinic thô (160 mg) trong NMP (1 mL). Bổ sung vào dung dịch, axit p-toluensulfonic (115 mg). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 150°C trong thời gian 2 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phân chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-thiazolo[5,4-b]pyridin (64 mg, 47%).

Ví dụ 5

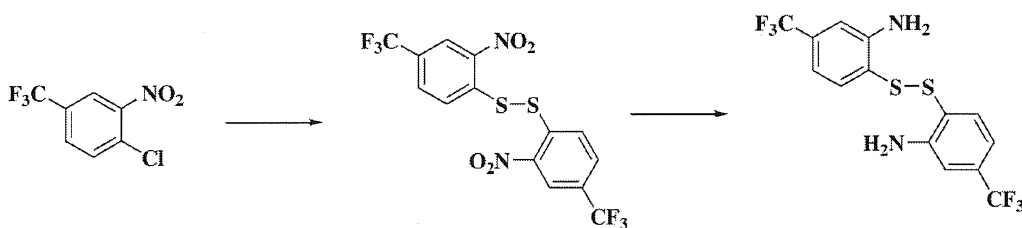
Điều chế hợp chất 2-(3-etylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-thiazolo[5,4-b]pyridin (Số hợp chất 5-15)



Hòa tan hợp chất 2-(3-ethylthio-5-cyclopropylpyridin-2-yl)-5-trifluoromethyl-thiazolo[5,4-b]pyridin (55 mg) trong etyl axetat (1 mL). Bổ sung vào dung dịch, m-CPBA (82 mg, 2,2 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu, bổ sung dung dịch chứa nước natri thiosulfat vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylsulfonyl-5-cyclopropylpyridin-2-yl)-5-trifluoromethyl-thiazolo[5,4-b]pyridin (15 mg, 28%).

Các ví dụ tham khảo 10

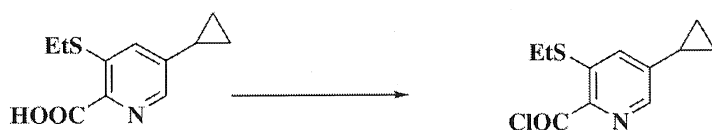
Phương pháp điều chế hợp chất 6,6-disulfandiylbis(3-trifluorometylanilin)



Hòa tan 4-trifluoromethyl-2-nitroclobenzen (2,0 g) vào DMF (15 mL). Bổ sung vào dung dịch, natri hydrogen sulfit (1,0 g, 2,0 eq.) ở nhiệt độ trong phòng, và khuấy hỗn hợp trong thời gian 5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat để tạo ra sản phẩm thô (1,65 g, độ tinh khiết: <50%). Hòa tan sản phẩm thô trong ethanol (15 mL), và bổ sung dung dịch amoni clorua (200 mg) trong nước (5 mL) vào hỗn hợp. Bổ sung bột sắt (2,1 g, lượng dư) vào dung dịch dưới điều kiện khuấy ở nhiệt độ trong phòng, và khuấy hỗn hợp dưới điều kiện làm nóng và hồi lưu trong thời gian 2 giờ. Loại bỏ các kim loại bằng cách lọc qua Celite. Hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 6,6-disulfandiylbis(3-trifluorometylanilin) (274 mg, 16%).

Các ví dụ tham khảo 11

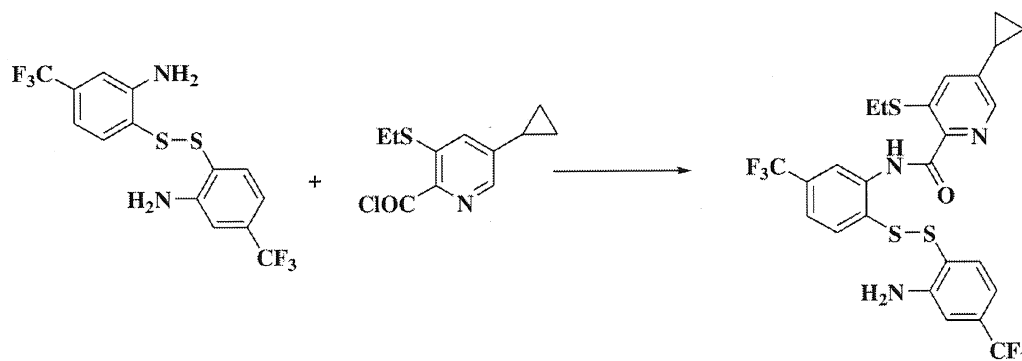
Phương pháp điều chế hợp chất axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic clorua



Hòa tan axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic (220 mg) trong THF (1 mL). Bổ sung vào dung dịch, lượng xúc tác DMF. Bổ sung từng giọt oxalyl clorua (150 mg, 1,2 eq.) vào dung dịch, và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 5 giờ. Hóa hơi dung môi để tạo ra axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic clorua.

