



(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)

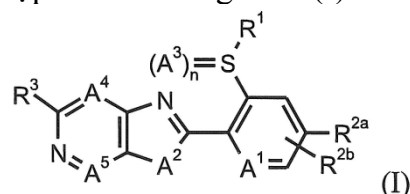


1-0031828

(51)⁷ C07D 471/04; C07D 213/73; C07D 498/04; C07D 473/40; A01N 43/90; C07D 213/74 (13) B

- (21) 1-2016-03464 (22) 05/02/2015
(86) PCT/EP2015/052351 05/02/2015 (87) WO2015/121136 20/08/2015
(30) 14155372.7 17/02/2014 EP
(45) 25/05/2022 410 (43) 25/11/2016 344A
(73) Bayer Cropscience Aktiengesellschaft (DE)
Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany
(72) FISCHER, Ruediger (DE); ALIG, Bernd (DE); ILG, Kerstin (DE); MALSAM, Olga (DE); GOERGENS, Ulrich (DE); TURBERG, Andreas (DE); LI, Jun (CN); ZHERSH, Sergey (UA); ARLT, Alexander (DE).
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

- (54) HỢP CHẤT DẪN XUẤT DỊ VÒNG HAI VÒNG DUNG HỢP ĐƯỢC THỂ BỞI 2-(HET)ARYL, CHẾ PHẨM HÓA NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP PHI TRỊ LIỆU ĐỂ PHÒNG TRỪ ĐỘNG VẬT GÂY HẠI
(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I):



trong đó mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên. Hợp chất này được sử dụng làm thuốc diệt ve bét và/hoặc thuốc diệt côn trùng. Sáng chế đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất này và phương pháp để phòng trừ động vật gây hại. Sáng chế còn đề cập đến quy trình và chất trung gian để điều chế các hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất dẫn xuất dị vòng hai vòng dung hợp được thế bởi 2-(het)aryl có công thức (I). Hợp chất này có thể được sử dụng làm thuốc diệt ve bét và/hoặc thuốc diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại, cụ thể là động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng và động vật chân đốt. Sáng chế còn đề cập đến quy trình và chất trung gian để điều chế các hợp chất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

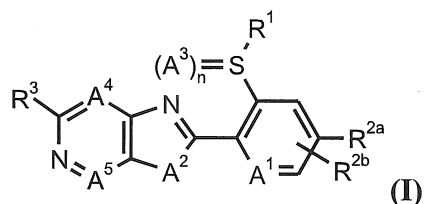
Hợp chất dẫn xuất dị vòng hai vòng dung hợp được thế bởi 2-(het)aryl mang đặc tính diệt côn trùng đã được mô tả trong tài liệu chuyên ngành, ví dụ trong công bố đơn quốc tế số WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2014/142292 và WO 2014/148451, và cả công bố đơn số WO 2015/000715.

Tuy nhiên, các thành phần hoạt tính đã được biết từ các tài liệu nêu trên có một số bất lợi khi sử dụng, không chỉ vì chúng có phổ ứng dụng hẹp hoặc vì chúng không có hoạt tính diệt côn trùng hoặc diệt ve bét thỏa đáng.

Hợp chất dẫn xuất dị vòng hai vòng dung hợp được thế bởi 2-(het)aryl mới hiện nay đã được phát hiện ra, và các hợp chất này có lợi điểm so với các hợp chất đã biết, ví dụ như có đặc tính sinh học hoặc môi trường tốt hơn, phổ phương pháp ứng dụng rộng hơn, hoạt tính diệt côn trùng hoặc diệt ve bét tốt hơn, và còn tương thích tốt với cây trồng. Hợp chất dẫn xuất dị vòng hai vòng dung hợp được thế bởi 2-(het)aryl có thể được sử dụng phối hợp với các tác nhân khác để cải thiện hiệu quả, đặc biệt là hiệu quả chống lại côn trùng mà khó bị phòng trừ.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, sáng chế đề xuất hợp chất mới có công thức (I)



trong đó:

A¹ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

A² là -N-R⁵, oxy hoặc lưu huỳnh,

A³ là oxy, =N-H hoặc =N-CN,

A⁴ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

A⁵ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

R¹ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-

C₆)alkylsulphonylamino, aminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylamino-sulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl,

hoặc là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này được thể một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, trong đó mỗi nhóm aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl có thể được thể độc lập một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl hoặc benzyl, hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này được thể một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp của heteroxyclyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp của heteroxyclyl),

mỗi nhóm R^{2a}, R^{2b}, R³ và R⁴ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl,

(C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di(C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino,

là aryl hoặc hetaryl, mỗi nhóm trong số các nhóm này được thế một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp của hetaryl) ít nhất là một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thế có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio,

(C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcacybonyl, (C₁-C₆)haloalkylcacybonyl, (C₁-C₆)alkylcacybonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacybonyl, aminocacybonyl, (C₁-C₆)alkylaminocacybonyl, di(C₁-C₆)alkylaminocacybonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocacybonyl, di(C₂-C₆)-alkenylaminocacybonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocacybonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocacybonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacybonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocacybonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino,

R⁵ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, aminocacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylamino-(C₁-C₆)alkyl, di(C₁-C₆)alkylamino-(C₁-C₆)alkyl hoặc (C₃-C₈)xycloalkylamino-(C₁-C₆)alkyl,

n là 0, 1 hoặc 2,

mà, trong trường hợp $n = 2$, ý nghĩa của A^3 có thể giống hoặc khác nhau.

Ngoài ra, đã phát hiện ra rằng hợp chất có công thức (I) có hiệu quả rất tốt làm thuốc diệt loài gây hại, tốt hơn là làm thuốc diệt côn trùng và/hoặc thuốc diệt ve bét, và thường có độ tương thích với cây tốt, đặc biệt là với cây trồng.

Hợp chất theo sáng chế thường được xác định bằng công thức (I). Nhóm thế hoặc khoảng các gốc được ưu tiên được nêu trong công thức nêu trên đây và dưới đây được minh họa như sau:

A^1 tốt hơn là nitơ, $=N^+-O^-$ hoặc $=C-R^4$,

A^2 tốt hơn là $-N-R^5$, oxy hoặc lưu huỳnh,

A^3 tốt hơn là oxy, $=N-H$ hoặc $=N-CN$,

A^4 tốt hơn là nitơ, $=N^+-O^-$ hoặc $=C-R^4$,

A^5 tốt hơn là nitơ, $=N^+-O^-$ hoặc $=C-R^4$,

R^1 tốt hơn là $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)haloalkyl$, $(C_1-C_4)xyanoalkyl$, $(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)haloalkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_4)alkenyl$, $(C_2-C_4)alkenyloxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_4)haloalkenyloxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_4)haloalkenyl$, $(C_2-C_4)xyanoalkenyl$, $(C_2-C_4)alkynyl$, $(C_2-C_4)alkynyloxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_4)haloalkynyloxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_4)haloalkynyl$, $(C_2-C_4)xyanoalkynyl$, $(C_3-C_6)xycloalkyl$, $(C_3-C_6)xycloalkyl(C_3-C_6)xycloalkyl$, $(C_1-C_4)alkyl-(C_3-C_6)xycloalkyl$, $halo(C_3-C_6)xycloalkyl$, $(C_1-C_4)alkylamino$, $di(C_1-C_4)alkylamino$, $(C_3-C_6)xycloalkylamino$, $(C_1-C_4)alkylcarbonylamino$, $(C_1-C_4)alkylthio-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)haloalkylthio-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)alkylsulphinyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)haloalkylsulphinyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)alkylsulphonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)alkylcarbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)haloalkylcarbonyl-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)alkylsulphonylamino$,

hoặc là $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)alkoxy$, $(C_2-C_4)alkenyl$, $(C_2-C_4)alkynyl$, $(C_3-C_6)xycloalkyl$, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, trong đó mỗi

nhóm aryl, hetaryl và heteroxycyl có thể tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, hoặc

R¹ tốt hơn là aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, (C₁-C₄)alkylsulphoximino, (C₁-C₄)alkylcacybonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp của heteroxycyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp của heteroxycyl),

mỗi nhóm R^{2a}, R^{2b}, R³ và R⁴ tốt hơn là độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacybonyl, (C₁-C₄)haloalkylcacybonyl, aminocacybonyl, aminothiocacybonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacybonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocacybonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, aminothiocacybonyl,

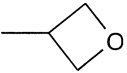
là phenyl hoặc hetaryl, mỗi nhóm trong số các nhóm này được thể một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp của hetaryl) ít nhất là một nhóm cacbonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thể có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl,

R⁵ tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylcacbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

n tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

mà, trong trường hợp mà n = 2, ý nghĩa của A³ có thể giống hoặc khác nhau.

- A¹ tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C-R⁴,
- A² tốt hơn nữa là -N-R⁵ hoặc oxy,
- A³ tốt hơn nữa là oxy hoặc =N-H,
- A⁴ tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C-R⁴,
- A⁵ tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C-R⁴,
- R¹ tốt hơn nữa là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl,
- hoặc là (C₁-C₄)alkyl tùy ý là được thế một lần bằng phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl, trong đó phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl có thể mỗi nhóm tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl, hoặc
- R¹ tốt hơn nữa là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl,
- R^{2a} tốt hơn nữa là hydro, halogen, (C₁-C₄)alkyl (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl,
- R^{2b} tốt hơn nữa là hydro hoặc halogen,
- R³ tốt hơn nữa là hydro, (C₁-C₄)alkyl (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl,

- R^4 tốt hơn nữa là hydro, halogen, xyano hoặc (C_1-C_3) alkyl,
- R^5 tốt hơn nữa là (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl,
- n tốt hơn nữa là 0, 1 hoặc 2,
mà, trong trường hợp mà $n = 2$, ý nghĩa của A^3 có thể giống hoặc khác nhau.
- A^1 còn tốt hơn nữa là nitơ hoặc $=C-R^4$,
- A^2 còn tốt hơn nữa là $-N-R^5$ hoặc oxy,
- A^3 còn tốt hơn nữa là oxy,
- A^4 còn tốt hơn nữa là nitơ hoặc $=C-H$,
- A^5 còn tốt hơn nữa là nitơ hoặc $=C-H$,
- R^1 còn tốt hơn nữa là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, xyclopropyl, n-butyl, i-butyl, tert-butyl, xyclobutyl, florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floroetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$,
 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ hoặc ,
- R^{2a} còn tốt hơn nữa là hydro, florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floroetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometylthio, triflorometylsulphonyl, triflorometylsulphinyl, flo hoặc clo,
- R^{2b} còn tốt hơn nữa là hydro, flo hoặc clo,
- R^3 còn tốt hơn nữa là florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floroetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometylthio, triflorometylsulphonyl hoặc triflorometylsulphinyl,
- R^4 còn tốt hơn nữa là hydro, flo, clo, brom hoặc xyano,
- R^5 còn tốt hơn nữa là metyl, etyl, i-propyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

n còn tốt hơn nữa là 0, 1 hoặc 2.

A¹ đặc biệt là nitơ (N) hoặc =C-H,

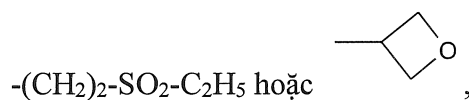
A² đặc biệt là -N-CH₃ hoặc oxy (O),

A³ đặc biệt là oxy (O),

A⁴ đặc biệt là nitơ (N) hoặc =C-H,

A⁵ đặc biệt là =C-H,

R¹ đặc biệt là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, triflorometyl, -(CH₂)₂-S-C₂H₅,



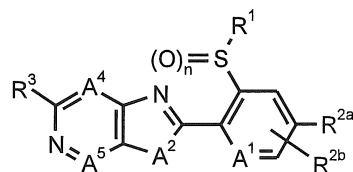
R^{2a} đặc biệt là hydro, triflorometyl, flo hoặc clo,

R^{2b} đặc biệt là hydro hoặc clo,

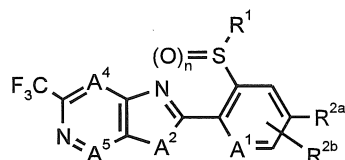
R³ đặc biệt là triflorometyl,

n đặc biệt là 0, 1 hoặc 2.

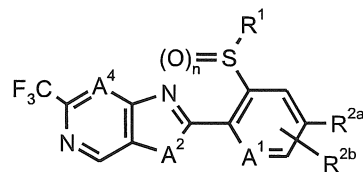
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-A)



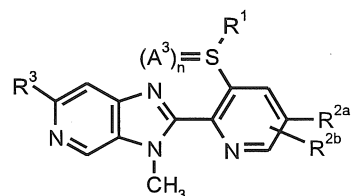
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-B)



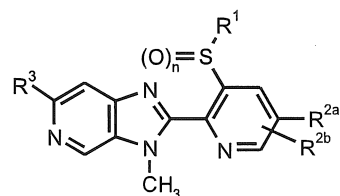
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-C)



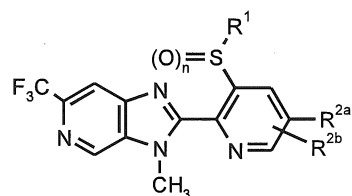
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-D)



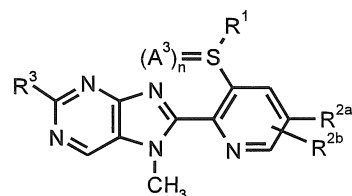
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-E)



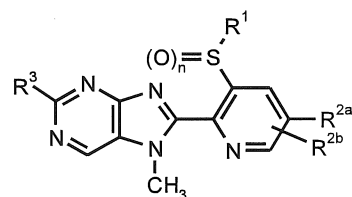
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-F)



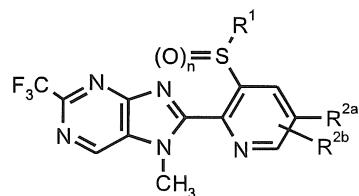
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-G)



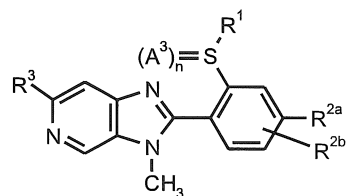
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-H)



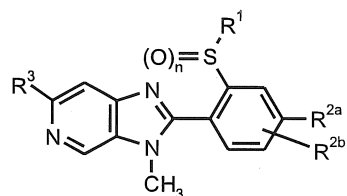
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-I)



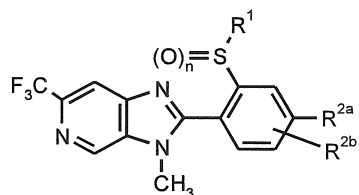
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-J)



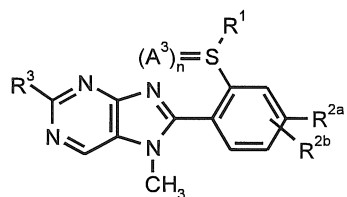
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-K)



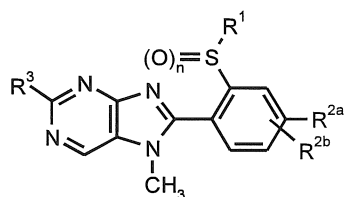
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-L)



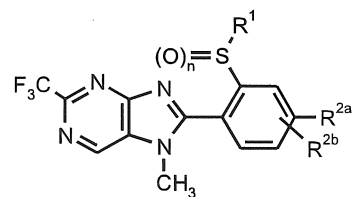
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-M)



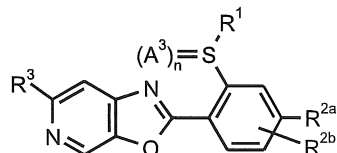
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-N)



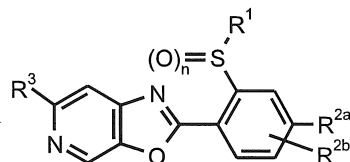
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-O)



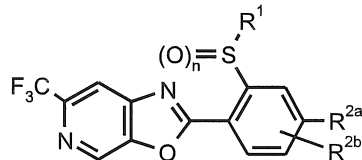
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-P)



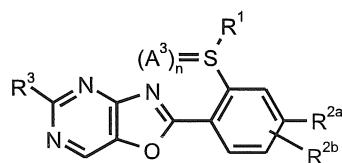
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-Q)



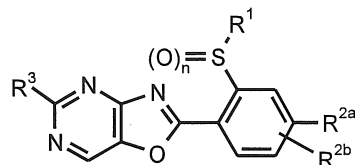
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-R)



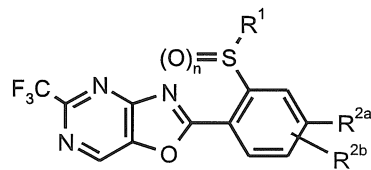
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-S)



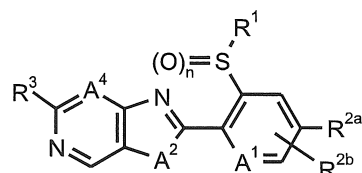
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-T)



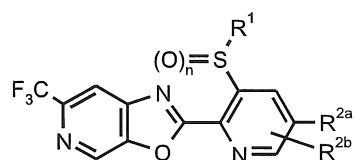
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-U)



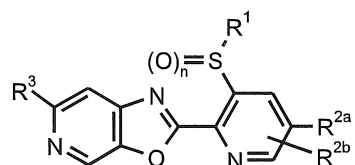
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-V)



Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-W)

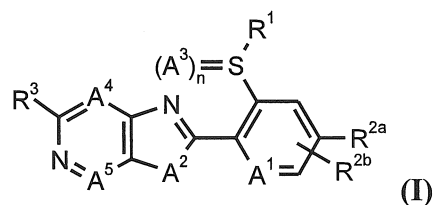


Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I-X)



Trong các công thức từ (I-A) đến (I-X), mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên.

Theo phương án khác (Cấu hình 1), sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I)



trong đó:

A^1 là nitơ, $=N^+-O^-$ hoặc $=C-R^4$,

A² là -N-R⁵, oxy hoặc lưu huỳnh,

A³ là oxy,

A⁴ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

A⁵ là =C-H,

R¹ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, aminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl,

hoặc trong mỗi trường hợp giống nhau hoặc khác nhau tùy ý là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl được thế bằng một hoặc nhiều aryl-, -hetaryl- hoặc -heteroxyclyl-, trong đó mỗi nhóm aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl có thể được thế độc lập một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-

C₆alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcacybonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcacybonyl, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl, (C₁-C₆)alkylcacybonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl hoặc benzyl, hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý là được thể một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcacybonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcacybonyl, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl, (C₁-C₆)alkylcacybonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp của heteroxycyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp của heteroxycyl),

mỗi nhóm R^{2a}, R^{2b}, R³ và R⁴ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycacybonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacybonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-

C₆alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkylthiocacbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkylcacbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocacbonyl, di(C₂-C₆)-alkenylaminocacbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcacbonylamino),

là aryl hoặc hetaryl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp của hetaryl) ít nhất là một nhóm cacbonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thế có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycacbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcacbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkylcacbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, (C₂-

C₆alkenylaminocarbonyl, di(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino,

R⁵ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, aminocarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylamino-(C₁-C₆)alkyl, di(C₁-C₆)alkylamino-(C₁-C₆)alkyl hoặc (C₃-C₈)xycloalkylamino-(C₁-C₆)alkyl,

n là 0, 1 hoặc 2.

(Cấu hình 2) là được ưu tiên đối với hợp chất có công thức (I) trong đó

A¹ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

A² là -N-R⁵, oxy hoặc lưu huỳnh,

A³ là oxy,

A⁴ là nitơ, =N⁺-O⁻ hoặc =C-R⁴,

A⁵ là =C-H,

R¹ là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, (C₃-C₆)xycloalkylamino, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino,

hoặc là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, trong đó aryl, hetaryl và heteroxyclyl có thể mỗi nhóm tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, (C₁-C₄)alkylsulphoximino, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₃-C₄)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp của heteroxyclyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp của heteroxyclyl),

mỗi nhóm R^{2a}, R^{2b}, R³ và R⁴ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl,

amino, SCN, tri-(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacybonyl, (C₁-C₄)haloalkylcacybonyl, aminocacybonyl, aminothiocacybonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacybonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocacybonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, aminothiocacybonyl, NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcacybonylamino),

là phenyl hoặc hetaryl, mỗi nhóm trong số các nhóm này được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp của hetaryl) ít nhất là một nhóm cacybonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thế có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacybonyl, (C₁-

C₄)haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl,

R⁵ là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylcacbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

n là 0, 1 hoặc 2.