Các ví dụ tham khảo 12

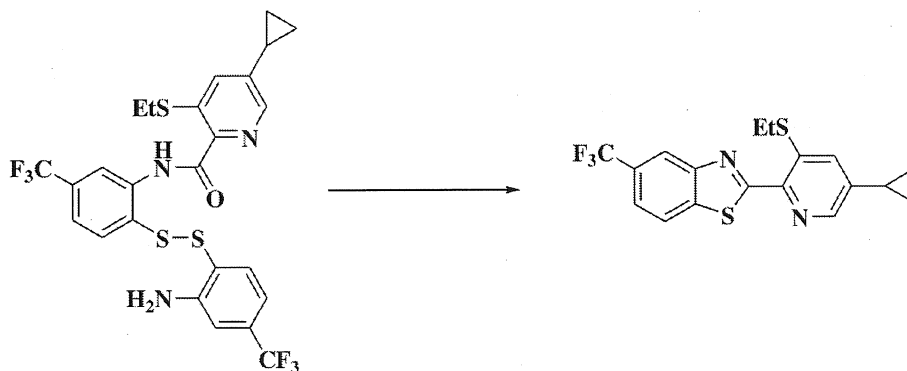
Phương pháp điều chế hợp chất amit của axit N-(2-((2-amin-4-triflometylphenyl)disulfanyl)-5-triflophenyl)-5-xyclopropyl-3-ethylthiopicolinic



Hòa tan 6,6-disulfandiylbis(3-triflometyl anilin)(150 mg) trong THF (1 mL). Bổ sung vào dung dịch, trietylamin (158 mg, 4,0 eq.). Bổ sung dần dần vào hỗn hợp, axit 3-ethylthio-5-xyclopropylpicolinic clorua, và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ. Bổ sung nước vào hỗn hợp, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra amit của axit N-(2-((2-amin-4-triflometylphenyl)disulfanyl)-5-triflophenyl)-5-xyclopropyl-3-ethylthiopicolinic (134 mg, 58%).

Ví dụ 6

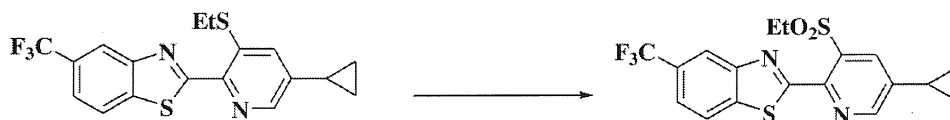
Điều chế hợp chất 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometylbenzothiazol (Số hợp chất 9-10)



Hòa tan amit của axit picolinic được điều chế theo bước trên (130 mg) trong NMP (2 mL), và sau đó bổ sung Rongalit (51 mg, 1,5 eq.) vào dung dịch dưới điều kiện khí argon. Bổ sung vào hỗn hợp, axit p-toluensulfonic monohydrat (63 mg, 1,5 eq.), và khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 150°C trong thời gian 1 giờ. Bổ sung nước vào hỗn hợp, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-benzothiazol (66 mg, 79%).

Ví dụ 7

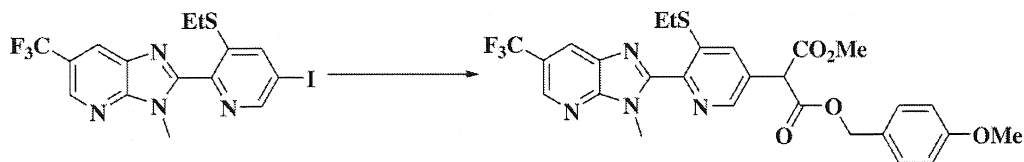
Điều chế hợp chất 2-(3-ethylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-benzothiazol (Số hợp chất 9-12)



Hòa tan 2-(3-ethylthio-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-benzothiazol (50 mg) trong etyl axetat (1ml). Bổ sung vào hỗn hợp, m-CPBA (76 mg, 2,2 eq.). Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 2,5 giờ. Sau khi xác định sự biến mất của của nguyên liệu bằng TLC, bổ sung dung dịch chứa nước natri thiosulfat vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Khử nước phần chiết tách bằng việc bổ sung natri sulfat, và hóa hơi dung môi bằng việc bổ sung silica gel. Làm sạch phần còn lại bằng sắc ký cột để tạo ra 2-(3-ethylsulfonyl-5-xyclopropylpyridin-2-yl)-5-triflometyl-benzothiazol (15 mg, 28%).

Các ví dụ tham khảo 13

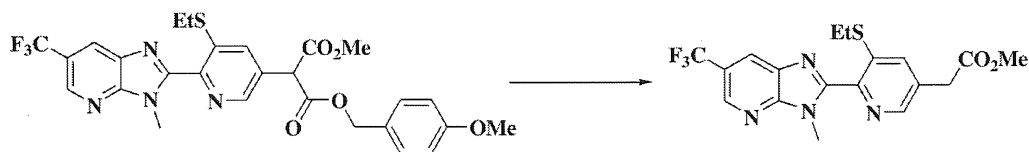
Phương pháp điều chế hợp chất 1-(4-metoxymethyl)-3-metyl 2-(5-ethylthio-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)malonat



Hòa tan hỗn hợp 2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (1,1 g, 2,4 mmol), đồng(I) iodua (0,09 g, 0,2 eq.), axit picolinic (0,12 g, 0,4 eq.), metyl p-metoxymethyl malonat (0,68 g, 1,2 eq.) và xesi cacbonat (3,1 g, 4 eq.) trong THF (48 mL). Khuấy dung dịch ở nhiệt độ 60°C trong thời gian 1 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, bổ sung dung dịch nước amoni clorua bão hòa vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra 1-(4-metoxymethyl)-3-metyl 2-(5-ethylthio-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)malonate (1,4 g).

Các ví dụ tham khảo 14

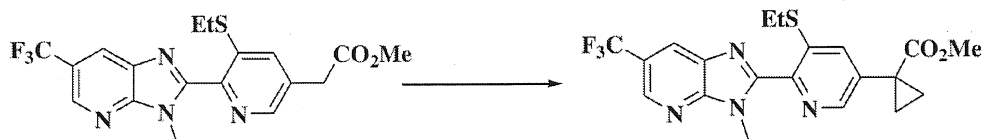
Phương pháp điều chế hợp chất metyl 2-(5-ethylthio-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)axetat



Hòa tan este của axit malonic (1,4 g, 2,4 mmol) được tạo ra theo bước trước đó trong axit trifloaxetic (10 mL), và khuấy dung dịch ở nhiệt độ 50°C trong thời gian 2 giờ. Sau khi cô đặc, đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra metyl 2-(5-ethylthio-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)axetat (818 mg, 82%).

Các ví dụ tham khảo 15

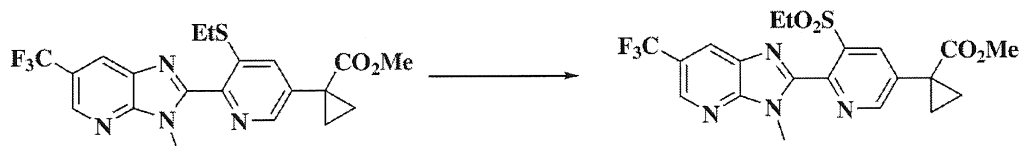
Metyl 1-(5-ethylthio-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)cyclopropanecarboxylat



Hòa tan este của axit axetic (818 mg, 2,0 mmol) được tạo ra theo bước trước đó trong DMF (20 mL), và sau đó bổ sung 1,2-dibromoetan (1,5 g, 4 eq.) vào dung dịch. Sau khi làm mát đến 0°C, bổ sung 60% NaH (160 mg, 2 eq.) vào hỗn hợp. Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 0°C trong thời gian 1 giờ, và sau đó khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ. Bổ sung từng giọt hỗn hợp phản ứng vào dung dịch nước HCl 1N. Sau khi chiết tách bằng etyl axetat, làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra methyl 1-(5-ethylthio-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropancarboxylat (700 mg, 80%).

Ví dụ 8

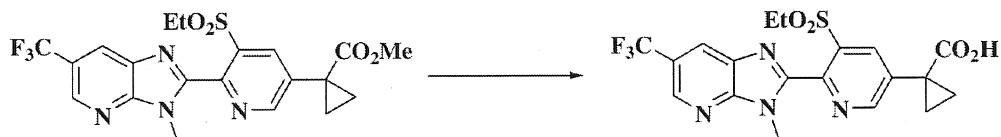
Metyl 1-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropancarboxylat (Số hợp chất 11-2)



Hòa tan hợp chất este xyclopropanaxit carboxylic (510 mg, 1,1 mmol) được tạo ra theo bước trước trong etyl axetat (10 mL), và sau đó bổ sung m-CPBA 65% (670 mg, 2 eq.) vào dung dịch. Sau khi khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ, bổ sung FAMSO và trietylamin vào hỗn hợp. Cô đặc dung dịch và đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra methyl 1-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropancarboxylat (530 mg, 97%).