(Cấu hình 3) là được đặc biệt ưu tiên đối với hợp chất có công thức (I) trong đó

A¹ là nitơ hoặc =C-R⁴,

A² là -N-R⁵ hoặc oxy,

A³ là oxy,

A⁴ là nitơ hoặc =C-R⁴,

A⁵ là =C-H,

R¹ là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl,

hoặc là (C₁-C₄)alkyl tùy ý là được thế một lần bằng phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl, trong đó phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl có thể mỗi nhóm tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl, hoặc

R¹ là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrazolyl, triazolyl, thiazolyl, tetrazolyl, piperazinyl, tetrahydrofuryl hoặc oxetanyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng halogen, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl,

R^{2a} là hydro, xyano, aminocarbonyl, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl,

R^{2b} là hydro, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, NHCO-(C₁-C₄)alkyl hoặc halogen,

R³ là hydro, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, hoặc là phenyl, pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý là được thế một lần bằng triflorometyl,

R⁴ là hydro, halogen, xyano hoặc (C₁-C₃)alkyl,

R⁵ là (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl,

n là 0, 1 hoặc 2.

(Cấu hình 4) là được đặc biệt ưu tiên đối với hợp chất có công thức (I) trong đó

A¹ là nitơ hoặc =C-R⁴,

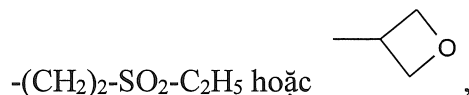
A² là -N-R⁵ hoặc oxy,

A³ là oxy,

A⁴ là nitơ hoặc =C-H,

A⁵ là =C-H,

R¹ là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, xyclopropyl, n-butyl, i-butyl, tert-butyl, xyclobutyl, hydroxyetyl (-CH₂-CH₂-OH), florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, -(CH₂)₂-S-C₂H₅,



R^{2a} là hydro, xyano, aminocacbonyl (CONH₂), florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometoxy, difloroclorometoxy, dicloroflorometoxy, triflorometylthio, triflorometylsulphonyl, triflorometylsulphinyl, flo hoặc clo,

R^{2b} là hydro, metoxy, etoxy, triflorometyl, metylcacbonylamino (NHCO-metyl), flo hoặc clo,

R³ là flo, clo, florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometoxy, difloroclorometoxy, dicloroflorometoxy, triflorometylthio, triflorometylsulphonyl, triflorometylsulphinyl, hoặc là phenyl, pyrazol-1-yl hoặc imidazol-1-yl, mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý là được thế một lần bằng triflorometyl,

R⁴ là hydro, flo, clo, brom hoặc xyano,

R⁵ là metyl, etyl, i-propyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

n là 0, 1 hoặc 2.

(Cấu hình 5) được nhấn mạnh đối với hợp chất có công thức (I) trong đó

A¹ là nitơ (N) hoặc =C-H,

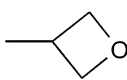
A² là -N-CH₃ hoặc oxy (O),

A³ là oxy (O),

A⁴ là nitơ (N) hoặc =C-H,

A⁵ là =C-H,

R¹ là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, xyclopropyl, n-butyl, i-butyl, tert-butyl, xyclobutyl, hydroxyetyl (-CH₂-CH₂-OH), florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, -(CH₂)₂-S-C₂H₅,

-(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅ hoặc  (oxetan-3-yl),

R^{2a} là hydro, xyano, aminocacbonyl (CONH₂), florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometoxy, triflorometylthio, triflorometylsulphonyl, triflorometylsulphinyl, flo hoặc clo,

R^{2b} là hydro, metoxy, etoxy, triflorometyl, metylcacbonylamino (NHCO-metyl), flo hoặc clo,

R³ là flo, clo, florometyl, diflorometyl, triflorometyl, floreoetyl, difloroetyl, trifloroetyl, tetrafloroetyl, pentafloroetyl, triflorometoxy, triflorometylthio,

triflorometylsulphonyl, triflorometylsulphinyl, hoặc là phenyl,  (pyrazol-1-

yl) hoặc  (imidazol-1-yl), mỗi nhóm trong số các nhóm này tùy ý là được thế một lần bằng triflorometyl,

n là 0, 1 hoặc 2.

(Cấu hình 6) được đặc biệt nhấn mạnh đối với hợp chất có công thức (I) trong đó

A¹ là nitơ (N) hoặc =C-H,

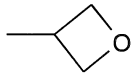
A² là -N-CH₃ hoặc oxy (O),

A³ là oxy (O),

A⁴ là nitơ (N) hoặc =C-H,

A⁵ là =C-H,

R¹ là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, triflorometyl, -CH₂-CH₂-F, -CH₂-CH₂-OH,

-(CH₂)₂-S-C₂H₅, -(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅ hoặc ,

R^{2a} là hydro, triflorometyl, xyano, CONH₂, flo hoặc clo,

R^{2b} là hydro, clo, triflorometyl, metoxy hoặc NHCOCH₃,

R³ là pentafloroetyl, triflorometyl, clo, 4-CF₃(C₆H₄), 4-(CF₃)pyrazol-1-yl,

3-(CF₃)pyrazol-1-yl hoặc 4-(CF₃)imidazol-1-yl,

n là 0, 1 hoặc 2.

Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên, đặc biệt là như được xác định trong Cấu hình (1) hoặc Cấu hình (2) hoặc Cấu hình (3) hoặc Cấu hình (4) hoặc Cấu hình (5) hoặc Cấu hình (6), và

R^{2b} là axetyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl(C₃-C₈)xycloalkyl (trong đó liên kết này thông qua xycloalkyl được thế bằng alkyl), halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-

C_6 alkoxy- (C_1-C_6) alkylsulphonyl, (C_1-C_6) alkylsulphonyloxy, (C_1-C_6) alkylcabcanyl, (C_1-C_6) alkylthiocabcanyl, (C_1-C_6) haloalkylcabcanyl, (C_1-C_6) alkylcabcanyloxy, (C_1-C_6) alkoxycabcanyl, (C_1-C_6) haloalkoxycabcanyl, aminocabcanyl, (C_1-C_6) alkylaminocabcanyl, (C_1-C_6) alkylaminothiocabcanyl, di- (C_1-C_6) alkylaminocabcanyl, di- (C_1-C_6) alkylaminothiocabcanyl, (C_2-C_6) alkenylaminocabcanyl, di- (C_2-C_6) -alkenylaminocabcanyl, (C_3-C_8) xycloalkylaminocabcanyl, (C_1-C_6) alkylsulphonylamino, (C_1-C_6) alkylamino, di- (C_1-C_6) alkylamino, aminosulphonyl, (C_1-C_6) alkylaminosulphonyl, di- (C_1-C_6) alkylaminosulphonyl, (C_1-C_6) alkylsulphoximino, aminothiocabcanyl, (C_1-C_6) alkylaminothiocabcanyl, di- (C_1-C_6) alkylaminothiocabcanyl, (C_3-C_8) xycloalkylamino, $NHCO-(C_1-C_6)$ alkyl $((C_1-C_6)$ alkylcabcanylamino),

trong mỗi trường hợp tùy ý là hetaryl được thế một hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất là một nhóm cabcanyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thế có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri- (C_1-C_6) alkylsilyl, (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) haloalkyl, (C_1-C_6) xyanoalkyl, (C_1-C_6) hydroxyalkyl, hydroxycabcanyl- (C_1-C_6) -alkoxy, (C_1-C_6) alkoxycabcanyl- (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) alkoxy- (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_6) alkenyl, (C_2-C_6) haloalkenyl, (C_2-C_6) xyanoalkenyl, (C_2-C_6) alkynyl, (C_2-C_6) haloalkynyl, (C_2-C_6) xyanoalkynyl, (C_1-C_6) alkoxy, (C_1-C_6) haloalkoxy, (C_1-C_6) xyanoalkoxy, (C_1-C_6) alkoxycabcanyl- (C_1-C_6) alkoxy, (C_1-C_6) alkoxy- (C_1-C_6) alkoxy, (C_1-C_6) alkylhydroxyimino, (C_1-C_6) alkoxyimino, (C_1-C_6) alkyl- (C_1-C_6) alkoxyimino, (C_1-C_6) haloalkyl- (C_1-C_6) alkoxyimino, (C_1-C_6) alkylthio, (C_1-C_6) haloalkylthio, (C_1-C_6) alkoxy- (C_1-C_6) alkylthio, (C_1-C_6) alkylthio- (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) alkylsulphinyl, (C_1-C_6) haloalkylsulphinyl, (C_1-C_6) alkoxy- (C_1-C_6) alkylsulphinyl, (C_1-C_6) alkylsulphinyl- (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) alkylsulphonyl, (C_1-C_6) haloalkylsulphonyl, (C_1-C_6) alkoxy- (C_1-C_6) alkylsulphonyl, (C_1-C_6) alkylsulphonyl- (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) alkylsulphonyloxy, (C_1-C_6) alkylcabcanyl, (C_1-C_6) haloalkylcabcanyl, (C_1-C_6) alkylcabcanyloxy, (C_1-C_6) alkoxycabcanyl, (C_1-C_6) haloalkoxycabcanyl, aminocabcanyl, (C_1-C_6) alkylaminocabcanyl, di- (C_1-C_6) alkylaminocabcanyl, (C_2-C_6) alkenylaminocabcanyl, di- (C_2-C_6) -alkenylaminocabcanyl, $(C_3-$

C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino.

Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên, đặc biệt là như được xác định trong Cấu hình (1) hoặc Cấu hình (2) hoặc Cấu hình (3) hoặc Cấu hình (4) hoặc Cấu hình (5) hoặc Cấu hình (6), và

R^{2b} là axetyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl(C₃-C₆)xycloalkyl (trong đó liên kết này thông qua xycloalkyl được thể bằng alkyl), halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, aminothiocarbonyl, NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino), trong mỗi trường hợp là hetaryl được thể một hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất là một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó các nhóm thể có thể có trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-

(C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl.

Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên, đặc biệt là như được xác định trong Cấu hình (1) hoặc Cấu hình (2) hoặc Cấu hình (3) hoặc Cấu hình (4) hoặc Cấu hình (5) hoặc Cấu hình (6), và

R^{2b} là (C₁-C₄)alkoxy hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl.

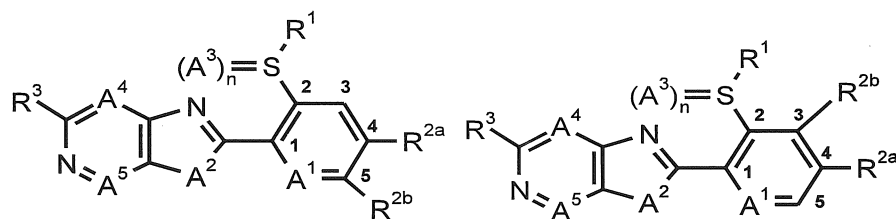
Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên, đặc biệt là như được xác định trong Cấu hình (1) hoặc Cấu hình (2) hoặc Cấu hình (3) hoặc Cấu hình (4) hoặc Cấu hình (5) hoặc Cấu hình (6), và

R^{2b} là metoxy, etoxy hoặc NHCO-metyl.

Theo phương án được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên, đặc biệt là như được xác định trong Cấu hình (1) hoặc Cấu hình (2) hoặc Cấu hình (3) hoặc Cấu hình (4) hoặc Cấu hình (5) hoặc Cấu hình (6), và

R^{2b} là metoxy hoặc NHCO-metyl.

R^{2b} được gắn kết ở vị trí 3 hoặc 5:



Theo định nghĩa được ưu tiên, trừ khi có chỉ dẫn khác,

halogen được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn là lần lượt được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo và brom, aryl (kể cả khi là một phần của một đơn vị lớn hơn, ví dụ arylalkyl) được chọn từ nhóm bao gồm phenyl, naphthyl, anthryl, phenanthrenyl, và tốt hơn là lần lượt là phenyl, hetaryl (đồng nghĩa với heteroaryl, kể cả khi là một phần của một đơn vị lớn hơn, ví dụ hetarylalkyl) được chọn từ nhóm bao gồm furyl, thienyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,2,3-oxadiazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,2,5-oxadiazolyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,2,5-thiadiazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyrazinyl, 1,2,3-triazinyl, 1,2,4-triazinyl, 1,3,5-triazinyl, benzofuryl, benzisofuryl, benzothienyl, benzisothienyl, indolyl, isoindolyl, indazolyl, benzothiazolyl, benzisothiazolyl, benzoxazolyl, benzisoxazolyl, benzimidazolyl, 2,1,3-benzoxadiazole, quinolinyl, isoquinolinyl, cinnolinyl, phthalazinyl, quinazolinyl, quinoxalinyl, naphthyridinyl, benzotriazinyl, purinyl, pteridinyl và indolizinyl,

heteroxycyclyl là vòng no có 4, 5 hoặc 6 nguyên tử trên vòng chứa 1 hoặc 2 nguyên tử nito và/hoặc một nguyên tử oxy và/hoặc một nguyên tử lưu huỳnh, ví dụ azetidiny, pyrrolidinyl, piperidinyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, dioxanyl, thietanyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiopyranyl, piperazinyl, morpholinyl và thiomorpholinyl.

Theo định nghĩa cụ thể, trừ khi có chỉ dẫn khác,

halogen được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn là lần lượt được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo và brom,

aryl (kể cả khi là một phần của một đơn vị lớn hơn, ví dụ arylalkyl) được chọn từ nhóm bao gồm phenyl, naphthyl, anthryl, phenanthrenyl, và tốt hơn là lần lượt là phenyl,

hetaryl (kể cả khi là một phần của một đơn vị lớn hơn, ví dụ hetarylalkyl) được chọn từ nhóm bao gồm pyridyl, pyrimidyl, pyrazinyl, pyridazinyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, thiazolyl và tetrazolyl,

heteroxycyclyl được chọn từ nhóm bao gồm oxetanyl, tetrahydrofuryl và piperazinyl.

Theo ngữ cảnh sáng chế, trừ khi được xác định khác, thuật ngữ "alkyl", một mình hoặc kết hợp cùng thuật ngữ khác, ví dụ haloalkyl, được hiểu là dùng để chỉ gốc cacbonhydrat béo no mà có từ 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể có mạch nhánh hoặc không có mạch nhánh. Ví dụ về các gốc C_1 - C_{12} -alkyl là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-decyl, n-undecyl và n-dodecyl. Trong số các gốc alkyl này, được đặc biệt ưu tiên là các gốc C_1 - C_6 -alkyl. Được đặc biệt ưu tiên là các gốc C_1 - C_4 -alkyl.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định khác, thuật ngữ "alkenyl", một mình hoặc kết hợp cùng thuật ngữ khác, được hiểu là dùng để chỉ gốc C_2 - C_{12} -alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh mà có ít nhất là một liên kết đôi, ví dụ vinyl, allyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trogn số đó, được ưu tiên là các gốc C_2 - C_6 -alkenyl và được đặc biệt ưu tiên là các gốc C_2 - C_4 -alkenyl.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định khác, thuật ngữ "alkynyl", một mình hoặc kết hợp cùng thuật ngữ khác, được hiểu là dùng để chỉ gốc C_2 - C_{12} -alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh mà có ít nhất là một liên kết ba, ví dụ etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trogn số đó, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -alkynyl và được đặc biệt ưu tiên là các gốc C_3 - C_4 -alkynyl. Gốc alkynyl có thể còn chứa ít nhất là một liên kết đôi.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định khác, thuật ngữ "xycloalkyl", một mình hoặc kết hợp cùng thuật ngữ khác, được hiểu là dùng để chỉ gốc C_3 - C_8 -xycloalkyl, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trogn số đó, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -xycloalkyl.

Thuật ngữ "alkoxy", một mình hoặc kết hợp cùng thuật ngữ khác, ví dụ haloalkoxy, được hiểu là dùng để chỉ gốc O-alkyl, trong đó thuật ngữ "alkyl" được xác định như trên.

Các gốc được thế bằng halogen, ví dụ haloalkyl, được thế bằng một hoặc nhiều halogen, đến mức tối đa số nhóm thế có thể có. Trong trường hợp thế bằng nhiều halogen,

nguyên tử halogen có thể được giống hoặc khác nhau. Trong trường hợp này, halogen là flo, clo, brom hoặc iot, đặc biệt là flo, clo hoặc brom.

Trừ khi có chỉ dẫn khác, các gốc tùy ý được thể có thể được thể một hoặc nhiều lần, trong đó nhóm thể trong trường hợp thể nhiều lần có thể giống hoặc khác nhau.

Định nghĩa hoặc giải thích về gốc nêu trên là các thuật ngữ tổng quát hoặc thuật ngữ ưu tiên được áp dụng cho thành phẩm và tương ứng với nguyên liệu ban đầu và chất trung gian. Các định nghĩa về gốc này có thể được phối hợp với một định nghĩa khác nếu cần, nghĩa là bao gồm các tổ hợp giữa các khoảng ưu tiên tương ứng.

Được ưu tiên theo sáng chế là sử dụng hợp chất có công thức (I) trong đó tổ hợp các định nghĩa nêu trên được ưu tiên có mặt.

Được đặc biệt ưu tiên theo sáng chế là sử dụng hợp chất có công thức (I) trong đó tổ hợp các định nghĩa nêu trên được đặc biệt ưu tiên có mặt.

Được ưu tiên rất đặc biệt theo sáng chế là sử dụng hợp chất có công thức (I) trong đó tổ hợp các định nghĩa nêu trên được đặc biệt ưu tiên có mặt.

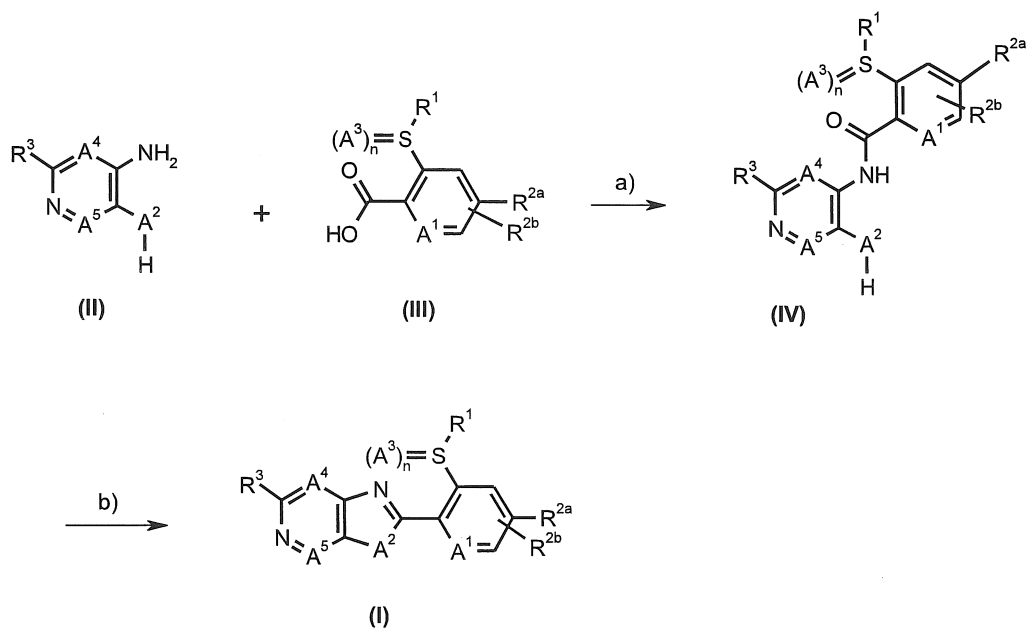
Sáng chế nhấn mạnh việc sử dụng hợp chất có công thức (I) trong đó tổ hợp các định nghĩa nêu trên được ưu tiên có mặt.

Sáng chế đặc biệt nhấn mạnh việc sử dụng hợp chất có công thức (I) trong đó tổ hợp các định nghĩa nêu trên được đặc biệt ưu tiên có mặt.

Mô tả chi tiết sáng chế

Phụ thuộc vào bản chất của nhóm thể, hợp chất có công thức (I) có thể ở dạng đồng phân hình học và/hoặc chất đồng phân hoạt tính quang học hoặc hỗn hợp các chất đồng phân tương ứng trong các chế phẩm khác nhau. Các chất đồng phân lập thể này, ví dụ, là chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atropi hoặc đồng phân hình học. Vì thế, sáng chế bao hàm chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ của các chất đồng phân này.

Hợp chất theo sáng chế có công thức (I) có thể được thu được nhờ quy trình nêu trong các sơ đồ sau:

Quy trình A

Mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R^{2b}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên.

Bước a)

Hợp chất có công thức (IV) có thể được điều chế theo cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US5576335 bằng cách cho hợp chất có công thức (II) phản ứng với axit carboxylic có công thức (III) khi có mặt chất ngưng tụ.

Hợp chất có công thức (II) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2003/69257 hoặc WO2006/65703.

Axit carboxylic có công thức (III) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2010/234604, WO2012/61926 hoặc Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

Phản ứng của hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (III) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản

ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; thơm hydrocacbon, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Tác nhân ngưng tụ thích hợp, ví dụ, là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0 đến 180°C, được ưu tiên là thực hiện phản ứng ở áp suất tiêu chuẩn và ở nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức (IV), ví dụ theo cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu WO2012/86848.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông dụng mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; được hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt chất ngưng tụ, axit, bazơ hoặc tác nhân clo hóa.

Ví dụ về tác nhân ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; anhydrit như axetic anhydrit, trifloroaxetic anhydrit; hỗn hợp gồm triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp gồm triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

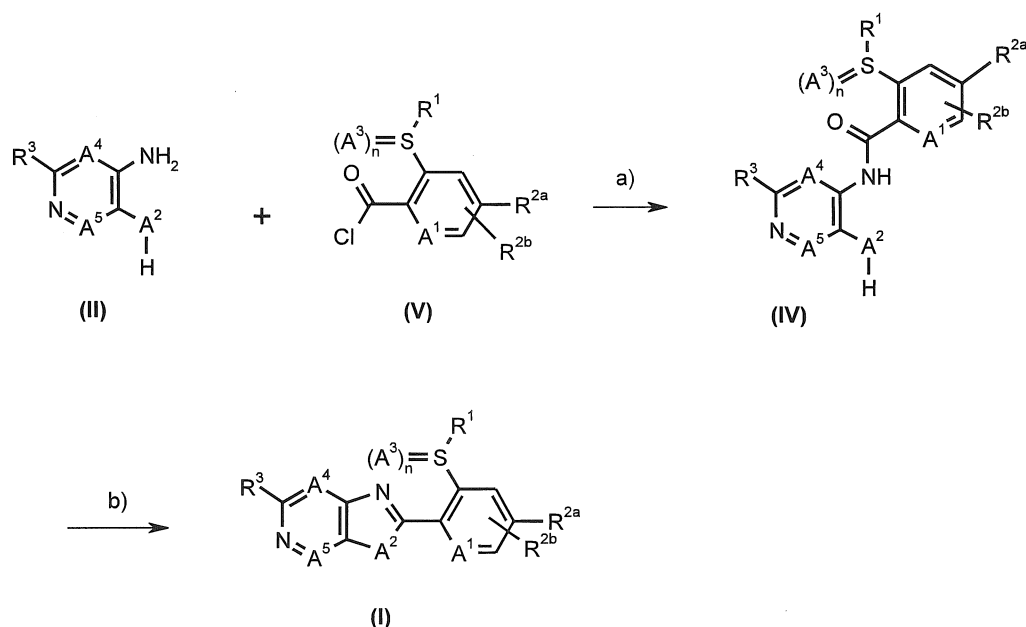
Ví dụ về axit thích hợp có thể được sử dụng trong phản ứng đã nêu là axit sulphonic như axit para-toluensulphonic; axit carboxylic như axit axetic, hoặc axit polyphosphoric.

Ví dụ về bazơ thích hợp là dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); tertiary amin như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrit.

Ví dụ về tác nhân clo hóa thích hợp là phospho oxyclorea.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Quy trình B



Mỗi nhóm R¹, R^{2a}, R^{2b}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ và n được xác định như trên.

Bước a)

Theo phương án khác của sáng chế, hợp chất có công thức (IV) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức (II) phản ứng với cacbonyl clorua có công thức (V) khi có mặt chất ngưng tụ.

Cacbonyl clorua có công thức (V) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế

theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2010/234603 hoặc US2010/234604.

Phản ứng của hợp chất có công thức (II) với cacbonyl clorua có công thức (V) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorua, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; hydrocacbon béo như hexan, heptan hoặc octan; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

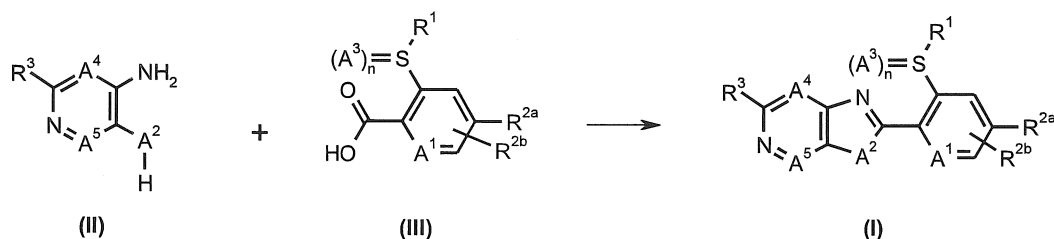
Tốt hơn là phản ứng được thực hiện khi có mặt bazơ. Bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Được ưu tiên là sử dụng bazơ được chọn bằng cách lấy Ví dụ từ nhóm bao gồm axetat, phosphat, cacbonat và hydrocacbonat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Được đặc biệt ưu tiên là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, caesium cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat. Bazơ thích hợp là amin bậc bốn như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin, và nitơ dị vòng như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 4-dimetylaminopyridin và 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU).

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng và ở nhiệt độ từ -20°C đến 100°C, được ưu tiên là thực hiện phản ứng ở áp suất tiêu chuẩn và ở nhiệt độ từ 0°C đến 80°C.

Bước b)

Việc chuyển hóa tiếp hợp chất có công thức (IV) thành hợp chất có công thức (I) được thực hiện như trong quy trình A, bước b).

Quy trình C



Mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên.

Theo phương án khác của sáng chế, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế theo quy trình một giai đoạn từ hợp chất trung gian có công thức (II) và (III) khi có mặt chất ngưng tụ.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông dụng mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; được halogen hóa hydrocacbon, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol, etanol hoặc isopropanol; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xilen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nito, ví dụ pyridin.

Ví dụ về tác nhân ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; anhydrit như axetic anhydrit, trifloroaxetic anhydrit; hỗn hợp gồm triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp gồm triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt axit hoặc bazơ.

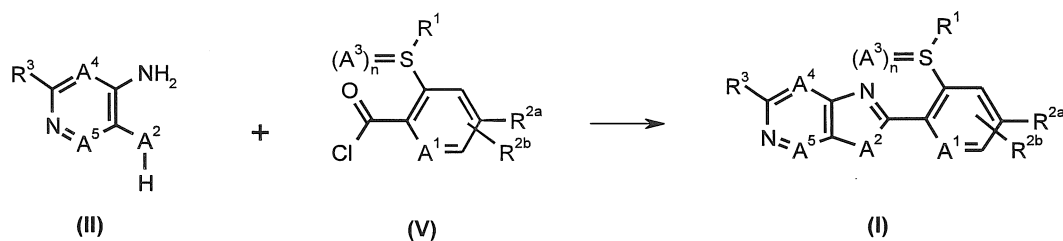
Ví dụ về axit mà có thể được sử dụng trong phản ứng đã nêu là axit sulphoníc như axit metansulphoníc hoặc axit para-toluensulphoníc; axit carboxylic như axit axetic, hoặc axit polyphosphoric.

Ví dụ về bazơ thích hợp là nitơ dị vòng như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecene (DBU); amin bậc bốn như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrit.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt chất xúc tác thích hợp, ví dụ 1-hydroxybenzotriazol.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Quy trình D



Mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên.

Theo phương án khác của sáng chế, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế theo quy trình một giai đoạn từ hợp chất trung gian có công thức (II) và (V).

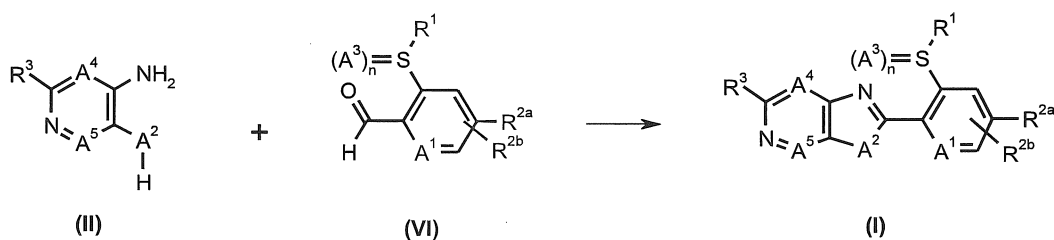
Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông dụng mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol, etanol hoặc isopropanol; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Tốt hơn là thực hiện phản ứng khi có mặt bazơ. Bazơ thích hợp là bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Được ưu tiên là sử dụng bazơ được chọn bằng cách lấy Ví dụ từ nhóm bao gồm axetat, phosphat, hydroxit, cacbonat và hydrocacbonat

của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Được ưu tiên là caesium cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydroxit và kali hydroxit. Bazo thích hợp khác là amin bậc bốn như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin, nitơ dị vòng như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 4-dimetylaminopyridin và 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecene (DBU).

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Quy trình E



Mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên.

Theo phương án khác của sáng chế, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (II) và aldehyt có công thức (VI) khi có mặt tác nhân oxy hóa.

Aldehyt có công thức (VI) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2009/192195, US2010/227894 hoặc *Angewandte Chemie, International Edition*, 48 (2009), 7064-7068.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol, etanol hoặc isopropanol; este như etyl axetat; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

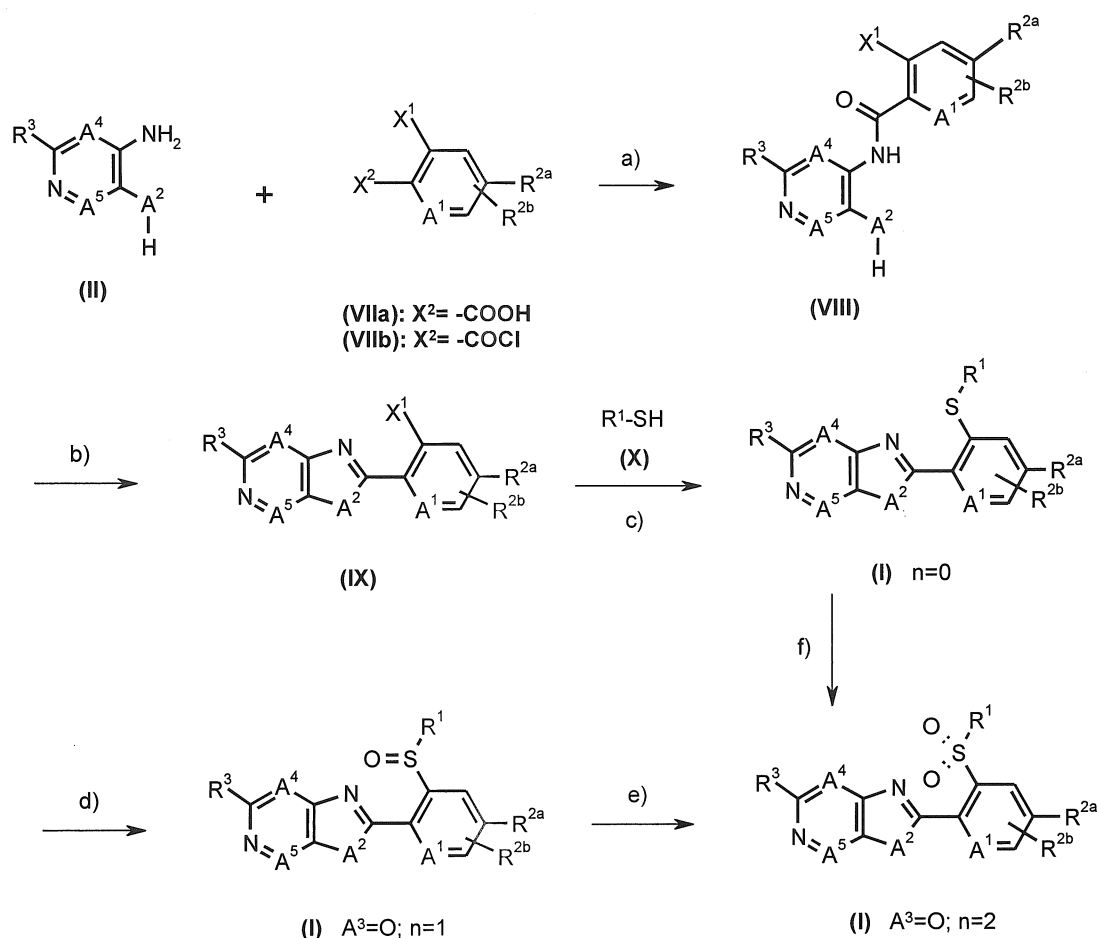
Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt axit. Ví dụ về axit mà có thể được sử dụng trong phản ứng đã nêu là axit sulphonic như axit metansulphonic hoặc axit para-toluensulphonic; axit carboxylic như axit axetic, hoặc axit polyphosphoric.

Phản ứng cũng có thể được thực hiện khi có mặt sulphit. Ví dụ về sulphit mà có thể được sử dụng trong phản ứng đã nêu là natri hydrosulphit hoặc natri sulphit.

Ví dụ về tác nhân oxy hóa mà được sử dụng trong phản ứng đã nêu là oxy, đồng(II) clorua hoặc DDQ.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0 đến 200°C, được ưu tiên là thực hiện phản ứng ở áp suất tiêu chuẩn và ở nhiệt độ từ 20 đến 150°C.

Quy trình F



Mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n được xác định như trên, và X^1 là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (VIII) có thể được điều chế theo cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US5576335 bằng cách cho hợp chất có công thức (II) phản ứng với axit carboxylic có công thức (VIIa) hoặc với cacbonyl clorua có công thức (VIIb) khi có mặt chất ngưng tụ hoặc bazơ.

Hợp chất có công thức (II) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2003/69257 hoặc WO2006/65703.

Axit carboxylic có công thức (VIIa) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2010/234604, WO2012/61926 hoặc Biohữu cơ và Medicinal Chemistry Letters, **18** (2008), 5023-5026.

Cacbonyl clorua có công thức (VIIb) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2010/234603 hoặc US2010/234604.

Phản ứng của hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (VIIa) hoặc cacbonyl clorua có công thức (VIIb) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nito, ví dụ pyridin.

Tác nhân ngưng tụ thích hợp, ví dụ, là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit.

Bazơ thích hợp là bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Được ưu tiên là sử dụng bazơ được chọn bằng cách lấy Ví dụ từ nhóm bao gồm axetat, phosphat, cacbonat và hydrocacbonat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Được đặc biệt ưu tiên là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, caesium cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0 đến 180°C, được ưu tiên là thực hiện phản ứng ở áp suất tiêu chuẩn và ở nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Hợp chất có công thức (IX) có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất trung gian có công thức (VIII), ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu WO2012/86848.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (IX) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxietan, tert-butyl metyl ete; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt chất ngưng tụ, axit, bazơ hoặc tác nhân clo hóa.

Ví dụ về tác nhân ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; anhydrit như axetic anhydrit, trifloroaxetic anhydrit; hỗn hợp gồm triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp gồm triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

Ví dụ về axit thích hợp mà có thể được sử dụng trong phản ứng đã nêu là axit sulphonic như axit para-toluensulphonic; axit carboxylic như axit axetic, hoặc axit polyphosphoric.

Ví dụ về bazơ thích hợp là nitơ dị vòng như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); amin bậc bốn như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrit.

Ví dụ về thích hợp tác nhân clo hóa là phospho oxyclorea.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước c)

Hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất trung gian có công thức (IX) phản ứng với hợp chất trung gian có công thức (X) khi có mặt bazơ.

Hợp chất dẫn xuất mercaptan có công thức (X), ví dụ metyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông dụng mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulphoxit.

Ví dụ về bazơ thích hợp là bazơ vô cơ thuộc nhóm bao gồm axetat, phosphat và cacbonat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Được ưu tiên là caesium cacbonat, natri

cacbonat và kali cacbonat. Bazo thích hợp khác là hydrit kim loại kiềm thổ, ví dụ natri hydrit.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Trong phản ứng nêu trên, X¹ tốt hơn là nguyên tử flo hoặc clo.

Bước d)

Hợp chất có công thức (I) trong đó A³ là oxy và n là 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Việc oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà thường là trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propion hoặc nước.

Ví dụ về tác nhân oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloroperbenzoic hoặc natri periodat.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Bước e)

Hợp chất có công thức (I) trong đó A³ là oxy và n là 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (I) trong đó A³ là oxy và n là 1. Việc oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propion hoặc nước.

Ví dụ về tác nhân oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloroperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Bước f)

Hợp chất có công thức (I) trong đó A^3 là oxy và n là 2 cũng có thể được điều chế theo quy trình một giai đoạn bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Việc oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclorometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về thích hợp tác nhân oxy hóa là hydro peroxit và axit meta-cloroperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Quy trình G

Hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 = halogen có thể được chuyển hóa thành hợp chất khác có công thức (I) trong đó R^3 là gốc khác theo định nghĩa này.

Hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là gốc liên kết với C thuộc nhóm bao gồm aryl hoặc heteroaryl theo định nghĩa này có thể được điều chế, ví dụ, từ hợp chất có công thức (I) trong đó tốt hơn là R^3 halogen thuộc nhóm bao gồm clo hoặc brom bằng các kỹ thuật thông thường đã biết (cũng xem *Chem. Rev.* **1995**, *95*, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, *58*, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

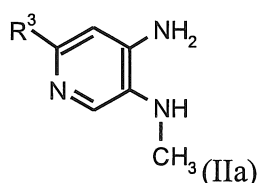
Ví dụ, hợp chất trong đó R^3 tốt hơn là clo hoặc brom có thể được cho phản ứng với thích hợp axit arylboronic hoặc este của nó bằng các phương pháp đã biết (cũng xem WO2010071819) khi có mặt chất xúc tác thích hợp thuộc nhóm bao gồm muối của kim loại chuyển tiếp để thu được hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là gốc thuộc nhóm bao gồm aryl. Ví dụ về chất xúc tác cộng hợp được ưu tiên bao gồm chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene]dicloropaladi (II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Tốt hơn là các chất phụ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để thực hiện quy trình là cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết đã được biết đến và/hoặc có bán trên thị trường, ví dụ được điều chế bằng các kỹ thuật thông thường đã biết (cũng xem *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

Việc điều chế hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là hetaryl liên kết với N, ví dụ imidazol-1-yl và pyrazol-1-yl có thể được thực hiện bằng các phương pháp đã được biết đến trong lĩnh vực chuyên ngành (Ví dụ, xem *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578), tốt hơn là khi có mặt đồng (I) iodua và các chất phụ trợ phản ứng bazơ, ví dụ *trans*-N,N'-dimethylxyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ hydrocacbon béo hoặc thơm. Được ưu tiên là sử dụng toluen.

Một số hợp chất có công thức (II) là mới.

Hợp chất mới là hợp chất có công thức (IIa)



trong đó R^3 được xác định như trên, mà R^3 không được là clo, brom hoặc CHO.