Ví dụ 9

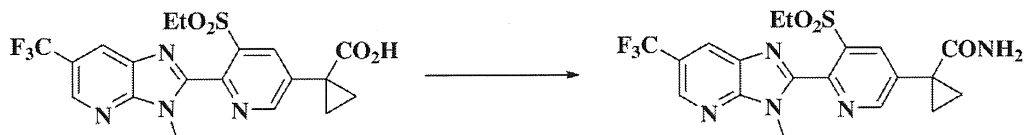
Phương pháp điều chế hợp chất axit 1-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropan carboxylic (Số hợp chất 11-1)



Hòa tan hợp chất este xyclopropanaxit carboxylic (530 mg, 1,1 mmol) được tạo ra theo bước trước đó trong metanol (10 mL), và sau đó bổ sung dung dịch nước natri hydroxit 15% (0,3 g, 1,1 eq.) vào dung dịch. Khuấy hỗn hợp ở 40°C trong thời gian 2 giờ, và bổ sung nước vào hỗn hợp. Sau khi hóa hơi metanol, điều chỉnh pH đến 4 bằng HCl 1 N. Sau khi chiết tách bằng etyl axetat, làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và hóa hơi dung môi để tạo ra axit 1-(5-etylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropan carboxylic (510 mg, 99%).

Ví dụ 10

Phương pháp điều chế hợp chất amit của axit 1-(5-etylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropan carboxylic (Số hợp chất 11-6)



Hòa tan hợp chất axit xyclopropanecarboxylic (530 mg, 1,1 mmol) được tạo ra theo bước trước đó trong THF (10 mL), và sau đó bổ sung oxalyl clorua (160 mg, 1,1 eq.) vào dung dịch. Khuấy dung dịch ở nhiệt độ phòng trong thời gian 1 giờ, và cô đặc dung dịch để tạo ra axit clorua (500 mg, 90%). Bổ sung dần dần axit clorua (360 mg, 0,76 mmol) vào amoni chứa nước 28% (5 mL). Sau khi khuấy ở nhiệt độ phòng trong thời gian 1 giờ, thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và cô đặc. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra hợp chất amit của axit 1-(5-etylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropanecarboxylic (300 mg, 87%).

Ví dụ 11

Phương pháp điều chế hợp chất 1-(5-etylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-

imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)xyclopropanecarbonitril (Số hợp chất 11-13)

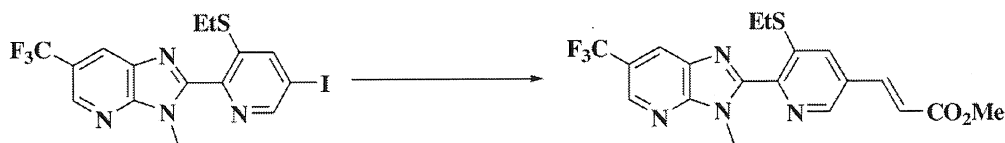


Hòa tan hợp chất amit của axit xyclopropanecarboxylic (300 mg, 0,66 mmol) được tạo ra theo bước trước đó trong DMF (2 mL), và sau đó bổ sung phosphorus oxyclorua (41 mg, 0,4 eq.) vào dung dịch. Sau khi khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 giờ, bổ sung dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa vào hỗn hợp. Sau khi chiết tách bằng etyl axetat, làm khô phần chiết tách qua natri sulfat khan và cô đặc. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra hợp chất 1-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)xyclopropanecarbonitril (150 mg, 52%).

Tạo ra hợp chất số 18-173 và 2-13 từ các hợp chất đã biết, lần lượt là 2-amin-4-(trifluoromethylthio)phenol và N3-methyl-6-(trifluoromethyl)pyridin-3,4-diamin, theo cách giống như Ví dụ nêu trên.

Các ví dụ tham khảo 16

Phương pháp điều chế hợp chất methyl 3-(5-ethylthio-6-(3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)acrylat



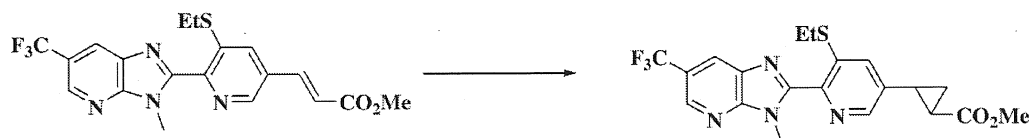
Bổ sung vào 2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (1700 mg) hỗn hợp methyl acrylat (630 mg), paladi(II) axetat (82 mg), tri(o-tolyl)phosphin (220 mg), N,N-diisopropyletylamin (940 mg) và dimetylformamit (36 mL). Sau khi thay thế không khí bằng khí argon, khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ 90°C trong thời gian 3 giờ. Sau khi cho phép hỗn hợp phản ứng để làm mát xuống nhiệt độ trong phòng, bổ sung nước vào hỗn hợp và thực hiện chiết tách bằng etyl axetat. Làm sạch lớp hữu cơ bằng nước muối biển bão hòa. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat khan, và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào

silica gel sắc ký cột để tạo ra hợp chất methyl 3-(5-ethylthio-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)acrylat (1100 mg).