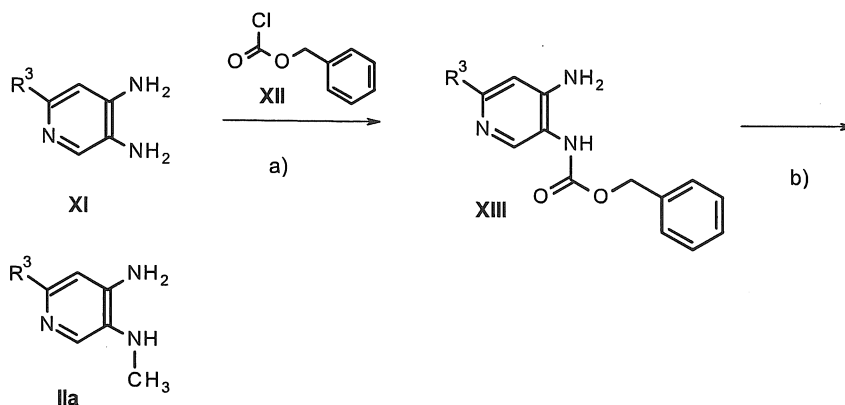
Sáng chế cũng đề xuất hợp chất có công thức (IIa) trong đó R^3 là (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, trong đó R^3 không phải là CF₃ hoặc CHF₂.

Tốt hơn là, R^3 là CH₂F, C₂H₄F, C₂H₃F₂, C₂H₂F₃, C₂HF₄, C₂F₅, n-C₃F₇, i-C₃F₇, OCH₂F, SCH₂F, SOCH₂F, SO₂CH₂F, OCHF₂, SCHF₂, SOCHF₂, SO₂CHF₂, OCF₃, OCF₂Cl, OCFCl₂, SCF₃, SOCF₃, SO₂CF₃, OC₂H₄F, SC₂H₄F, SOC₂H₄F, SO₂C₂H₄F, OC₂H₃F₂, SC₂H₃F₂, SOC₂H₃F₂, SO₂C₂H₃F₂, OC₂H₂F₃, SC₂H₂F₃, SOC₂H₂F₃, SO₂C₂H₂F₃, OC₂HF₄, SC₂HF₄, SOC₂HF₄, SO₂C₂HF₄, OC₂F₅, SC₂F₅, SOC₂F₅, SO₂C₂F₅, n-OC₃F₇, n-SC₃F₇, n-SOC₃F₇, n-SO₂C₃F₇, i-OC₃F₇, i-SC₃F₇, i-SOC₃F₇ hoặc i-SO₂C₃F₇.

Còn tốt hơn là, R^3 là CH₂F, OCF₃, C₂H₄F, C₂H₃F₂, C₂H₂F₃, C₂HF₄, C₂F₅, SCF₃, SOCF₃ hoặc SO₂CF₃.

Tốt nhất là, R^3 là C_2F_5 .

Quy trình H



Gốc R^3 được xác định như trên.

Bước a)

Hợp chất có công thức (XIII) có thể được điều chế theo cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu WO2005/55928 hoặc Journal of Medicinal Chemistry, **48** (2005), p. 6128-6139, bằng cách cho hợp chất có công thức (XI) phản ứng với benzyl clorocacbonat (benzyl cloroformat) có công thức (XII), ví dụ khi có mặt bazơ.

Hợp chất có công thức (XI) đã được bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu WO2012/3576, WO2007/47793 hoặc WO2006/65703.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (XIII) có thể được thực hiện in substance hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxietan, tert-butyl metyl ete; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril hoặc hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen.

Ví dụ về bazơ thích hợp là bazơ vô cơ thuộc nhóm bao gồm axetat, phosphat và cacbonat của kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Được ưu tiên là caesium cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 120°C.

Bước b)

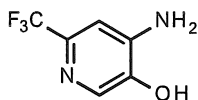
Hợp chất có công thức (IIa) có thể được điều chế bằng cách khử hợp chất có công thức (XIII), ví dụ cách tương tự với quy trình được nêu trong tài liệu Journal of Heterocyclic Chemistry, **22** (1985), p. 313-318.

Ví dụ về tác nhân khử thích hợp là lithium nhôm hydrit.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (IIa) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, được ưu tiên là thực hiện phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là ete, ví dụ diethyl ete, diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan hoặc tert-butyl metyl ete.

Phản ứng có thể được thực hiện dưới áp suất giảm, ở áp suất tiêu chuẩn hoặc ở áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 100°C.

Hợp chất mới khác là hợp chất có công thức (II-02)



Phương pháp và ứng dụng

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp để phòng trừ động vật gây hại, trong đó hợp chất có công thức (I) được cho tác dụng trên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng. Tốt hơn là việc phòng trừ động vật gây hại thực hiện trong lĩnh vực nông và lâm nghiệp, và trong lĩnh vực bảo quản vật liệu. Tốt hơn là loại trừ phương pháp phẫu thuật

hoặc điều trị trên cơ thể người hoặc động vật và phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm thuốc diệt loài gây hại, đặc biệt là thuốc bảo vệ mùa màng.

Theo ngữ cảnh sáng chế, thuật ngữ "thuốc diệt loài gây hại" trong mỗi trường hợp cũng luôn bao gồm thuật ngữ "thuốc bảo vệ mùa màng".

Hợp chất có công thức (I), do được cây chống chịu tốt, độc tính với động vật máu nóng chấp nhận được và độ tương thích môi trường tốt, là thích hợp để bảo vệ cây trồng và phần của cây chống lại các yếu tố tác động sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, làm tăng chất lượng vật liệu thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, đặc biệt là côn trùng, động vật chân đốt, giun sán, giun tròn và động vật thân mềm, mà thường gặp phải trong nông nghiệp, trong lĩnh vực làm vườn, trong lĩnh vực chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong lĩnh vực trồng rừng, trong vườn cây và địa điểm vui chơi, trong lĩnh vực bảo quản sản phẩm cần lưu trữ và trong lĩnh vực bảo quản nguyên liệu, và trong lĩnh vực vệ sinh. Tốt hơn là, chúng cũng có thể được sử dụng làm thuốc diệt loài gây hại. Chúng có tác dụng chống lại các loài nhạy cảm và đề kháng thông thường và chống lại toàn bộ hoặc một số giai đoạn phát triển. Động vật gây hại nêu trên bao gồm:

động vật gây hại thuộc ngành Động vật chân khớp, đặc biệt là thuộc lớp Arachnida, ví dụ *Acarus* spp., ví dụ *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., ví dụ *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., ví dụ *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., ví dụ *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., ví dụ *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., ví dụ *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., ví dụ *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nupharsa* spp., *Oligonychus* spp., ví dụ *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus*

mangiferus, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, hoặc *nithodorus* spp., hoặc *nithonyssus* spp., *Panonychus* spp., ví dụ *Panonychus citri* (= *Metatetranychus citri*), *Panonychus ulmi* (= *Metatetranychus ulmi*), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., ví dụ *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., ví dụ *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

thuộc lớp Chilopoda, ví dụ *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

thuộc bộ hoặc thuộc lớp Collembola, ví dụ *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

thuộc lớp Diplopoda, ví dụ *Blaniulus guttulatus*;

thuộc lớp Côn trùng, ví dụ thuộc bộ Blattodea, ví dụ *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Lurucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., ví dụ *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

thuộc bộ Coleoptera, ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp.,

ví dụ *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., ví dụ *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligetes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, hoặc *yttes rhinoceros*, hoặc *yzaphilus surinamensis*, hoặc *yzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dụ *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *ProStephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dụ *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., ví dụ *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., ví dụ *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ *Zabrus tenebrioides*;

thuộc bộ *Diptera*, ví dụ *Aedes* spp., ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ *Anopheles quadrimaculatus*,

Anopheles gambiae, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chsátomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., ví dụ *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., ví dụ *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., ví dụ *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., ví dụ *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilga*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., ví dụ *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonina* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilca cazai*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*;

thuộc bộ Hemiptera, ví dụ *Acizzia acaciaebaillyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleyrodes proltella*, *Alurolobus barodensis*, *Alurolobus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum*

solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melalrucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., ví dụ Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., ví dụ Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptonossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Diallurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., ví dụ Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., ví dụ Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stenseni, Eriosoma spp., ví dụ Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., ví dụ Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., ví dụ Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., ví dụ Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., ví dụ Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lili, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., ví dụ Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Nephotettix spp., ví dụ Nephotettix cincticeps, Nephotettix nigropictus, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., hoặc thezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., ví dụ Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., ví dụ Pemphigus bursarius, Pemphigus populiveneris, Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., ví dụ Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., ví dụ Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., ví dụ Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., ví dụ Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus,

Pseudococcus maritimus, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsi* spp., *Psylla* spp., ví dụ *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., ví dụ *Quadraspidiotus juglansregiae*, *Quadraspidiotus ostreaeformis*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., ví dụ *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., ví dụ *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyrae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., ví dụ *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., ví dụ *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

thuộc phân bộ Heteroptera, ví dụ *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., ví dụ *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., ví dụ *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilllus*, *Leptocorisa* spp., *Leptocorisa varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., ví dụ *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., ví dụ *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., ví dụ *Nezara viridula*, *Oebalus* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., ví dụ *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

thuộc bộ Hymenoptera, ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., ví dụ *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema humil*, *Monomorium pharaonis*, *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Urocetus* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Xeris* spp.;

thuộc bộ Isopoda, ví dụ *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

thuộc bộ Isoptera, ví dụ *Coptotermes* spp., ví dụ *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Microtermes obesi*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., ví dụ *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

thuộc bộ Lepidoptera, ví dụ *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., ví dụ *Adoxophyes orana*, *Aedia luucomelas*, *Agrotis* spp., ví dụ *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., ví dụ *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., ví dụ *Anticarsia gemmatilis*, *Argyroplote* spp., *Barathra brassicae*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristonura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., ví dụ *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., ví dụ *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., ví dụ *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., ví dụ *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., ví dụ *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Lrucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., ví dụ *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., ví dụ *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., ví dụ *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., ví dụ *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., hoặc *ia* spp., hoặc *thaga* spp., *Ostrinia* spp., ví dụ *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., ví dụ *Pectinophora gossypiella*, *Periluoptera* spp., *Phthorimaea* spp., ví dụ *Phthorimaea*

operculella, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., ví dụ *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., ví dụ *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., ví dụ *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia* bao gồm, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., ví dụ *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., ví dụ *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., ví dụ *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., ví dụ *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

thuộc bộ Orthoptera hoặc Saltatoria, ví dụ *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., ví dụ *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., ví dụ *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., ví dụ *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

thuộc bộ Phthiraptera, ví dụ *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

thuộc bộ Psocoptera, ví dụ *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

thuộc bộ Siphonaptera, ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalogenus* spp., ví dụ *Ctenocephalogenus canis*, *Ctenocephalogenus felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

thuộc bộ Thysanoptera, ví dụ *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., ví dụ *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., ví dụ *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

thuộc bộ Zygentoma (= Thysanura), ví dụ *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

thuộc lớp Symphyla, ví dụ *Scutigera* spp., ví dụ *Scutigera immaculata*;

động vật gây hại thuộc ngành Mollusca, ví dụ thuộc lớp Bivalvia, ví dụ *Dreissena* spp.,

và còn thuộc lớp Gastropoda, ví dụ *Arion* spp., ví dụ *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., ví dụ *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

ký sinh trùng trên động vật hoặc người thuộc ngành Platyhelminthes và Nematoda, ví dụ *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., *Diphylobothrium* spp., *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Echinococcus* spp., *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., *Eucolurus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., *Hyostrongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp., *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp.;

động vật gây hại cho cây trồng thuộc ngành Nematoda, nghĩa là giun tròn ký sinh trên cây, đặc biệt là *Aglenchus* spp., ví dụ *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., ví dụ *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., ví dụ *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*,

Belonolaimus spp., ví dụ *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., ví dụ *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., ví dụ *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., ví dụ *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., ví dụ *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., ví dụ *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., ví dụ *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., ví dụ *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicyclophora* spp., *Heterodera* spp., ví dụ *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., ví dụ *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., ví dụ *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., ví dụ *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., ví dụ *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilnchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., ví dụ *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., ví dụ *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., ví dụ *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., ví dụ *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., ví dụ *Xiphinema index*.

Ngoài ra, có thể phòng trừ bộ Trùng cầu, thuộc phân giới Động vật nguyên sinh, ví dụ *Eimeria* spp.

Hợp chất có công thức (I) có thể tùy ý, ở một số nồng độ hoặc tỷ lệ sử dụng, cũng có thể được sử dụng làm thuốc diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc chất cải thiện đặc tính cây trồng, làm chất diệt vi sinh vật hoặc chất diệt bào tử, ví dụ làm chất diệt nấm, chất chống nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt virus (bao gồm chất chống lại viroït) hoặc làm chất chống lại MLO (sinh vật giống mycoplasma) và RLO (sinh vật giống rickettsia). Nếu thích hợp, chúng cũng có thể được sử dụng làm chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các thành phần hoạt tính khác.

Chế phẩm

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm và dạng sử dụng được bào chế từ chế phẩm làm thuốc diệt loài gây hại, ví dụ chất lỏng để tưới, nhỏ giọt và phun, chứa ít nhất là một hợp chất có công thức (I). Trong một số trường hợp, dạng sử dụng được bào chế còn chứa thuốc diệt loài gây hại và/hoặc chất điều chỉnh mà làm cải thiện tác dụng, như chất xuyên qua, ví dụ dầu thực vật, ví dụ dầu hạt cải dầu, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ dầu parafin, alkyl este của axit béo thực vật, ví dụ metyl este của dầu hạt cải dầu hoặc metyl este của dầu đậu nành, hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất phân tán, ví dụ alkylsiloxan và/hoặc muối, ví dụ muối hữu cơ hoặc vô cơ của amoniac hoặc phospho, ví dụ amoniac sulphat hoặc diamoniac hydrophosphat và/hoặc chất làm tăng độ lưu giữ, ví dụ polyme dioctyl sulphosuccinat hoặc hydroxypropyl gua và/hoặc chất làm ẩm, ví dụ glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ phân bón chứa amoniac-, kali- hoặc phospho.

Chế phẩm thông thường, ví dụ, là chất lỏng tan trong nước (SL), thể nhũ dịch đặc (EC), nhũ dịch trong nước (EW), thể hỗn dịch đặc (SC, SE, FS, OD), hạt phân tán được trong nước (WG), hạt (GR) và thể đặc đóng nang (CS); các dạng chế phẩm này và khác nữa được mô tả, ví dụ, trong Crop Life International và trong Pesticide Specifications, Manual on development and use của FAO và WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, được chuẩn bị cho buổi đồng hội thảo giữa FAO/WHO về Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Chế phẩm này, ngoài một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I), tùy ý còn chứa thành phần có hoạt tính hóa nông.

Tốt hơn là chế phẩm hoặc dạng sử dụng này chứa các chất phụ trợ, ví dụ chất độn, dung môi, spontaneity chất tăng cường, chất mang, chất nhũ hóa, chất gây phân tán, chất bảo vệ chống đóng băng, chất diệt sinh vật, chất làm đặc và/hoặc các chất phụ trợ khác, ví dụ chất điều chỉnh. Chất điều chỉnh trong ngữ cảnh này là thành phần cải thiện hoạt tính sinh học của chế phẩm mà bản thân nó vốn không có hoạt tính sinh học. Ví dụ về chất điều chỉnh là các chất mà làm tăng khả năng lưu giữ, đặc tính lan tỏa, khả năng bám dính vào bề mặt lá hoặc khả năng xuyên qua.

Các chế phẩm này được điều chế theo cách đã được biết đến, ví dụ bằng cách phối trộn hợp chất có công thức (I) với các chất phụ trợ, ví dụ chất độn, dung môi và/hoặc chất mang dạng rắn và/hoặc các chất phụ trợ khác, ví dụ chất hoạt động bề mặt. Các chế phẩm này được tạo ra trong các cơ sở thích hợp hoặc trước hoặc trong khi sử dụng.

Các chất phụ trợ được sử dụng có thể là chất thích hợp để mang lại các đặc tính đặc biệt, như một số đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học, cho chế phẩm chứa hợp chất có công thức (I), hoặc cho dạng sử dụng được bào chế thu được từ các chế phẩm này (ví dụ thuốc diệt loài gây hại dùng ngay như chất lỏng để phun hoặc sản phẩm phủ hạt).

Chất độn thích hợp, ví dụ, là nước, chất lỏng hóa học hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ thuộc nhóm hydrocacbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphthalen, clorobenzen), rượu và polyol (mà, nếu thích hợp, có thể cũng được thế, este hóa và/hoặc este hóa), keton (như axeton, xyclohexanon), este (bao gồm chất béo và dầu) và (poly)ete, amin không được thế và được thế, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton, sulphon và sulphoxit (như dimetyl sulphoxit).

Nếu chất độn được sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, dung môi hữu cơ làm dung môi phụ trợ. Dung môi lỏng hữu dụng chủ yếu bao gồm: chất thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphthalen, chất thơm được clo hóa hoặc hydrocacbon béo được clo hóa như clorobenzen, cloroetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan hoặc parafin, ví dụ phân đoạn dầu khoáng, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu như butanol hoặc glycol và ete và este của nó, keton như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit và dimetyl sulphoxit, hoặc cả nước.

Nói chung, có thể sử dụng dung môi thích hợp bất kỳ. Ví dụ về dung môi thích hợp là hydrocacbon thơm, như xylen, toluen hoặc alkylnaphthalen, hydrocacbon thơm hoặc béo được clo hóa, như clorobenzen, cloroetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo, như xyclohexan, parafin, phân đoạn dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu, như metanol, etanol, isopropanol, butanol hoặc glycol và ete và este của chúng, keton như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh, như dimetyl sulphoxit, và cả nước.

Nói chung, có thể sử dụng tất cả các chất mang thích hợp. Chất mang đặc biệt hữu dụng bao gồm: Ví dụ muối amoniac và chất khoáng tự nhiên như cao lanh, đất sét, bột talc, phấn, thạch anh, attapulgit, monmorilonit hoặc tảo cát, và chất khoáng tổng hợp như silic oxit nghiền mịn, nhôm oxit và silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, resin, sáp và/hoặc phân bón dạng rắn. Cũng có thể sử dụng hỗn hợp gồm các chất mang này. Chất mang hữu dụng cho hạt bao gồm: Ví dụ đá tự nhiên nghiền và phân đoạn như canxit, đá cẩm thạch, đá bột, sepiolit, dolomit, và hạt tổng hợp chứa bột vô cơ và hữu cơ, và cả hạt chứa chất liệu hữu cơ như mùn cưa, giấy, vỏ dừa, lõi ngô và thân cây thuốc lá.

Cũng có thể sử dụng chất độn hoặc dung môi là chất khí hóa lỏng. Đặc biệt thích hợp là chất độn hoặc chất mang là chất khí ở nhiệt độ chuẩn và ở áp suất chuẩn, ví dụ chất đẩy khí dung như halohydrocacbon, hoặc cả butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Ví dụ về chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất gây phân tán hoặc chất làm ẩm có đặc tính ion hoặc không ion hoặc hỗn hợp gồm chất hoạt động bề mặt là muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulphonic, muối của axit phenolsulphonic hoặc axit naphthalenulphonic, thể đa ngưng tụ của etylen oxit với rượu béo hoặc với axit béo hoặc với amin béo, với phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), muối của este sulphosuccinic, hợp chất dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), este phosphoric của rượu hoặc phenols polyetoxyl hóa, este axit béo của polyol, và hợp chất dẫn xuất của hợp chất chứa sulphat, sulphonat và phosphat, ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulphonat, alkyl sulphat, arylsulphonat, protein hydrolysat, chất thải lỏng của lignosulphit và methylxenuloza. Sự có mặt của chất hoạt động bề mặt là có lợi nếu một trong các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một chất mang trơ không tan trong nước và khi ứng dụng diễn ra trong nước.

Các chất phụ trợ khác mà có thể có mặt trong chế phẩm và dạng sử dụng được bào chế có nguồn gốc từ chế phẩm là thuốc nhuộm như chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và chất xanh phổ, và thuốc nhuộm hữu cơ như thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm phthaloxyanin kim loại, và chất dinh dưỡng và chất dinh dưỡng dạng vết như muối của sắt, mangan, boron, đồng, coban, molybdenum và kẽm.

Ngoài ra, chất làm ổn định, như chất làm ổn định ở nhiệt độ thấp, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất làm ổn định ở điều kiện ánh sáng hoặc các chất khác mà cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý, có thể có mặt. Ngoài ra, chất tạo bọt hoặc chất loại bọt có thể có mặt.

Ngoài ra, chế phẩm và dạng sử dụng được bào chế có nguồn gốc từ chế phẩm này có thể còn chứa, ở dạng các chất phụ trợ bổ sung, chất gây dính như carboxymetyl xenluloza và tự polyme nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc mạng, như gồm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, hoặc cả phospholipit tự nhiên như cephalin và lecithin và phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ có thể khác là dầu khoáng và dầu thực vật.

Tùy ý là, các chất phụ trợ khác nữa có thể có mặt trong chế phẩm và dạng sử dụng được bào chế có nguồn gốc từ chế phẩm này. Ví dụ về chất phụ trợ khác là chất thơm, keo bảo vệ, binders, chất gây bám dính, chất làm đặc, chất xúc biến, chất xuyên qua, chất làm tăng độ lưu giữ, chất làm ổn định, chất kèm hãm, chất tạo phức, chất làm ẩm, chất phân tán. Nói chung, hợp chất có công thức (I) có thể được phối hợp với chất phụ trợ dạng rắn hoặc lỏng thường được sử dụng cho mục đích bào chế.

Chất làm tăng độ lưu giữ hữu dụng bao gồm tất cả các chất làm giảm sức căng bề mặt động học, ví dụ dioctyl sulphosuccinat, hoặc làm tăng độ đàn nhót, ví dụ polyme hydroxypropylgua.

Chất xuyên qua hữu dụng theo ngữ cảnh sáng chế bao gồm tất cả các chất mà thường được sử dụng để cải thiện khả năng xuyên qua của thành phần có hoạt tính hóa nông vào cây trồng. Chất xuyên qua được xác định trong ngữ cảnh này nhờ khả năng xuyên qua từ chất lỏng (thường là nước) được sử dụng và/hoặc từ lớp bao phun đi vào lớp cutin của cây trồng và nhờ đó, làm tăng khả năng di chuyển của thành phần hoạt tính trong lớp cutin. Phương pháp mà đã được mô tả trong tài liệu chuyên ngành (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác định. Các ví dụ bao gồm rượu alkoxylat như etoxylat béo của dừa (10) hoặc isotridecyl etoxylat (12), este của axit béo, ví dụ metyl este dầu hạt cải dầu hoặc metyl este của dầu đậu nành, amin alkoxylat béo, ví dụ tallowamin etoxylat (15), hoặc amoniac và/hoặc muối phospho, ví dụ amoniac sulphat hoặc diamoniac hydrophosphat.

Tốt hơn là chế phẩm chứa từ 0,00000001% đến 98% trọng lượng là hợp chất có công thức (I), được đặc biệt ưu tiên là từ 0,01% đến 95% trọng lượng là hợp chất có công thức (I), Còn tốt hơn là từ 0,5% đến 90% trọng lượng là hợp chất có công thức (I), tính theo trọng lượng chế phẩm.

Hàm lượng hợp chất có công thức (I) trong dạng sử dụng được bào chế từ chế phẩm (cụ thể là thuốc diệt loài gây hại) có thể thay đổi trong một khoảng rộng. Nồng độ hợp chất có công thức (I) trong dạng sử dụng được bào chế có thể thường là từ 0,00000001% đến 95% trọng lượng hợp chất có công thức (I), tốt hơn là từ 0,00001% đến 1% trọng lượng, tính theo trọng lượng dạng sử dụng. Thực hiện ứng dụng theo cách được thiết kế phù hợp với dạng sử dụng được bào chế.

Hỗn hợp

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng trong hỗn hợp với một hoặc nhiều chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, chất diệt động vật thân mềm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt vi sinh vật, sinh vật có lợi, thuốc diệt cỏ, phân bón, chất xua đuổi chim, chất bổ dưỡng cho cây, chất triệt sinh, chất an toàn, chất bán hóa học và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng cây trồng thích hợp, để nhằm, ví dụ, mở rộng phổ hoạt động, kéo dài thời gian tác dụng, gia tăng tốc độ tác dụng, ngăn ngừa sức kháng lại hoặc ngăn ngừa việc phát sinh kháng thuốc. Ngoài ra, hỗn hợp thành phần hoạt tính kiểu này có thể cải thiện sự sinh trưởng của cây trồng và/hoặc sức chống chịu với các yếu tố phi sinh học, ví dụ nhiệt độ thấp hoặc cao, với khô hạn hoặc với mức nước cao hoặc độ mặn trong đất cao. Cũng có thể cải thiện tính năng ra hoa và kết quả, làm tối ưu khả năng nảy mầm và phát triển rễ, làm thuận lợi cho việc thu hoạch và cải thiện năng suất, ảnh hưởng đến việc chín, cải thiện chất lượng và/hoặc sản phẩm thu hoạch có giá trị dinh dưỡng, kéo dài thời gian bảo quản và/hoặc cải thiện khả năng chế biến của sản phẩm thu hoạch được.

Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể có mặt trong hỗn hợp với các thành phần hoạt tính khác hoặc chất bán hóa học như chất hấp dẫn và/hoặc chất xua đuổi chim và/hoặc chất hoạt hóa cây trồng và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng và/hoặc phân bón. Tương tự,

hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng trong hỗn hợp với chất cải thiện đặc tính cây trồng, ví dụ sự sinh trưởng, năng suất và chất lượng của nguyên liệu thu hoạch được.

Theo một phương án cụ thể của sáng chế, hợp chất có công thức (I) ở dạng chế phẩm hoặc dạng sử dụng được bào chế thu được từ chế phẩm này trong hỗn hợp với hợp chất khác, tốt hơn là hợp chất được mô tả dưới đây.

Nếu một trong các hợp chất nêu dưới đây có thể tồn tại ở nhiều dạng đồng phân hõ biến khác nhau, các dạng này cũng được bao gồm ngay cả khi không được nêu cụ thể trong mỗi trường hợp.

Thuốc diệt côn trùng/thuốc diệt ve bét/thuốc diệt giun tròn

Thành phần hoạt tính được nêu ở đây có "tên thông thường" đã được biết đến và được nêu Ví dụ trong tài liệu The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012, hoặc có thể được tìm kiếm thấy trên Internet (Ví dụ <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ carbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimetacarb, XMC và xylylcarb; hoặc organophosphat, ví dụ axephat, azametiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimetoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, etion, etoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazat, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, metamidophos, metidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, ometoat, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon và vamidothion.

(2) Chất đối kháng kênh clorua cổng GABA, ví dụ xylodien-organoclos, ví dụ chlordan và endosulfan hoặc phenylpyrazol (fiprol), ví dụ etiprol và fipronil.

(3) Chất điều biến kênh natri/chất phong bế kênh natri cổng điện thế, ví dụ pyretroid, ví dụ acrinathrin, alletrin, d-cis-trans alletrin, d-trans alletrin, bifenthrin, bioalletrin, chất đồng phân bioalletrin s-xyclopentenyl, bioresmetrin, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, xypermetrin, alpha-xypermetrin, beta-xypermetrin, theta-xypermetrin, zeta-xypermetrin, chất đồng phân xyphenothrin [(1R)-trans], deltametrin, chất đồng phân empenthrin [(EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinat, flumetrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadetrin, permethrin, chất đồng phân phenothrin [(1R)-trans], pralletrin, pyretrins (pyretrum), resmetrin, silafluofen, tefluthrin, tetrametrin, chất đồng phân tetrametrin [(1R)], tralometrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxychlor.

(4) Chất chủ vận thụ thể axetylcholin sản sinh nicotin (nAChR), ví dụ neonicotinoid, ví dụ axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiametoxam hoặc nicotin hoặc sulfoxaflor.

(5) Chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể axetylcholin sản sinh nicotin (nAChR), ví dụ spinosyns, ví dụ spinetoram và spinosad.

(6) Chất hoạt hóa kênh clorua, ví dụ, avermectins/milbemycins, ví dụ abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Chất bắt chước hormon tuổi vị thành niên, ví dụ, chất tương tự hormon tuổi vị thành niên Ví dụ hydropren, kinopren và metopren hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Thành phần hoạt tính có cơ chế hoạt động chưa được biết đến hoặc không đặc hiệu, ví dụ alkyl halogenua, ví dụ methyl bromua và alkyl halogenua khác; hoặc cloropicrin hoặc sulphuryl clorua hoặc chất gây nôn borax hoặc tartar.

(9) Chất làm ngừng ăn chọn lọc, ví dụ pymetrozin hoặc flonicamid.

(10) Chất ức chế sự sinh trưởng ve bét, ví dụ clofentezin, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.

(11) Vi sinh vật gây phá hỏng màng ruột côn trùng, ví dụ *Bacillus thuringiensis* phân loài *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *tenebrionis*, và protein BT cây trồng: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Chất ức chế quá trình phosphoryl hóa oxy hóa, chất gây phá vỡ ATP, ví dụ diafenthiuron hoặc hợp chất organotin, ví dụ azoxyclofen, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargit hoặc tetradifon.

(13) Chất phá vỡ sự bắt cặp trong quá trình phosphoryl hóa oxy hóa mà phá vỡ gradien proton H, ví dụ chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.

(14) Chất đối kháng thụ thể axetylcholin sản sinh nicotin, ví dụ bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.

(15) Chất ức chế sinh tổng hợp chitin, kiểu 0, ví dụ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclofenuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.

(16) Chất ức chế sinh tổng hợp Chitin, kiểu 1, ví dụ buprofezin.

(17) Chất ức chế thay da (đặc biệt là đối với Diptera, nghĩa là dipteran), ví dụ cyromazin.

(18) Chất chủ vận thụ thể ecdyson, ví dụ chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit và tebufenozit.

(19) Chất chủ vận sản sinh Octopam, ví dụ amitraz.

(20) Chất ức chế chuyển vận điện tử phức III, ví dụ hydrametylnon hoặc acequinocyl hoặc fluacrypyrim.

(21) Chất ức chế chuyển vận điện tử phức -I, ví dụ thuốc diệt ve bét METI, ví dụ fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenon (Derris).

(22) Chất phong bế kênh natri cổng điện thế, ví dụ indoxacarb hoặc metaflumizon.

(23) Chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza, ví dụ hợp chất dẫn xuất axit tetronic và tetramic, ví dụ spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Chất ức chế chuyển vận điện tử phức IV, ví dụ phosphin, ví dụ nhôm phosphit, canxi phosphit, phosphin và kẽm phosphit hoặc xyanit.

(25) Chất ức chế chuyển vận điện tử phức-II, ví dụ xyenopyrafen và cyflumetofen.

(28) Chất cảm ứng thụ thể ryanodin, ví dụ diamits, ví dụ chlorantraniliprol, cyantraniliprol và flubendiamit,

các thành phần hoạt tính khác, ví dụ afidopyropen, azadirachtin, benclonthiaz, benzoximat, bifenazat, bromopropylat, chinometionat, cryolit, dicofol, diflovidazin, fluensulfon, flometoquin, flufenimer, flufenoxystrobin, flufiprol, fluopyram, flupyradifuron, fufenozit, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodion, meperfluthrin, paichongding, pyflubumit, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, tetrametylfluthrin và iodometan; và cả các hợp chất sau: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-xyclopropyletyl)carbamoyle]phenyl}-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã được biết đến trong WO2005/077934) và 1-{2-floro-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloroetyl)sulphinyl]phenyl}-3-(triflorometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã được biết đến trong WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-florospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-cloropyridin-4-yl)metanon (đã được biết đến trong WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflorometyl)phenyl]isonicotinamit (đã được biết đến trong WO2006/003494), 3-(2,5-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-on (đã được biết đến trong WO2009/049851), 3-(2,5-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-yl-etylcarbonat (đã được biết đến trong WO2009/049851), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl-piperidin-1-yl)-5-floropyrimidin (đã được biết đến trong WO2004/099160), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3-clorophenyl)pyrimidin (đã được biết đến trong WO2003/076415), PF1364 (CAS Reg. No. 1204776-60-2), 4-[5-(3,5-diclorophenyl)-5-(triflorometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifloroetyl)amino]etyl}benzamid (đã được biết đến trong WO2005/085216), 4-

{5-[3-cloro-5-(triflorometyl)phenyl]-5-(triflorometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifloroetyl)amino]etyl}-1-naphthamit (đã được biết đến trong WO2009/002809), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl}amino)-5-cloro-3-metylbenzoyl]-2-metylhydrazinecarboxylate (đã được biết đến trong WO2005/085216), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl}amino)-5-xyano-3-metylbenzoyl]-2-etylhydrazinecarboxylate (đã được biết đến trong WO2005/085216), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl}amino)-5-xyano-3-metylbenzoyl]-2-metylhydrazinecarboxylat (đã được biết đến trong WO2005/085216), metyl 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl}amino)benzoyl]-2-etylhydrazinecarboxylat (đã được biết đến trong WO2005/085216), 1-(3-cloropyridin-2-yl)-N-[4-xyano-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)phenyl]-3-{[5-(triflorometyl)-2H-tetrazol-2-yl]metyl}-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã được biết đến trong WO2010/069502), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-cloro-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-cloropyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã được biết đến trong CN102057925), 3-cloro-N-(2-xyanopropan-2-yl)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafloropropan-2-yl)-2-metylphenyl]phthalamit (đã được biết đến trong WO2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxypheyl)sulphonyl]-6-(triflorometyl)imidazo[1,2-a]pyridin-2-carboxamit (đã được biết đến trong WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorophenyl)-5-(triflorometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxidothietan-3-yl)benzamit (đã được biết đến trong WO2009/080250), 4-[5-(3,5-diclorophenyl)-5-(triflorometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxidothietan-3-yl)benzamit (đã được biết đến trong WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-thiazol-5-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olate (đã được biết đến trong WO2009/099929), 1-[(6-cloropyridin-3-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olate (đã được biết đến trong WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropyridin-3-yl)metyl]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahydro-1H-5,8-epoxyimidazo[1,2-a]azepin (đã được biết đến trong WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropyridin-3-yl)metyl]-N'-nitro-2-pentylitnehydrazinecarboximidamit (đã được biết đến trong WO2010/060231), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-yl)oxy]phenoxy}propoxy)-2-metoxi-6-(triflorometyl)pyrimidin (đã được biết đến trong

CN101337940), N-[2-(tert-butylcarbamoyl)-4-cloro-6-metylphenyl]-1-(3-cloropyridin-2-yl)-3-(florometoxy)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã được biết đến trong WO2008/134969).

Chất diệt nấm

Thành phần hoạt tính được nêu ở đây theo tên thông thường của chúng đã được biết đến và được nêu, ví dụ, trong " Pesticide Manual " hoặc trên Internet (Ví dụ : <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Chất ức chế sinh tổng hợp Ergosterol, ví dụ (1.1) aldimorph, (1.2) azaconazol, (1.3) bitertanol, (1.4) bromuconazol, (1.5) cyproconazol, (1.6) diclobutrazol, (1.7) difenoconazol, (1.8) diniconazol, (1.9) diniconazol-M, (1.10) dodemorph, (1.11) dodemorph axetat, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamid, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorph, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalil, (1.27) imazalil sulphat, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) mvân vânonazol, (1.31) myclobutanil, (1.32) naftifin, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoat, (1.37) penconazol, (1.38) piperalin, (1.39) prochloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) prothioconazol, (1.42) pyributicarb, (1.43) pyrifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) spiroxamin, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafin, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tritmorph, (1.53) triflumizol, (1.54) triforin, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-P, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)xycloheptanol, (1.61) metyl 1-(2,2-dimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat, (1.62) N'-{5-(diflorometyl)-2-metyl-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.63) N-etyl-N-metyl-N'-{2-metyl-5-(triflorometyl)-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}imidoformamit và (1.64) O-[1-(4-metoxypheoxy)-3,3-dimetylbutan-2-yl]-1H-imidazol-1-carbothioat, (1.65) pyrisoxazol.

(2) Chất ức chế hô hấp (chất ức chế chuỗi hô hấp), ví dụ (2.1) bixafen, (2.2) boscalid, (2.3) carboxin, (2.4) diflumetorim, (2,5) fenfuram, (2.6) fluopyram, (2.7) flutolanil, (2.8)

fluxapyroxad, (2.9) furametpyr, (2.10) furmexyclox, (2.11) hỗn hợp syn-epime raxemat 1RS,4SR,9RS isopyrazam và không epime raxemat 1RS,4SR,9SR, (2.12) isopyrazam (không epime raxemat), (2.13) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh không epime 1R,4S,9S), (2.14) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh không epime 1S,4R,9R), (2.15) isopyrazam (syn-epime raxemat 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh syn-epime 1R,4S,9R), (2.17) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh syn-epime 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxycarboxin, (2.20) penflufen, (2.21) penthiopyrad, (2.22) sedaxan, (2.23) thifluzamit, (2.24) 1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloroetoxy)phenyl]-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.25) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloroetoxy)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.26) 3-(diflorometyl)-N-[4-floro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafloropropoxy)phenyl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.27) N-[1-(2,4-diclorophenyl)-1-metoxypentan-2-yl]-3-(diflorometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.28) 5,8-difloro-N-[2-(2-floro-4-{[4-(triflorometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazoline-4-amin, (2.29) benzovindiflupyr, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometylene)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflorometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit và (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflorometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.32) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.33) 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.34) 1-metyl-3-(triflorometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.35) 1-metyl-3-(triflorometyl)-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.36) 1-metyl-3-(triflorometyl)-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.37) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.38) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.39) 1,3,5-trimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.40) 1,3,5-trimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.41) benodanil, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-carboxamit, (2.43) isofetamid

(3) Chất ức chế hô hấp (chất ức chế chuỗi hô hấp) mà tác dụng trên chuỗi hô hấp phức III, ví dụ (3.1) ametoctradin, (3.2) amisulbrom, (3.3) azoxystrobin, (3.4) cyazofamid, (3.5) coumetoxystrobin, (3.6) coumoxystrobin, (3.5) dimoxystrobin, (3.8) enestroburin, (3.9) famoxadon, (3.10) fenamidon, (3.11) flufenoxystrobin, (3.12) fluoxastrobin, (3.13) kresoxim-metyl, (3.14) metominostrobin, (3.15) orysastrobin, (3.16) picoxystrobin, (3.17) pyraclostrobin, (3.18) pyrametostrobin, (3.19) pyraoxystrobin, (3.20) pyribencarb, (3.21) triclopyricarb, (3.22) trifloxystrobin, (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-cloro-2-metylphenoxy)-5-floropyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.24) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-(2-{[(1E)-1-[3-(triflorometyl)phenyl]etyliden}amino]oxy}metyl}phenyl)etanamit, (3.25) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-{2-[(E)-({1-[3-(triflorometyl)phenyl]etoxy}imino)metyl]phenyl}etanamit, (3.26) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-floro-2-phenyletenyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.27) (2E)-2-{2-[(2E,3E)-4-(2,6-diclorophenyl)but-3-en-2-ylitne]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-carboxamit, (3.29) 5-metoxi-2-metyl-4-(2-{[(1E)-1-[3-(triflorometyl)phenyl]etyliden}amino]oxy}metyl}phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, (3.30) metyl (2E)-2-{2-[(cyclopropyl[(4-metoxiphenyl)imino]metyl}sulphanyl)metyl]phenyl}-3-metoxiprop-2-enoat, (3.31) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-(formylamino)-2-hydroxybenzamit, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit

(4) Chất ức chế phân bào và phân chia tế bào, ví dụ (4.1) benomyl, (4.2) carbendazim, (4.3) chlorfenazol, (4.4) dietofencarb, (4.5) etaboxam, (4.6) fluopicolid, (4.7) fuberidazol, (4.8) pencycuron, (4.9) thiabendazol, (4.10) thiophanate-metyl, (4.11) thiophanat, (4.12) zoxamit, (4.13) 5-cloro-7-(4-metylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin và (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflorophenyl)pyridazine.