Tính chất vật lý: điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 159 đến 161°C

Các ví dụ tham khảo 17

Điều chế hợp chất methyl 2-(5-ethylthio-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropanecarboxylat

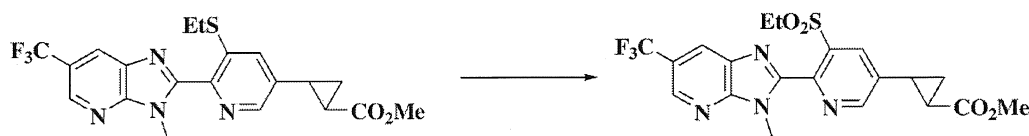


Bổ sung natri hydrua (6 mg) vào dung dịch hỗn hợp của trimetylsulfoxonium iodua (26 mg) và DMSO (dimetyl sulfoxit) (0,6 mL), và sau đó khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 30 phút. Bổ sung dung dịch hỗn hợp của ester (50 mg) được tạo ra theo bước trước đó và THF (0,6 mL) vào dung dịch hỗn hợp ở nhiệt độ 0°C. Khuấy hỗn hợp trong thời gian 20 phút, và khuấy thêm ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ. Bổ sung nước đá vào hỗn hợp, và thực hiện việc chiết tách bằng etyl axetat. Làm sạch lớp hữu cơ bằng nước muối biển bão hòa. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat khan, và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột silica gel để tạo ra methyl 2-(5-ethylthio-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropanecarboxylat (16 mg).

Tính chất vật lý: điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 118 đến 120°C

Ví dụ 12

Điều chế hợp chất methyl 2-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin)-3-yl)xyclopropanecarboxylat (Số hợp chất 11-82)



Bổ sung m-CPBA (23 mg) vào dung dịch hỗn hợp của methyl este của axit xyclopropanecarboxylic (16 mg) được tạo ra theo bước trước đó và etyl axetat (0,4

mL) ở nhiệt độ 0°C, và sau đó khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 2 giờ. Bổ sung vào hỗn hợp phản ứng dung dịch natri hydrogen thiosulfat bão hòa, và thực hiện việc chiết tách bằng ethyl axetat. Làm sạch lớp hữu cơ bằng dung dịch nước natri bicarbonat bão hòa và sau đó bằng nước muối biển bão hòa. Làm khô lớp hữu cơ qua natri sulfat khan, và cô đặc trong chân không. Đưa phần còn lại vào sắc ký cột để tạo ra hợp chất methyl 2-(5-ethylsulfonyl-6-(3-methyl-6-trifluoromethyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)xyclopropanecarboxylat (8,0 mg).

Sau đây, các ví dụ bào chế được thể hiện, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở đó. Trong các ví dụ bào chế, “các phần” có nghĩa là phần theo trọng lượng.

Ví dụ bào chế 1

Hợp chất theo sáng chế	10 phần
Xylen	70 phần
N-methyl pyrrolidon	10 phần
Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi alkylbenzen sulfonat	10 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều để hòa tan tạo ra chất cô đặc nhũ hóa.

Ví dụ bào chế 2

Hợp chất theo sáng chế	3 phần
Bột sét	82 phần
Bột diatomit	15 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều và sau đó được nghiền vụn để tạo ra bột.

Ví dụ bào chế 3

Hợp chất theo sáng chế	5 phần
Hỗn hợp bột bentonit và bột sét	90 phần
Canxi lignosulfonat	5 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều. Sau khi bổ sung thể tích nước thích hợp, hỗn hợp được nhào trộn, được tạo hạt và được làm khô để tạo ra hạt.

Ví dụ bào chế 4

Hợp chất theo sáng chế	20 phần
------------------------	---------

Cao lanh và axit silic phân tán cao tổng hợp 75 phần

Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi

alkylbenzen sulfonat 5 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều và sau đó được nghiền vụn để tạo ra bột ướt.

Sau đây, các ví dụ thử nghiệm liên quan đến sáng chế được thể hiện, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở đó.