(5) Hợp chất có nhiều hoạt tính, ví dụ (5.1) hỗn hợp Bordeaux, (5.2) captafol, (5.3) captan, (5.4) clorothalonil, (5.5) chế phẩm đồng như đồng hydroxit, (5.6) đồng

naphthenat, (5.7) đồng oxit, (5.8) đồng oxyclorea, (5.9) đồng sulphat, (5.10) dichlofluanid, (5.11) dithianon, (5.12) dodin, (5.13) dodin bazơ tự do, (5.14) ferbam, (5.15) fluorfolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatin, (5.18) guazatin axetat, (5.19) iminoctadin, (5.20) iminoctadin albesilat, (5.21) iminoctadin triaxetat, (5.22) mandồng, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) kẽm metiram, (5.27) đồng-oxin, (5.28) propamidin, (5.29) propineb, (5.30) lưu huỳnh và chế phẩm chứa lưu huỳnh, ví dụ canxi polysulphit, (5.31) thiram, (5.32) tolylfluanid, (5.33) zineb, (5.34) ziram và (5.35) anilazin.

(6) Chất gây đề kháng, ví dụ (6.1) acibenzolar-S-metyl, (6.2) isotianil, (6.3) probenazol, (6.4) tiadinil và (6.5) laminarin.

(7) axit amin và chất ức chế sinh tổng hợp protein, ví dụ (7.1) andoprim, (7.2) blasticidin-S, (7.3) cyprodinil, (7.4) kasugamycin, (7.5) kasugamycin hydroclorua hydrat, (7.6) mepanipyrim, (7.7) pyrimetamil, (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin và (7.9) oxytetracyclin và (7.10) streptomycin.

(8) Chất ức chế sản sinh ATP, ví dụ (8.1) fentin axetat, (8.2) fentin clorua, (8.3) fentin hydroxit và (8.4) silthiofam.

(9) Chất ức chế tổng hợp vách tế bào, ví dụ (9.1) benthiavalicarb, (9.2) dimetomorph, (9.3) flumorph, (9.4) iprovalicarb, (9.5) mandipropamid, (9.6) polyoxins, (9.7) polyoxorim, (9.8) validamycin A, (9.9) valifenalate và (9.10) polyoxin B.

(10) Chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.1) biphenyl, (10.2) chlorneb, (10.3) dicloran, (10.4) edifenphos, (10.5) etridiazol, (10.6) iodocarb, (10.7) iprobenfos, (10.8) isoprothiolan, (10.9) propamocarb, (10.10) propamocarb hydroclorua, (10.11) prothiocarb, (10.12) pyrazophos, (10.13) quintozone, (10.14) tecnazen và (10.15) tolclofos-metyl.

(11) Chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.1) carpropamid, (11.2) diclocymet, (11.3) fenoxanil, (11.4) fthalit, (11.5) pyroquilon, (11.6) tricyclazole và (11.7) 2,2,2-trifluoroetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamate.

(12) Chất ức chế tổng hợp axit nucleic, ví dụ (12.1) benalaxyl, (12.2) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.3) bupirimat, (12.4) clozylacon, (12.5) dimetirimol, (12.6) etirimol, (12.7) furalaxyl, (12.8) hymexazol, (12.9) metalaxyl, (12.10) kim loại axyl-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixyl, (12.13) axit oxolinic và (12.14) othilidon.

(13) Chất ức chế dẫn truyền tín hiệu, ví dụ (13.1) chlozolinat, (13.2) fenpiclonil, (13.3) fludioxonil, (13.4) iprodion, (13.5) procymidon, (13.6) quinoxifen, (13.7) vinclozolin và (13.8) proquinazid.

(14) Chất phá vỡ sự bắt cặp, ví dụ (14.1) binapacryl, (14.2) dinocap, (14.3) ferimzon, (14.4) fluazinam và (14.5) meptyldinocap.

(15) Hợp chất khác, ví dụ (15.1) benthiazol, (15.2) betoxazin, (15.3) capsimycin, (15.4) carvon, (15.5) chinometionat, (15.6) pyriofenon (chlazafenon), (15.7) cufraneb, (15.8) cyflufenamid, (15.9) cymoxanil, (15.10) cyprosulfamid, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) diclorophen, (15.14) diclomezin, (15.15) difenzoquat, (15.16) difenzoquat metylsulphat, (15.17) diphenylamin, (15.18) EcoMat, (15.19) fenpyrazamin, (15.20) flumetover, (15.21) fluorimid, (15.22) flusulfamid, (15.23) flutianil, (15.24) fosetyl-nhôm, (15.25) fosetyl-canxi, (15.26) fosetyl-natri, (15.27) hexaclorobenzen, (15.28) irumamycin, (15.29) metasulfocarb, (15.30) metyl isothiocyanat, (15.31) metrafenon, (15.32) mildiomicin, (15.33) natamycin, (15.34) nickel dimetyldithiocarbamat, (15.35) nitrothal-isopropyl, (15.36) othilidon, (15.37) oxamocarb, (15.38) oxyfenthiin, (15.39) pentaclorophenol và muối của nó, (15.40) phenothrin, (15.41) axit phosphoric và muối của nó, (15.42) propamocarb-fosetylát, (15.43) propanosin-natri, (15.44) pyrimorph, (15.45) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-cloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (15.46) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-cloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (15.47) pyrrolnitrin, (15.48) tebufloquin, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolifenit, (15.51) triazoxit, (15.52) trichlamit, (15.53) zarilamid, (15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)methoxy]-4-metoxypyridin-2-yl)cacbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-

1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-diflorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.58) 1-(4-metoxiphenoxy)-3,3-dimetylbutan-2-yl 1H-imidazol-1-carboxylat, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metylsulphonyl)pyridin, (15.60) 2,3-dibutyl-6-clorothieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-on, (15.61) 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetron, (15.62) 2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5R)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)etanon, (15.63) 2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5S)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)etanon, (15.64) 2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-{4-[4-(5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl)-1,3-thiazol-2-yl]piperidin-1-yl}etanon, (15.65) 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-on, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difloro-4-metoxiphenyl)-4-metyl-1H-imidazol-5-yl]pyridin, (15.67) 2-phenylphenol và muối, (15.68) 3-(4,4,5-trifloro-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.69) 3,4,5-tricloropyridin-2,6-dicacbon itril, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorophenyl)-4-(2,6-diflorophenyl)-6-metylpyridazin, (15.71) 4-(4-clorophenyl)-5-(2,6-diflorophenyl)-3,6-dimetylpyridazin, (15.72) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.73) 5-cloro-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen-2-sulphonohydrazit, (15.74) 5-floro-2-[(4-florobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.75) 5-floro-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.76) 5-metyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin, (15.77) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, (15.78) N'-(4-{[3-(4-clorobenzyl)-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylrimidoformamit, (15.79) N-(4-clorobenzyl)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamit, (15.80) N-[(4-clorophenyl)(xyano)metyl]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamit, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropyridin-2-yl)metyl]-2,4-dicloronicotinamit, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropyridin-2-yl)etyl]-2,4-dicloronicotinamit, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropyridin-2-yl)etyl]-2-floro-4-iodonicotinamit, (15.84) N-{(E)-[(xyclopropylmetoxy)imino][6-(diflorometoxy)-2,3-diflorophenyl]metyl}-2-phenylaxetamit, (15.85) N-{(Z)-[(xyclopropylmetoxy)imino][6-(diflorometoxy)-2,3-diflorophenyl]metyl}-2-

phenylaxetamit, (15.86) N'-{4-[(3-tert-butyl-4-cyano-1,2-thiazol-5-yl)oxy]-2-chloro-5-methylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.87) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,3-thiazol-4-carboxamit, (15.88) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-carboxamit, (15.89) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-carboxamit, (15.90) pentyl {6-[[[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamit, (15.91) phenazine-1-carboxylic axit, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) quinolin-8-ol sulphat (2:1), (15.94) tert-butyl {6-[[[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamit, (15.95) 1-metyl-3-(triflorometyl)-N-[2'-(triflorometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.96) N-(4'-clorobiphenyl-2-yl)-3-(diflorometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.97) N-(2',4'-diclorobiphenyl-2-yl)-3-(diflorometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.98) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-[4'-(triflorometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.99) N-(2',5'-diflorobiphenyl-2-yl)-1-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.100) 3-(diflorometyl)-1-metyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.101) 5-floro-1,3-dimetyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.103) 3-(diflorometyl)-N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-5-floro-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.105) 3-(diflorometyl)-N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.106) N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)-5-floro-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.107) 2-cloro-N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)nicotinamit, (15.108) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.109) 4-(diflorometyl)-2-metyl-N-[4'-(triflorometyl)biphenyl-2-yl]-1,3-thiazol-5-carboxamit, (15.110) 5-floro-N-[4'-(3-hydroxy-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.111) 2-cloro-N-[4'-(3-hydroxy-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.112) 3-(diflorometyl)-N-[4'-(3-metoxi-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-

metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.113) 5-floro-N-[4'-(3-metoxo-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxo-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.115) (5-bromo-2-metoxo-4-metylpyridin-3-yl)(2,3,4-trimetoxo-6-metylphenyl)metanon, (15.116) N-[2-(4-{[3-(4-clorophenyl)prop-2-yn-1-yl]oxy}-3-metoxo-phenyl)etyl]-N2-(metylsulphonyl)valinamit, (15.117) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic, (15.118) but-3-yn-1-yl {6-[[[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylene]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamit, (15.119) 4-amino-5-floropyrimidin-2-ol (tautomeric form: 4-amino-5-floropyrimidin-2(1H)-on), (15.120) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.121) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.122) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.123) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.124) [3-(4-cloro-2-florophenyl)-5-(2,4-diflorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.125) (S)-[3-(4-cloro-2-florophenyl)-5-(2,4-diflorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-cloro-2-florophenyl)-5-(2,4-diflorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.127) 2-{[3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.128) 1-{[3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thiocyanat, (15.129) 5-(allylsulphanyl)-1-{[3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.131) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.132) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.133) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thiocyanat, (15.134) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thiocyanat, (15.135) 5-(allylsulphanyl)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(allylsulphanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorophenyl)-2-(2,4-diflorophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-

3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-
 2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.139) 2-
 [(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-
 3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-
 2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.141) 2-
 [(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-
 3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-
 2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.143) 2-
 [(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-
 3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorophenyl)-5-hidroxi-
 2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (15.145) 2-floro-6-
 (triflorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamid, (15.146) 2-(6-
 benzilpiridin-2-il)quinazolin, (15.147) 2-[6-(3-floro-4-metoksiifenil)-5-metilpiridin-
 2-il]quinazolin, (15.148) 3-(4,4-difloro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-
 il)quinolin, axit (15.149) abscisic, (15.150) 3-(diflorometil)-N-metoksi-1-metil-N-[1-
 (2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-karboxamid, (15.151) N'-[5-bromo-6-
 (2,3-dihidro-1H-inden-2-iloksi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamid,
 (15.152) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflorofenil)etoksi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-
 metilimidoforamid, (15.153) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflorofenil)etoksi]-2-
 metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoforamid, (15.154) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-
 (3,5-diflorofenil)etoksi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoforamid,
 (15.155) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropilxikloheksil)oksi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-
 N-metilimidoforamid, (15.156) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropilxikloheksil)oksi]-2-
 metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoforamid, (15.157) N-xiklopropil-3-
 (diflorometil)-5-floro-N-(2-isopropilbenzil)-1-metil-1H-pirazol-4-karboxamid,
 (15.158) N-xiklopropil-N-(2-xiklopropilbenzil)-3-(diflorometil)-5-floro-1-metil-1H-
 pirazol-4-karboxamid, (15.159) N-(2-tert-butilbenzil)-N-xiklopropil-3-(diflorometil)-
 5-floro-1-metil-1H-pirazol-4-karboxamid, (15.160) N-(5-kloro-2-etilbenzil)-N-
 xiklopropil-3-(diflorometil)-5-floro-1-metil-1H-pirazol-4-karboxamid, (15.161) N-(5-
 kloro-2-isopropilbenzil)-N-xiklopropil-3-(diflorometil)-5-floro-1-metil-1H-pirazol-
 4-karboxamid, (15.162) N-xiklopropil-3-(diflorometil)-N-(2-etil-5-florobenzil)-5-

floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.163) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-N-(5-floro-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.164) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-florobenzyl)-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.165) N-(2-xyclopentyl-5-florobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.166) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-N-(2-floro-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.167) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.168) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.169) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.170) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.171) N-[5-cloro-2-(triflorometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.172) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflorometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.173) N-[2-cloro-6-(triflorometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.174) N-[3-cloro-2-floro-6-(triflorometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.175) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-floro-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.176) N-xyclopropyl-3-(diflorometyl)-5-floro-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (15.177) 3-(diflorometyl)-N-(7-floro-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.178) 3-(diflorometyl)-N-[(3R)-7-floro-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.179) 3-(diflorometyl)-N-[(3S)-7-floro-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (15.180) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.181) N'-{4-[(4,5-dicloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.182) N-(4-cloro-2,6-diflorophenyl)-4-(2-cloro-4-florophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin. Tất cả các thành phần phối trộn được nêu trong các nhóm từ (1) đến (15), như trường hợp có thể, có thể tạo ra muối với bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng thực hiện việc này dựa vào các nhóm chức của chúng.

Thuốc diệt loài gây hại sinh học để làm thành phần phối trộn

Hợp chất có công thức (I) có thể được được phối hợp với thuốc diệt loài gây hại sinh học.

Thuốc diệt loài gây hại sinh học bao gồm đặc biệt là vi khuẩn, nấm, nấm men, dịch chiết và sản phẩm từ cây trồng được tạo ra từ vi sinh vật, bao gồm protein và chất chuyển hóa thứ cấp.

Thuốc diệt loài gây hại sinh học bao gồm vi khuẩn như vi khuẩn tạo nha bào, vi khuẩn tạo khuẩn lạc ở rễ và vi khuẩn mà tác dụng như thuốc diệt côn trùng, chất diệt nấm hoặc thuốc diệt giun tròn sinh học.

Ví dụ về vi khuẩn này mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm thuốc diệt loài gây hại sinh học là:

Bacillus amyloliquefaciens, giống FZB42 (DSM 231179), hoặc *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* giống CNCM I-1562 hoặc *Bacillus firmus*, giống I-1582 (Mã số truy cập CNCM I-1582) hoặc *Bacillus pumilus*, đặc biệt là giống GB34 (Mã số truy cập ATCC 700814) và giống QST2808 (Mã số truy cập NRRL B-30087), hoặc *Bacillus subtilis*, đặc biệt là giống GB03 (Mã số truy cập ATCC SD-1397), hoặc *Bacillus subtilis* giống QST713 (Mã số truy cập NRRL B-21661) hoặc *Bacillus subtilis* giống OST 30002 (Mã số truy cập NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* phân loài *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), giống AM65-52 (Mã số truy cập ATCC 1276), hoặc *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là giống ABTS-1857 (SD-1372), hoặc *B. thuringiensis subsp. kurstaki* giống HD-1, hoặc *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* giống NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (giun tròn *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (Mã số truy cập ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* giống AQ6121 (= QRD 31,013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* giống AQ 6047 (Mã số truy cập NRRL 30232).

Ví dụ về nấm và nấm men mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm thuốc diệt loài gây hại sinh học là:

Beauveria bassiana, đặc biệt là giống ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, đặc biệt là giống CON/M/91-8 (Mã số truy cập DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, đặc biệt là giống HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (formerly đã được biết đến là *Verticillium lecanii*), đặc biệt là giống KV01, *Metarhizium anisopliae*, đặc biệt là giống F52 (DSM3884/ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, đặc biệt là giống NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (bây giờ là: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là giống IFPC 200613, hoặc giống Apopka 97 (Accession No. ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* giống 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, đặc biệt là giống V117b, *Trichoderma atroviride*, đặc biệt là giống SC1 (Mã số truy cập CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum rifai T39* (Mã số truy cập CNCM I-952).

Ví dụ về virus mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm thuốc diệt loài gây hại sinh học là:

Virus hạt (GV) *Adoxophyes orana* (bướm đêm của cây quả đỏ), virus hạt (GV) *Cydia pomonella* (sâu bướm), virus đa diện nhân (NPV) *Helicoverpa armigera* (sâu đục bông), mNPV của *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng), mNPV của *Spodoptera frugiperda* (sâu ăn lá ký sinh), NPV của *Spodoptera littoralis* (Sâu ăn lá bông châu Phi).

Cũng được bao gồm là vi khuẩn và nấm mà được bổ sung vào làm thể cấy cho cây trồng hoặc các phần của cây trồng hoặc phần của cây và, do đặc tính cụ thể của chúng, làm tăng sự sinh trưởng của cây trồng và sức khỏe cây trồng. Các Ví dụ bao gồm:

Agrobacterium spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, đặc biệt là *Burkholderia cepacia* (trước đây đã được biết đến là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Ví dụ về dịch chiết và sản phẩm từ cây trồng được tạo ra từ vi sinh vật, bao gồm protein và chất chuyển hóa thứ cấp, mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm thuốc diệt loài gây hại sinh học là:

Allium sativum, Artemisia absinthium, azadirachtin, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus, Chenopodium anthelminticum, chitin, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (dịch chiết saponin của Chenopodium quinoa), pyretrum/pyretrins, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, “Requiem™ Insecticide”, rotenon, ryania/ryanodin, Symphytum officinale, Tanaxetum vulgare, thymol, Triact 70, TriCon, Tropaeolum majus, Urtica dioica, Veratrin, Viscum album, dịch chiết Brassicaceae, đặc biệt là bột bã hạt nho hoặc bột mù tạc.

Chất an toàn làm thành phần phối trộn

Hợp chất có công thức (I) có thể được được phối hợp với chất an toàn, ví dụ benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamid, dichlormid, fenchlorazole (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), naphthalic anhydrit, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoyl)amino]phenyl}sulphonyl)benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decane (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloroaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Cây trồng và các phần của cây trồng

Tất cả các cây trồng và các phần của cây trồng có thể được được xử lý theo sáng chế. Cây trồng được hiểu là tất cả cây trồng và quần thể cây trồng, như cây đại hoặc cây trồng mong muốn và không mong muốn (bao gồm cây trồng có trong tự nhiên), ví dụ ngũ cốc (lúa mì, lúa gạo, lúa miến, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loại rau khác, cây bông, thuốc lá, nho hạt dầu, và cả cây lấy quả (gồm táo, lê, cam quýt và nho làm rượu). Cây trồng có thể là cây trồng có thể được thu được nhờ biện pháp nhân giống thông thường và phương pháp tối ưu hóa hoặc bằng phương pháp công nghệ sinh học và xử lý di truyền hoặc tổ hợp các phương pháp này, bao gồm cây chuyển gen và bao gồm cây canh tác mà có thể được bảo hộ hoặc không thể được bảo hộ theo quyền của người nhân giống cây trồng. Các phần của cây trồng cần được hiểu là tất cả các phần và cơ quan của cây trồng bên trên và bên dưới mặt đất, như chồi rễ, lá, hoa và rễ, các Ví dụ được nêu là lá, lá kim, thân cây, cuống lá, hoa, thể quả, quả và hạt, và cả thân củ, rễ và thân rễ. Các phần của cây trồng còn bao

gồm nguyên liệu thu hoạch được và chất liệu nhân giống sinh dưỡng và sinh sản, ví dụ đoạn cắt, thân củ, thân rễ, mầm cây và hạt.

Theo sáng chế, việc xử lý cây trồng và các phần của cây trồng bằng hợp chất có công thức (I) được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách để cho hợp chất tác dụng đến không gian xung quanh, môi trường hoặc không gian bảo quản bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhúng, phun, làm bay hơi, phun sương mù, phát tán, quét lên, bơm và, trong trường hợp của chất liệu nhân giống, cụ thể là trong trường hợp của hạt, còn bao gồm việc phủ lên một hoặc nhiều lớp bao.