Ví dụ thử nghiệm 1

Thử nghiệm tác dụng kiểm soát đối với rệp đào *Myzus persicae*

Cây cải bắp Trung Quốc được trồng trong các chậu nhựa (đường kính: 8cm, chiều cao: 8cm), rệp đào (*Myzus persicae*) được lan truyền trên các cây, và số lượng rệp đào sống sót trong mỗi chậu được đếm. Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng được phân tán tách rời trong nước và được pha loãng đến 500 ppm, và các hệ phân tán nông hóa học được dùng cho tán lá của cây cải bắp Trung Quốc. Sau khi cây được làm khô bằng không khí, các chậu được giữ trong nhà kính. 6 ngày sau khi dùng cho tán lá, số lượng rệp đào sống sót trên cây cải bắp Trung Quốc trong mỗi chậu được đếm, tốc độ kiểm soát được tính theo công thức dưới đây, và hiệu quả kiểm soát được đánh giá theo tiêu chí dưới đây.

$$\text{Tốc độ kiểm soát} = 100 - \{(T \times Ca)/(Ta \times C)\} \times 100$$

Ta: số lượng rệp sống sót trước khi dùng cho tán lá trong chậu được xử lý

T: số lượng rệp sống sót sau khi dùng cho tán lá trong chậu được xử lý

Ca: số lượng rệp sống sót trước khi dùng cho tán lá trong chậu không được xử lý

C: số lượng rệp sống sót sau khi dùng cho tán lá trong chậu không được xử lý

Tiêu chí

A: tốc độ kiểm soát là 100%.

B: tốc độ kiểm soát là 90 đến 99%.

C: tốc độ kiểm soát là 80 đến 89%.

D: tốc độ kiểm soát là 50 đến 79%.

Kết quả là, các hợp chất 1-15, 1-16, 1-18, 2-15, 3-13, 3-15, 5-13, 5-15, 7-13,

7-14, 7-15, 8-10, 8-12, 8-15, 8-16, 8-18, 9-10, 9-12, 11-1, 11-2, 11-3, 11-6, 11-10, 11-13, 11-14, 11-16, 11-27, 11-50, 11-53, 11-60, 11-68, 11-73, 11-80, 11-81, 11-82, 11-86, 11-93, 11-94, 11-96, 11-131, 11-140, 11-141, 11-148, 12-1, 12-2, 12-6, 12-13, 18-1, 18-2, 18-6, 18-13, 18-161, 18-162, 18-166, 18-173, 18-174, 18-176, 18-187, 18-210, 18-211, 18-213, 18-220, 18-221, 18-228, 18-233, 18-234, 20-2, 20-21, 20-22, 20-24, 20-26, 20-39, 20-41, 20-42, 20-44, 20-45, 20-46, và 20-53 theo sáng chế được thể hiện mức hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 2

Thử nghiệm hiệu quả trừ sâu đối với Rầy nâu nhỏ *Laodelphax striatella*

Các hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng được phân tán tách rời trong nước và được pha loãng đến 500 ppm, và các cây lúa giống (giống: Nihonbare) được nhúng trong các hệ phân tán nông hóa học trong khoảng thời gian 30 giây. Sau khi được làm khô bằng không khí, mỗi cây giống được đặt vào trong ống thử nghiệm thủy tinh riêng biệt và được ủ với ấu trùng tuổi thứ ba của rầy nâu nhỏ *Laodelphax striatella*, và sau đó các ống thử nghiệm được đập bằng nút bông. Vào ngày thứ tám sau khi ủ, số lượng ấu trùng sống sót và ấu trùng chết được đếm, tỷ lệ chết đã hiệu chỉnh được tính theo công thức dưới đây, và hiệu quả trừ sâu được tính theo tiêu chí của Ví dụ thử nghiệm 1.

Tỷ lệ chết đã hiệu chỉnh (%)

$$= 100 \times (\text{Tỷ lệ sống sót trong bình không được xử lý} - \text{Tỷ lệ sống sót trong bình được xử lý}) / \text{tỷ lệ sống sót trong bình không được xử lý}$$

Kết quả là, các hợp chất 1-15, 1-16, 1-18, 2-15, 3-13, 3-15, 5-13, 5-15, 7-13, 7-14, 7-15, 8-10, 8-12, 8-15, 8-16, 8-18, 9-10, 9-12, 11-1, 11-2, 11-3, 11-6, 11-10, 11-13, 11-14, 11-16, 11-27, 11-50, 11-53, 11-60, 11-68, 11-73, 11-80, 11-81, 11-82, 11-86, 11-93, 11-94, 11-96, 11-131, 11-140, 11-141, 11-148, 12-1, 12-2, 12-6, 12-13, 18-1, 18-2, 18-6, 18-13, 18-161, 18-162, 18-166, 18-173, 18-174, 18-176, 18-187, 18-210, 18-211, 18-213, 18-220, 18-221, 18-228, 18-233, 18-234, 20-2, 20-21, 20-22, 20-24, 20-26, 20-39, 20-41, 20-42, 20-44, 20-45, 20-46, và 20-53 theo sáng chế được thể hiện mức hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 3

Thử nghiệm hiệu quả trừ sâu đối với Sâu tơ *Plutella xylostella*

Sâu tơ *Plutella xylostella* trưởng thành được phóng thích vào cây giống cải bắp Trung Quốc và được để đẻ trứng ở trên đó. Vào ngày thứ hai sau khi phóng thích sâu trưởng thành, cây giống cải bắp Trung Quốc với trứng để được nhúng trong khoảng thời gian 30 giây trong các hệ phân tán nông hóa học đã pha loãng đến 500ppm, mỗi hệ phân tán này chứa một hợp chất dị vòng ngưng tụ khác nhau được biểu diễn bởi công thức chung (1) của sáng chế làm thành phần hoạt tính. Các cây giống được làm khô bằng không khí và sau đó được giữ trong buồng ổn nhiệt ở nhiệt độ 25°C. Vào ngày thứ 6 sau khi xử lý nhúng, số lượng ấu trùng nở trên mỗi chậu được đếm, tỷ lệ chết được tính theo công thức dưới đây, và hiệu quả diệt côn trùng được đánh giá theo tiêu chí của Ví dụ thử nghiệm 1. Thử nghiệm này được thực hiện ba lần bằng cách sử dụng 10 sâu tơ *Plutella xylostella* trưởng thành trên mỗi lọ.

Tỷ lệ chết đã hiệu chỉnh (%)

$$= 100 \times (\text{Số lượng ấu trùng nở trong chậu không được xử lý} - \text{Số lượng ấu trùng nở trong chậu được xử lý}) / \text{Số lượng ấu trùng nở trong chậu không được xử lý}$$

Kết quả là, các hợp chất 1-15, 1-16, 1-18, 2-15, 3-13, 3-15, 5-13, 5-15, 7-13, 7-14, 7-15, 8-10, 8-12, 8-15, 8-16, 8-18, 9-10, 9-12, 11-1, 11-2, 11-3, 11-6, 11-10, 11-13, 11-14, 11-16, 11-27, 11-50, 11-53, 11-60, 11-68, 11-73, 11-80, 11-81, 11-86, 11-93, 11-94, 11-96, 11-131, 11-140, 11-141, 11-148, 12-1, 12-2, 12-6, 12-13, 18-1, 18-2, 18-6, 18-13, 18-161, 18-162, 18-166, 18-173, 18-174, 18-176, 18-187, 18-210, 18-211, 18-213, 18-220, 18-221, 18-228, 18-233, 18-234, 20-2, 20-21, 20-22, 20-24, 20-26, 20-39, 20-41, 20-42, 20-44, 20-45, 20-46, và 20-53 theo sáng chế được thể hiện mức hoạt tính được đánh giá là A.

Hiệu quả đạt được của sáng chế

Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xycloalkylpyridyl theo sáng chế hoặc muối của chúng không chỉ có hiệu quả cao làm thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn, mà còn có hiệu quả chống lại côn trùng gây hại mà sống ở bên ngoài hoặc bên trong của vật nuôi kiểng như chó và mèo và động vật nuôi như gia súc và

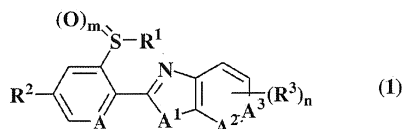
cừ.

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Hợp chất của sáng chế có hiệu quả kiểm soát ưu việt đối với phạm vi rộng của côn trùng gây hại trong nông nghiệp và làm vườn và do đó là hữu ích.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức chung (1):



trong đó R¹ là

- (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (a2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (a3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl; hoặc
- (a4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl,

R² là

- (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (b2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl;
- (b3) nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl; hoặc
- (b5) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ
 - (a) nguyên tử halogen,
 - (b) nhóm xyano,
 - (c) nhóm xyano (C₁-C₆) alkyl,
 - (d) nhóm formyl;
 - (e) nhóm hydroxy (C₁-C₆) alkyl,
 - (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,
 - (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 - (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 - (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 - (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl,
 - (k) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl (C₁-C₆) alkyl,
 - (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl (C₁-C₆) alkyl,
 - (m) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl,
 - (n) nhóm carboxyl,

- (o) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (p) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (q) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (r) nhóm (C₁-C₆) alkyl carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (s) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (t) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (u) nhóm R⁵(R⁶)N, trong đó R⁵ và R⁶ có thể là giống hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkyl carbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl, hoặc nhóm di-(C₁-C₆) alkyl aminocarbonyl, trong đó các nhóm alkyl của gốc di-(C₁-C₆) alkyl amino có thể là giống hoặc khác nhau,
- (v) nhóm R⁵(R⁶)N(C₁-C₆) alkyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,
- (w) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,
- (x) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên, và
- (y) nhóm C(R⁵)=NOR⁶, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,