Như đã nêu trên, cũng có thể xử lý toàn bộ cây trồng và các phần của chúng theo sáng chế. Theo phương án được ưu tiên, các loài cây đại và cây canh tác, hoặc cây được thu được nhờ cách nhân giống sinh học thông thường, như lai chéo hoặc dung hợp tế bào trần, và các phần của chúng, được xử lý. Theo phương án được ưu tiên khác, cây chuyển gen và cây canh tác được thu được nhờ phương pháp xử lý di truyền, nếu thích hợp, phối hợp với phương pháp thông thường (sinh vật cải biến di truyền), và các phần của chúng được xử lý. Thuật ngữ “các phần” hoặc “các phần của cây trồng” hoặc “các phần của cây” được giải thích như trên. Được đặc biệt ưu tiên theo sáng chế là xử lý cây trồng tương ứng với các cây canh tác có bán trên thị trường hoặc các cây đang sử dụng. Cây canh tác được hiểu là cây trồng có đặc tính (“đặc điểm”) mới và được thu được nhờ biện pháp nhân giống thông thường, bằng cách gây đột biến hoặc bằng kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Chúng có thể là cây canh tác, loài, kiểu sinh học hoặc kiểu gen của nó.

Xử lý cây chuyển gen, hạt giống và sự kiện tích hợp

Cây chuyển gen hoặc cây canh tác được ưu tiên (thu được nhờ xử lý di truyền) mà được xử lý theo sáng chế bao gồm toàn bộ cây trồng mà, bằng cách cải biến di truyền, sẽ nhận được vật liệu di truyền mang các đặc tính hữu dụng đặc biệt có lợi (“đặc điểm”) cho cây trồng. Ví dụ về đặc tính này là sự sinh trưởng cây trồng tốt hơn, tăng chống chịu sức với nhiệt độ thấp hoặc cao, tăng sức chống chịu với khô hạn hoặc với mức nước hoặc độ mặn trong đất cao, làm tăng tính năng ra hoa, dễ thu hoạch hơn, chín nhanh hơn, năng suất cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc sản phẩm thu hoạch có giá trị dinh dưỡng cao hơn, thời gian bảo quản và/hoặc khả năng chế biến của sản phẩm thu hoạch tốt hơn được. Ví

dụ khác và được đặc biệt nhấn mạnh về các đặc tính này là làm tăng sức chống chịu của cây trồng chống lại động vật gây hại và vi sinh vật gây hại, như côn trùng, động vật chân đốt, giun tròn, ve bét, sên và ốc sên gây ra, ví dụ, đối với độc tính hình thành trong cây trồng, cụ thể là độc tính tạo ra trong cây trồng do chất liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (Ví dụ do gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả các tổ hợp của chúng), và cũng làm tăng sức chống chịu của cây trồng chống lại nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh cho cây gây ra, ví dụ, nhờ sức chống chịu nội hấp mắc phải (SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích sức chống chịu và gen chống chịu và protein biểu hiện tương ứng và độc tính, và cũng làm tăng độ dung nạp của cây trồng với một số thành phần hoạt tính diệt cỏ, ví dụ imidazolinon, sulphonylure, glyphosat hoặc phosphinothricin (Ví dụ gen "PAT"). Các gen mà mang lại đặc tính ("đặc điểm") mong muốn đáng quan tâm có thể cũng có mặt trong tổ hợp với một gen khác trong cây chuyển gen. Ví dụ về cây chuyển gen bao gồm cây trồng quan trọng, như ngũ cốc (lúa mỳ, lúa gạo, lúa miến, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các kiểu rau khác, cây bông, thuốc lá, bã hạt nho và cả cây lấy quả (gồm táo, lê, cam quýt và nho), được đặc biệt nhấn mạnh là ngô, đậu tương, lúa mỳ, lúa gạo, khoai tây, cây bông, mía đường, thuốc lá và nho hạt dầu. Đặc tính ("đặc điểm") mà được đặc biệt nhấn mạnh là làm tăng sức chống chịu của cây trồng với côn trùng, động vật chân đốt, giun tròn và sên và ốc sên.

Bảo vệ mùa màng – kiểu xử lý

Việc xử lý cây trồng và các phần của cây trồng bằng hợp chất có công thức (I) được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách tác dụng đến không gian xung quanh, nơi sống hoặc không gian bảo quản của chúng bằng cách sử dụng phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhún, phun, phun mù, tưới, làm bay hơi, rắc bụi, phun sương mù, phát tán, tạo bột, phủ, dàn trải, tiêm, xối nước (tưới), tưới nhỏ giọt và, trong trường hợp chất liệu nhân giống, cụ thể là trong trường hợp hạt, còn là bột để xử lý hạt theo cách khô, dung dịch để xử lý hạt theo cách lỏng, bột tan trong nước để xử lý bằng huyền phù, bằng cách tạo vò, bằng cách bao với một hoặc nhiều lớp bao, vân vân. Cũng có thể áp dụng hợp chất có

công thức (I) bằng phương pháp thể tích siêu thấp hoặc tiêm dạng sử dụng hoặc chính hợp chất có công thức (I) vào đất màu.

Việc xử lý cây trồng trực tiếp được ưu tiên là sử dụng trên lá, nghĩa là hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho lá, trong đó tần suất xử lý và tỷ lệ sử dụng cần được điều chỉnh theo mức độ nhiễm động vật gây hại cần quan tâm.

Trong trường hợp hợp chất có hoạt tính nội hấp, hợp chất có công thức (I) cũng tiếp cận cây trồng qua hệ rễ. Sau đó, cây trồng được xử lý bằng tác dụng của hợp chất có công thức (I) đến nơi sống của cây trồng. Việc này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách tưới, hoặc bằng cách phối trộn vào đất màu hoặc dung dịch chất dinh dưỡng, nghĩa là vị trí của cây trồng (Ví dụ đất màu hoặc hệ thủy canh) sẽ được tắm bằng dạng lỏng chứa hợp chất có công thức (I), hoặc bằng cách sử dụng trên đất màu, nghĩa là hợp chất có công thức (I), ở dạng rắn (Ví dụ ở dạng hạt), được đưa vào vị trí của cây trồng. Trong trường hợp của vụ mùa lúa lúa gạo, việc này cũng có thể thực hiện bằng cách định lượng hợp chất có công thức (I) ở dạng sử dụng dạng rắn (Ví dụ hạt) vào đồng lúa ngập nước.

Xử lý hạt

Việc kiểm soát động vật gây hại bằng cách xử lý hạt của cây trồng đã được biết đến từ lâu và hiện là đối tượng cần liên tục cải thiện. Tuy nhiên, việc xử lý hạt đã gây ra một loạt các vấn đề mà không thể luôn luôn được giải quyết theo cách thỏa đáng. Do đó, được mong muốn là phát triển phương pháp bảo vệ hạt và cây mầm mà sẽ phân tán, hoặc ít nhất là làm giảm đáng kể, nhu cầu sử dụng thêm thuốc diệt loài gây hại trong khi bảo quản, sau khi gieo hoặc sau khi mọc cây. Còn được mong muốn là làm tối ưu lượng thành phần hoạt tính sử dụng để mang lại tác dụng bảo vệ tối ưu cho hạt và cây mầm khỏi bị động vật gây hại tấn công, nhưng không gây hại cho bản thân cây trồng nhờ thành phần hoạt tính được sử dụng. Cụ thể là, phương pháp xử lý hạt cũng cần tính đến đặc tính diệt côn trùng hoặc diệt giun tròn nội sinh của cây chuyển gen chống chịu hoặc dung nạp động vật gây hại nhằm đạt được tác dụng bảo vệ tối ưu cho hạt và cây mầm với một lượng tiêu thụ tối thiểu thuốc diệt loài gây hại.

Do đó, sáng chế cụ thể đề xuất phương pháp bảo vệ hạt và cây mầm, khỏi bị động vật gây hại tấn công, bằng cách xử lý hạt với một trong các hợp chất có công thức (I). Phương

theo sáng chế để bảo vệ hạt và cây mầm khỏi bị động vật gây hại tấn công còn bao gồm phương pháp trong đó hạt được xử lý đồng thời trong cùng một thao tác hoặc liên tiếp cùng với hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn. Phương pháp này cũng còn bao gồm phương pháp trong đó hạt được xử lý nhiều lần khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn.

Tương tự, sáng chế đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để xử lý hạt nhằm bảo vệ hạt và cây trồng khỏi động vật gây hại.

Sáng chế cũng đề xuất hạt mà đã được xử lý bằng hợp chất có công thức (I) để bảo vệ hạt chống lại động vật gây hại. Sáng chế cũng đề xuất hạt mà đã được xử lý đồng thời bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn. Sáng chế cũng đề xuất hạt đã được xử lý nhiều lần khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn. Trong trường hợp mà hạt đã được xử lý nhiều lần khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn, các chất riêng biệt có thể có mặt ở dạng nhiều lớp trên hạt. Trong trường hợp này, các lớp này chứa hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn có thể tùy ý là được phân cách nhau bằng một lớp trung gian. Sáng chế cũng đề xuất hạt trong đó hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn được sử dụng ở dạng vỏ bao hoặc một lớp khác hoặc các lớp khác phủ thêm vào vỏ bao.

Sáng chế cũng đề xuất hạt mà, sau khi xử lý bằng hợp chất có công thức (I), được bao để ngăn ngừa bụi mài mòn trên hạt.

Một lợi điểm nữa là khi một trong các hợp chất có công thức (I) có tác dụng nội hấp thì việc xử lý hạt không chỉ bảo vệ chính bản thân hạt mà còn bảo vệ cây trồng thu được từ đó sau khi mọc chống lại động vật gây hại. Theo cách này, có thể xử lý mùa màng ngay khi gieo hạt hoặc ngay sau đó.

Một lợi điểm khác là việc xử lý hạt bằng hợp chất có công thức (I) có thể làm tăng khả năng nảy mầm và mọc của hạt đã xử lý.

Tương tự, cũng được coi là lợi điểm vì hợp chất có công thức (I) có thể đặc biệt cũng được sử dụng cho hạt chuyển gen.

Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng phối hợp với chế phẩm gây dẫn truyền tín hiệu, mà tốt hơn dẫn đến tạo khuẩn lạc do thể cộng sinh, ví dụ vi khuẩn nốt rễ, nấm cộng sinh rễ và/hoặc vi khuẩn hoặc nấm sống trong mô, và/hoặc làm tối ưu việc cố định nitơ.

Hợp chất có công thức (I) là thích hợp để bảo vệ hạt của loài cây trồng bất kỳ mà được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong lĩnh vực trồng rừng hoặc trong lĩnh vực làm vườn. Cụ thể hơn là, hạt bao gồm hạt ngũ cốc (Ví dụ lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, millet và yến mạch), ngô, cây bông, đậu tương, lúa gạo, khoai tây, hoa hướng dương, cà phê, thuốc lá, cải dầu, nho hạt dầu, củ cải (Ví dụ củ cải đường và củ cải bò), lạc, các loại ra (Ví dụ cà chua, dưa chuột, các loại đậu, các loại rau cải, hành và rau diếp), cây lấy quả, cỏ và cây trang trí. Đặc biệt quan trọng là việc xử lý hạt ngũ cốc (như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen và yến mạch), ngô, đậu nành, cây bông, cải dầu, bã hạt nho và lúa gạo.

Như đã nêu trên, việc xử lý hạt chuyển gen bằng hợp chất có công thức (I) cũng đặc biệt quan trọng. Việc này liên quan đến hạt cây trồng mà thường chứa ít nhất là một gen khác loại mà kiểm soát được sự biểu hiện của polypeptit có đặc tính cụ thể là diệt côn trùng và/hoặc diệt giun tròn. Gen khác loại trong hạt chuyển gen có thể có nguồn gốc từ vi sinh vật như *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* hoặc *Gliocladium*. Sáng chế đặc biệt thích hợp để xử lý hạt chuyển gen chứa ít nhất là một gen khác loại có nguồn gốc từ *Bacillus* sp. Tốt hơn nữa, gen khác loại có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*.

Theo ngữ cảnh sáng chế, hợp chất có công thức (I) được áp dụng cho hạt. Tốt hơn là hạt được xử lý trong trạng thái trong đó đủ ổn định để không gây ra tổn hại trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý tại thời điểm bất kỳ từ khi thu hoạch đến khi gieo hạt. Thường sử dụng hạt mà được phân tách từ cây trồng và tách rời khỏi lõi, vỏ, thân cây, lớp bao, râu lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt mà đã được thu hoạch, làm sạch và làm khô đến mức ẩm cho phép bảo quản được. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà, sau khi làm khô, đã được xử lý, ví dụ, bằng nước và sau đó, làm khô lại, ví dụ thẩm hút. Trong trường hợp hạt lúa, cũng có thể sử dụng hạt mà, ví dụ, đã được làm

trương nở sơ bộ trong nước đến một giai đoạn cụ thể (gia đoạn ngực bồ câu), mà sẽ làm khả năng nảy mầm tốt hơn và mọc đồng đều hơn.

Khi xử lý hạt, cần cẩn thận với lượng hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho hạt và/hoặc lượng chất phụ trợ khác mà được chọn theo cách không gây ảnh hưởng bất lợi đến khả năng nảy mầm của hạt, hoặc không gây tổn hại cho cây trồng thu được. Điều này được đảm bảo cụ thể trong trường hợp của thành phần hoạt tính thể hiện tác dụng độc cho cây ở tỷ lệ sử dụng nhất định.

Nói chung, hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho hạt ở dạng dạng chế phẩm thích hợp. Chế phẩm và quy trình thích hợp để xử lý hạt đã được người có chuyên môn trong lĩnh vực biết đến.

Hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển hóa thành chế phẩm phủ hạt thông thường, như dung dịch, nhũ dịch, hỗn dịch, bột, bột, huyền phù đặc hoặc các chế phẩm bao phủ hạt khác, và cả chế phẩm ULV.

Các chế phẩm này được sản xuất theo cách đã được biết đến, bằng cách phối trộn hợp chất có công thức (I) với chất phụ trợ thông thường, ví dụ chất độn và dung môi hoặc chất pha loãng, thuốc nhuộm, chất làm ẩm, chất gây phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất gây dính, gibberellin thông thường và cả nước.

Thuốc nhuộm hữu dụng có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các thuốc nhuộm thông thường cho mục đích này. Có thể sử dụng chất màu, mà kém tan trong nước, hoặc thuốc nhuộm, mà tan trong nước. Các ví dụ bao gồm thuốc nhuộm đã được biết đến với tên Rhodamine B, C.I. Pigment Red 112 và C.I. Solvent Red 1.

Chất làm ẩm hữu dụng có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các chất làm tăng độ ẩm và thông thường đối với chế phẩm chứa thành phần có hoạt tính nông hóa. Được ưu tiên là sử dụng alkyl naphthalensulphonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphthalensulphonat.

Chất gây phân tán và/hoặc chất nhũ hóa thích hợp mà có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là chất gây phân tán không ion, anion và cation thông thường đối với chế phẩm chứa hợp chất có hoạt tính hóa nông. Được ưu tiên là sử dụng chất gây phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp gồm chất gây phân tán không ion hoặc anion. Chất gây phân tán không ion thích hợp bao gồm cụ thể là polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristryrylphenol polyglycol ete, và hợp chất dẫn xuất phosphat hoặc sulphat hóa của nó. Chất gây phân tán anion thích hợp cụ thể là lignosulphonat, muối của axit polyacrylic và thể ngưng tụ arylsulphonat/formaldehyt.

Chất chống tạo bọt có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các chất ức chế tạo bọt thông thường được sử dụng cho chế phẩm chứa thành phần có hoạt tính nông hóa. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được sử dụng ưu tiên.

Chất bảo quản có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các chất có thể sử dụng được trong các chế phẩm nông hóa cho mục đích này. Các Ví dụ bao gồm diclorophen và rượu benzylic hemiformal.

Chất làm đặc thứ cấp có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các chất có thể được sử dụng trong các chế phẩm nông hóa cho mục đích này. Các Ví dụ được ưu tiên bao gồm hợp chất dẫn xuất xenluloza, hợp chất dẫn xuất axit acrylic, xanthan, đất sét cải biến và silic oxit nghiền mịn.

Chất gây dính hữu dụng có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế là tất cả các chất gây kết dính thông thường có thể sử dụng được trong sản phẩm phủ hạt. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza.

Gibberellin có thể có mặt trong chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế tốt hơn là gibberellin A1, A3 (= axit gibberellic), A4 và A7; được đặc biệt ưu tiên là sử dụng axit gibberellic. Gibberellin đã được biết đến (cũng xem R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412).

Chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế có thể được sử dụng để xử lý nhiều loại hạt, trực tiếp hoặc trước, sau khi pha loãng với nước. Ví dụ, dạng đặc hoặc dạng bào chế có thể thu được của chế phẩm bằng cách pha loãng với nước có thể được sử dụng để phủ lên hạt ngũ cốc, như lúa mỳ, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, và lúa miến, và cũng hạt ngô, lúa gạo, nho hạt dầu, đậu, các loại đậu, cây bông, hoa hướng dương, đậu tương và củ cải, hoặc cả nhiều loại hạt rau khác nhau. Chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế, hoặc dạng sử dụng pha loãng của nó, cũng có thể được sử dụng để phủ hạt của cây chuyển gen.

Để xử lý hạt bằng chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế, hoặc dạng sử dụng được bào chế của chế phẩm, tất cả các đơn vị phối trộn có thể thường sử dụng được để phủ hạt là hữu dụng. Đặc biệt là, quy trình phủ hạt là đặt hạt vào thiết bị trộn theo mẻ hoặc liên tiếp, bổ sung chế phẩm phủ hạt với lượng được đặc biệt mong muốn, trước hoặc sau khi pha loãng với nước, và trộn đến khi chế phẩm được phân bố đồng đều trên hạt. Nếu thích hợp, tiếp theo là công đoạn làm khô.

Tỷ lệ sử dụng của chế phẩm phủ hạt có thể được sử dụng theo sáng chế có thể thay đổi trong khoảng rộng. Việc này được hướng dẫn theo hàm lượng cụ thể của hợp chất có công thức (I) trong chế phẩm và theo hạt. Tỷ lệ sử dụng của hợp chất có công thức (I) thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 50 g trên mỗi kiligam hạt, tốt hơn là từ 0,01 đến 15 g trên mỗi kiligam hạt.

Sức khỏe động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, nghĩa là lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) có hoạt tính chống lại ký sinh trùng trên động vật, cụ thể là vật ngoại ký sinh hoặc vật nội ký sinh. Thuật ngữ "vật nội ký sinh" bao gồm đặc biệt là giun sán và động vật nguyên sinh, như trùng cầu. Vật ngoại ký sinh thông thường và tốt hơn là động vật chân khớp, đặc biệt là côn trùng và ve bét.

Trong lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) có độc tính với động vật máu nóng chấp nhận được là thích hợp để phòng trừ ký sinh trùng mà xuất hiện khi phối giống động vật và chăn nuôi động vật đối với gia súc, động vật phối giống, động vật ở vườn thú,

động vật thí nghiệm, động vật thử nghiệm và vật nuôi trong nhà. Các hợp chất này có hoạt tính chống lại tất cả hoặc các giai đoạn phát triển đặc hiệu của ký sinh trùng.

Gia súc trong lĩnh vực nông nghiệp bao gồm, ví dụ, động vật có vú như cừu, dê, ngựa, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, tuần lộc, con đama, và cụ thể là thú nuôi và lợn; gia cầm như gà tây, vịt, ngỗng, và cụ thể là gà; cá và động vật giáp xác, ví dụ trong môi trường nước, và cả côn trùng như ong.

Vật nuôi trong nhà bao gồm, ví dụ, động vật có vú, như chuột đồng, chuột lang, chuột cống, chuột nhắt, sóc chuột, chồn, và cụ thể là chó, mèo, chim nuôi lồng, bò sát, lưỡng cư và cá cảnh.