R³ là

- (c₁) nguyên tử halogen;
- (c₂) nhóm xyano;
- (c₃) nhóm nitơ;
- (c₄) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (c₅) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (c₆) nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c₇) nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c₈) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c₉) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c₁₀) nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c₁₁) nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c₁₂) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;
- (c₁₃) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;

- (c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
 (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
 (c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl; hoặc
 (c17) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

mỗi A là CH hoặc nguyên tử nitơ,

cả A² và A³ là CH,

A¹ là O, S hoặc N-R⁴, trong đó R⁴ là

- (d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
 (d2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
 (d3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl; hoặc
 (d4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl;

m bằng 0, 1 hoặc 2, và

n bằng 1 hoặc 2, hoặc

muối của chúng.

2. Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo điểm 1,

trong đó R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² là

- (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl; hoặc
 (b5) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl có, trên vòng, 1 hoặc 2 của các nhóm thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ
 (b) nhóm xyano,
 (c) nhóm xyano (C₁-C₆) alkyl,
 (d) nhóm formyl,
 (e) nhóm hydroxy (C₁-C₆) alkyl,
 (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,
 (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl,
 (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl,

- (k) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl (C₁-C₆) alkyl,
- (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl (C₁-C₆) alkyl,
- (m) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl,
- (n) nhóm carboxyl,
- (o) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (p) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (q) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy carbonyl,
- (r) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (s) nhóm (C₃-C₆) xycloalkylcarbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (t) nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl,
- (u) nhóm R⁵(R⁶)N, trong đó R⁵ và R⁶ có thể là giống hoặc khác nhau, và mỗi nhóm là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy carbonyl, hoặc nhóm di-(C₁-C₆) alkylaminocarbonyl, trong đó các nhóm alkyl của gốc di-(C₁-C₆) alkylamino có thể là giống hoặc khác nhau,
- (v) nhóm R⁵(R⁶)N(C₁-C₆) alkyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,
- (w) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,
- (x) nhóm R⁵(R⁶)N carbonyloxy (C₁-C₆) alkyl, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên, và
- (y) nhóm C(R⁵)=NOR⁶, trong đó R⁵ và R⁶ được xác định như trên,

R³ là

- (c8) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio; hoặc
- (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio,

A là CH hoặc nguyên tử nitơ,

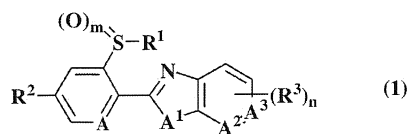
A¹ là O, S hoặc N-R⁴, trong đó R⁴ là (d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

m bằng 0, 1 hoặc 2, và

n bằng 1, hoặc

muối của chúng.

3. Hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bởi công thức:



trong đó R¹ là

- (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (a2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (a3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl; hoặc
- (a4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl,

R² là

- (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (b2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl;
- (b3) nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl,

R³ là

- (c1) nguyên tử halogen;
- (c2) nhóm xyano;
- (c3) nhóm nitơ;
- (c4) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (c5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (c6) nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c7) nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c8) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c10) nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy;
- (c11) nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy;
- (c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;
- (c13) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl; hoặc

(c17) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

A là CH hoặc nguyên tử nito,

cả A² và A³ là CH,

A¹ là O, S hoặc N-R⁴

trong đó R⁴ là

(d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(d2) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(d3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl; hoặc

(d4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl),

m là 0, 1 hoặc 2, và

n là 1 hoặc 2.

4. Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo điểm 3,

trong đó R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² là (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl,

R³ là

(c8) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;

(c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio; hoặc

(c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio,

A¹ là N-R⁴, trong đó R⁴ là (d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

m là 0 hoặc 2, và

n là 1.

5. Hợp chất dị vòng ngưng tụ theo điểm 3,

trong đó R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² là (b1) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl,

R³ là (c8) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,

A¹ là O, S hoặc N-R⁴, trong đó R⁴ là (d1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

m bằng 0 hoặc 2, và

n bằng 1.

6. Thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ

hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 làm thành phần hoạt tính.

7. Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu cho nông nghiệp và làm vườn, bao gồm xử lý cây hoặc đất bằng lượng hữu hiệu của hợp chất dị vòng ngưng tụ hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5.

8. Chất kiểm soát vật ký sinh ngoài bao gồm lượng hữu hiệu của hợp chất dị vòng ngưng tụ hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 làm thành phần hoạt tính.