Theo phương án được ưu tiên, hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho động vật có vú.

Theo phương án được ưu tiên khác, hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho chim, còn gọi là chim nuôi lồng và cụ thể là gia cầm.

Việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để phòng trừ ký sinh trùng trên động vật được dự định để làm giảm hoặc ngăn ngừa bệnh tật, tử vong và làm giảm năng suất (trong trường hợp thịt, sữa, len, da, trứng, mật ong và tương tự), nhờ vậy mà việc nuôi nhốt động vật có thể kinh tế và đơn giản hơn và động vật có thể thoải mái hơn.

Liên quan đến lĩnh vực sức khỏe động vật field, thuật ngữ "phòng trừ" hoặc "phòng trừ" nghĩa là hợp chất có công thức (I) có hoạt tính làm giảm tỷ lệ ký sinh trùng cụ thể ở động vật bị nhiễm ký sinh trùng này đến mức độ vô hại. Đặc biệt hơn là, "phòng trừ" theo ngữ cảnh sáng chế nghĩa là hợp chất có công thức (I) có thể diệt ký sinh trùng tương ứng, ức chế sự sinh trưởng của nó, hoặc ức chế sự tăng sinh của nó.

Động vật chân khớp bao gồm:

thuộc bộ Anoplurida, ví dụ *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; thuộc bộ Mallophagida và phân bộ Amblycerina và Ischnocerina, ví dụ *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; thuộc bộ Diptera và

phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; thuộc bộ Siphonaptera, ví dụ *Pulex* spp., *Ctenocephalogenus* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

thuộc bộ Heteroptera, ví dụ *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; và cả động vật gây hại gây khó chịu và gây mất vệ sinh thuộc bộ Blattaria.

Động vật chân khớp còn bao gồm:

từ phân lớp Acari (Acarina) và bộ Metastigmata, ví dụ từ họ Argasidae như *Argas* spp., hoặc *Nothodorus* spp., *Otobius* spp., từ họ Ixodidae như *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (loài ban đầu của con tích đũa vật chủ); thuộc bộ Mesostigmata như *Dermanyssus* spp., hoặc *Nithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; thuộc bộ Actinotrichida (Prostigmata), ví dụ *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., hoặc *Nithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; và thuộc bộ Acaridida (Astigmata), ví dụ *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Động vật nguyên sinh ký sinh bao gồm:

Mastigophora (Flagellata), ví dụ *Trypanosomatidae*, ví dụ, *Trypanosoma* b. *brucei*, T.b. *gambiense*, T.b. *rhodesiense*, T. *congolense*, T. *cruzi*, T. *evansi*, T. *equinum*, T. *lewisi*, T. *percae*, T. *simiae*, T. *vivax*, *Leishmania* *brasiliensis*, L. *donovani*, L. *tropica*, ví dụ *Trichomonadidae*, ví dụ, *Giardia lamblia*, G. *canis*;

Sarcomastigophora (Rhizopoda) như Entamoebidae, ví dụ, *Entamoeba histolytica*, Hartmanellidae, ví dụ, *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;

Apicomplexa (Sporozoa) như Eimeridae, ví dụ, *Eimeria acervulina*, *E. adenitis*, *E. alabamensis*, *E. anatis*, *E. anserina*, *E. arloingi*, *E. ashata*, *E. auburnensis*, *E. bovis*, *E. brunetti*, *E. canis*, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandallii*, *E. deblickei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoidalis*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. inthử nghiệminalis*, *E. iroquoiana*, *E. irresidua*, *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagrimitis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E. stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystispora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, cụ thể là *C. parvum*; như Toxoplasmatidae, ví dụ, *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; như Sarcocystidae, ví dụ, *Sarcocystis bovicanis*, *S. bovis*, *S. ovicanis*, *S. ovifelis*, *S. neurona*, *S. spec.*, *S. suis*, như Lrucozoidae, ví dụ, *Lrucozytozoon simondi*, như Plasmodiidae, ví dụ, *Plasmodium berghei*, *P. falciparum*, *P. malariae*, *P. ovale*, *P. vivax*, *P. spec.*, như Piroplasmae, ví dụ, *Babesia argentina*, *B. bovis*, *B. canis*, *B. spec.*, *Theilria parva*, *Theilria spec.*, như Adeleina, ví dụ, *Hepatozoon canis*, *H. spec.*

Động vật nội ký sinh gây bệnh, mà là giun sán, bao gồm Platyhelmintha (Ví dụ Monogenea, cestodes và trematodes), giun tròn, Acanthocephala, và Pentastoma. Chúng bao gồm:

Monogenea: Ví dụ : *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.

Cestodes: thuộc bộ Pseudophyllida, ví dụ : *Diphyllbothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diphlogonoporus* spp.;

thuộc bộ Xyclophyllida, ví dụ : *Mesocetoits* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina* spp., *Stilsia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andyra* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Echinolepis*

spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;

Trematodes: thuộc lớp Digenea, ví dụ : Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., hoặc nithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fasciolits spp., Fasciolopsis spp., Xyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp., Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

giun tròn: Trichinellida, ví dụ : Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichomosoits spp., Trichinella spp.;

thuộc bộ Tylenchida, ví dụ : Micronema spp., Strongyloits spp.;

thuộc bộ Rhabditida, ví dụ : Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp., Gyalcephalus spp., Cylindropharynx spp., Poteriosomum spp., Xyclococercus spp., CylicoStephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Necator spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostongylus spp., Cystocaulus spp., Pneumostongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostongylus spp., Parelaphostongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Oslerus spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroits spp., Parafilaroits spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Teladorsagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nippostrongylus spp., Heligmosomoits spp., Nematodirus spp., Hyostongylus spp., Obeliscoits spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;

thuộc bộ Spirurida, ví dụ : Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspiculuris spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoids spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp., Spirocerca spp.;

Acanthocephala: thuộc bộ Oligacanthorhynchida, ví dụ: Macracanthorhynchus spp., Prosthenechis spp.; thuộc bộ Polymorphida, ví dụ : Filicollis spp.; thuộc bộ Moniliformida, ví dụ : Moniliformis spp.;

thuộc bộ Echinorhynchida, ví dụ, Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoids spp.;

Pentastoma: thuộc bộ Porocephalida, ví dụ, Linguatula spp.

Trong lĩnh vực thú y và nuôi nhốt động vật, hợp chất có công thức (I) được sử dụng bằng các phương pháp thường đã được biết đến trong lĩnh vực, như qua đường tiêu hóa, đường ngoài ruột, đường da hoặc đường mũi ở dạng bào chế thích hợp. Việc sử dụng có thể là phòng ngừa hoặc điều trị.

Do đó, một phương án của sáng chế đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm thuốc.

Khía cạnh khác đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm chất chống nội ký sinh trùng, cụ thể là làm chất diệt giun sán hoặc chất chống động vật đơn bào. Hợp chất có công thức (I) là thích hợp để sử dụng làm chất chống nội ký sinh trùng, đặc biệt là làm chất diệt giun sán hoặc chất chống động vật đơn bào, ví dụ trong lĩnh vực chăn nuôi, trong lĩnh vực nhân giống động vật, trong lĩnh vực nuôi nhốt gia súc và trong lĩnh vực vệ sinh.

Các khía cạnh khác lần lượt đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm chất chống ngoại ký sinh trùng, đặc biệt là chất diệt động vật chân khớp như chất diệt côn trùng hoặc chất diệt ve bét. Khía cạnh khác đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức

(I) làm chất chống ngoại ký sinh trùng, đặc biệt là chất diệt động vật chân khớp như chất diệt côn trùng hoặc chất diệt ve bét, ví dụ trong lĩnh vực chăn nuôi, trong lĩnh vực nhân giống động vật, trong lĩnh vực nuôi nhốt gia súc hoặc trong lĩnh vực vệ sinh.

Phòng trừ vật truyền

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để phòng trừ vật truyền. Theo ngữ cảnh sáng chế, vật truyền của động vật chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc nhện, có khả năng truyền bệnh, ví dụ, virus, giun, sinh vật đơn bào và vi khuẩn, từ nơi chứa bệnh (cây trồng, động vật, con người, v.v.) cho vật chủ. Tác nhân gây bệnh có thể được truyền theo cách cơ học (Ví dụ bệnh đau mắt hột do ruồi không đốt) cho vật chủ hoặc sau khi tiêm (Ví dụ ký sinh trùng sốt rét do muỗi) vào vật chủ.

Ví dụ về vật truyền và bệnh hoặc tác nhân gây bệnh mà chúng truyền là:

1) Muỗi

- Anopheles: sốt rét, giun chỉ;
- Culex: Viêm não Nhật Bản, giun chỉ, bệnh nhiễm virus khác, lây nhiễm giun;
- Aedes: sốt vàng, sốt xuất huyết, giun chỉ, bệnh nhiễm virus khác;
- Simuliidae: lây nhiễm giun, cụ thể là *Onchocerca volvulus*;

2) Chấy: nhiễm trùng da, dịch sốt phát ban;

3) Bọ chét: bệnh dịch hạch, dịch sốt phát ban;

4) Ruồi: bệnh buồn ngủ (bệnh do *Trypanosoma* gây ra); tả, bệnh nhiễm vi khuẩn khác;

5) Ve bét: nhiễm ve bét, dịch sốt phát ban, bệnh phát ban do rickettsia, bệnh sốt thỏ, viêm não Saint Louis, viêm não do ve truyền (TBE), sốt xuất huyết Crimean–Congo, bệnh do *Borrelia* gây ra;

6) Tích: bệnh do *Borrelia* gây ra như *Borrelia duttoni*, viêm não do ve truyền, sốt Q (*Coxiella burnetii*), nhiễm trùng do *Babesia* (*Babesia canis canis*).

Ví dụ về vật truyền theo ngữ cảnh sáng chế là côn trùng, ví dụ rệp vùng, ruồi, rầy trên lá hoặc bọ trĩ, mà có thể truyền virus từ cây trồng sang cây trồng. Các vật truyền khác có khả năng truyền virus ở cây trồng là nhện đỏ, chấy, bọ cánh cứng và giun tròn.

Ví dụ khác về vật truyền theo ngữ cảnh sáng chế là côn trùng và động vật chân đốt như muỗi, đặc biệt là chi *Aedes*, *Anopheles*, ví dụ *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (sốt rét) và *Culex*, chấy, bọ chét, ruồi, ve bét và con tích, mà có thể truyền tác nhân gây bệnh sang động vật và/hoặc con người.

Cũng có thể phòng trừ vật truyền nếu hợp chất có công thức (I) phá được sức chống chịu.

Hợp chất có công thức (I) là thích hợp để sử dụng nhằm ngăn ngừa bệnh và/hoặc tác nhân gây bệnh bị truyền bằng vật truyền. Do đó, một khía cạnh khác của sáng chế là việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để phòng trừ vật truyền, ví dụ trong nông nghiệp, trong lĩnh vực làm vườn, trong lĩnh vực trồng rừng, trong vườn cây và trong địa điểm vui chơi, và cũng để bảo quản trong lĩnh vực bảo quản nguyên liệu và sản phẩm.

Bảo quản vật liệu công nghiệp

Hợp chất có công thức (I) là thích hợp để bảo vệ vật liệu công nghiệp chống lại sự tấn công hoặc phá hủy của côn trùng, ví dụ thuộc bộ *Coleoptera*, *Hymenoptera*, *Isoptera*, *Lepidoptera*, *Psocoptera* và *Zygentoma*.

Vật liệu công nghiệp theo ngữ cảnh sáng chế được hiểu là vật liệu vô tri vô giác, như tốt hơn là nhựa, chất gây bám dính, hồ, giấy và bìa, da, gỗ, sản phẩm gỗ xử lý và chế phẩm phủ. Việc sử dụng sáng chế để bảo vệ gỗ là được đặc biệt ưu tiên.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) được sử dụng cùng với ít nhất là một chất diệt côn trùng và/hoặc ít nhất là một chất diệt nấm.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) có mặt ở dạng thuốc diệt loài gây hại dùng ngay, nghĩa là chúng có thể được dùng cho vật liệu cần quan tâm mà không cần điều chỉnh tiếp. Thuốc diệt côn trùng hoặc chất diệt nấm khác thích hợp là các chất cụ thể nêu trên.

Ngạc nhiên là, cũng đã phát hiện ra rằng hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ cho đối tượng mà sẽ tiếp xúc với nước muối hoặc nước hơi mặn, cụ thể là vỏ, màn hình, mạng lưới, tòa nhà, phao neo và hệ thống tín hiệu, chống bị hà. Có thể sử dụng hợp chất có công thức (I), một mình hoặc kết hợp với các thành phần hoạt tính khác, làm chất chống hà.

Phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh

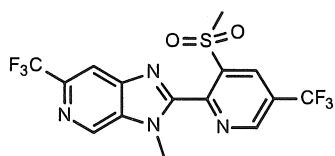
Hợp chất có công thức (I) thích hợp để phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh. Cụ thể hơn là, sáng chế có thể được sử dụng trong khu vực trong nhà, trong lĩnh vực vệ sinh và trong lĩnh vực bảo quản sản phẩm cần lưu trữ, cụ thể là để phòng trừ côn trùng, động vật chân đốt và ve bét hay gặp trong các không gian đóng kín, ví dụ nhà ở, nhà xưởng, văn phòng, cabin của phương tiện giao thông. Để phòng trừ động vật gây hại, hợp chất có công thức (I) được sử dụng một mình hoặc phối hợp với các thành phần hoạt tính khác và/hoặc các chất phụ trợ. Tốt hơn là chúng được sử dụng trong sản phẩm diệt côn trùng trong nhà. Hợp chất có công thức (I) có hiệu quả chống lại các loài nhạy cảm và đề kháng thông thường, và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển.

Các động vật gây hại này bao gồm, ví dụ, động vật gây hại từ lớp Nhện, thuộc bộ Scorpiones, Araneae và Opiliones, từ các lớp Chilopoda và Diplopoda, từ lớp Côn trùng bộ Blattodea, thuộc bộ Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria hoặc Orthoptera, Siphonaptera và Zygentoma và từ các lớp Malacostraca bộ Isopoda.

Việc sử dụng được thực hiện, ví dụ, bằng khí dung, sản phẩm phun không nén, ví dụ bơm và phun mù, hệ phun mù tự động, sương, bột, gel, sản phẩm bay hơi với viên nén bay hơi được làm bằng xenluloza hoặc nhựa, chất bay hơi lỏng, chất bay hơi gel và màng, chất bay hơi nhờ chất đẩy, hệ bay hơi không cần năng lượng, hoặc thụ động, giấy chống sâu bướm, túi chống sâu bướm và gel chống sâu bướm, ở dạng hạt hoặc bụi, ở dạng môi để rải hoặc bẫy môi.

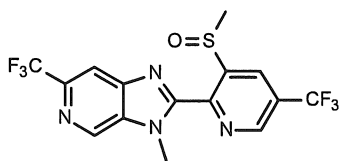
Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ điều chế:

Ví dụ điều chế 1: 3-Metyl-2-[3-(metylsulphonyl)-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-36)

41 mg (0,10 mmol) 3-metyl-2-[3-(metylsulphanyl)-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin được hòa tan trong 4 ml diclorometan, 86,5 mg (0,36 mmol) axit meta-cloroperbenzoic được bổ sung ở nhiệt độ 0°C và sau đó, hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 20 giờ. Hỗn hợp được phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 10 phút, pha loãng bằng 30 ml nước và điều chỉnh đến độ pH 9-10 bằng dung dịch natri hydroxit 45%. Hỗn hợp được chiết ba lần bằng diclorometan và sau đó, các pha hữu cơ kết hợp được loại bỏ dung môi dưới áp suất giảm.

(logP (trung hòa): 2,64; MH^+ : 425; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 3,70 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 8,35 (s, 1H), 8,83 (s, 1H), 9,32 (s, 1H), 9,58 (s, 1H).

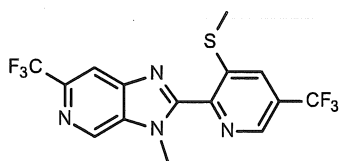
Điều chế 3-metyl-2-[3-(metylsulphanyl)-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-26)

41 mg (0,10 mmol) 3-metyl-2-[3-(metylsulphanyl)-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin được hòa tan trong 4 ml diclorometan, và 1,92 mg (0,04 mmol) axit formic và 28,44 mg dung dịch hydro peroxit 35% được bổ sung ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 5 giờ, dung dịch natri bisulphit được bổ sung và hỗn hợp được khuấy trong 3 giờ nữa. Tiếp đó, hỗn hợp

được khuấy với dung dịch natri hydrocacbonat 10%, pha hữu cơ được loại bỏ, pha nước được chiết hai lần bằng diclorometan, và các pha hữu cơ được kết hợp và sau đó, được loại bỏ dung môi dưới áp suất giảm.

(logP (trung hòa): 2,76; MH^+ : 409; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 3,15 (s, 3H), 4,35 (s, 3H), 8,37 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 9,39 (s, 1H).

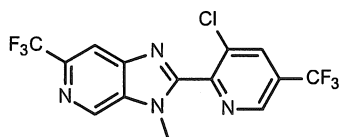
Điều chế 3-metyl-2-[3-(metylsulphanyl)-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-3)



150 mg (0,39 mmol) 2-[3-cloro-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-3-metyl-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin và 83 mg (1,18 mmol) natri metantolat được khuấy trong DMF ở nhiệt độ tòng phòng trong 6 giờ. Hỗn hợp được phối trộn với nước và được chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch natri clorua, được loại bỏ, làm khô qua natri sulphat và được loại bỏ dung môi dưới áp suất giảm.

(logP (trung hòa): 3,16; MH^+ : 393; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2,58 (s, 3H), 4,06 (s, 3H), 8,27 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 9,29 (s, 1H).

Điều chế 2-[3-cloro-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-3-metyl-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (IX-01)



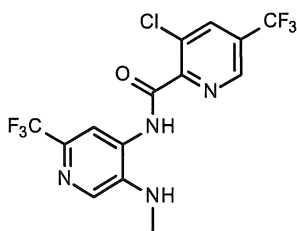
950 mg (4,97 mmol) N^3 -metyl-6-(triflorometyl)pyridin-3,4-diamin (II-01), 1,12 g axit (4,97 mmol) 3-cloro-5-(triflorometyl)pyridin-2-carboxylic và 953 mg (4,97 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) được khuấy trong 10 ml pyridin ở nhiệt độ 115°C trong 7 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi dưới áp

suất giảm, sau đó, nước được bổ sung và hỗn hợp được chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulphat, cô đặc lại và tinh chế bằng phép tinh chế trên sắc ký cột nhờ HPLC điều chế với chất rửa giải là gradient nước/axetonitril.

(logP (trung hòa): 2,96; MH^+ : 381; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 4,00 (s, 3H), 8,35 (s, 1H), 8,86 (s, 1H), 9,22 (s, 1H), 9,30 (s, 1H).

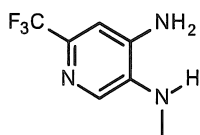
Điều chế 3-cloro-N-[5-(metylamino)-2-(triflorometyl)pyridin-4-yl]-5-(triflorometyl)pyridin-2-carboxamit (VIII-01)

Bằng phương pháp nêu trên để điều chế axit 2-[3-cloro-5-(triflorometyl)pyridin-2-yl]-3-metyl-6-(triflorometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (IX-01) from N^3 -metyl-6-(triflorometyl)pyridin-3,4-diamin (II-01) và 3-cloro-5-(triflorometyl)pyridin-2-carboxylic, có thể điều chế theo cách tương tự hợp chất 3-cloro-N-[5-(metylamino)-2-(triflorometyl)pyridin-4-yl]-5-(triflorometyl)pyridin-2-carboxamit (VIII-01) là chất trung gian cho hợp chất (IX-01).



(logP (trung hòa): 3,09; MH^+ : 399; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2,87 (d, 3H), 5,97 (q, 1H), 8,10 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 10,40 (br. S, 1H).

Điều chế N^3 -metyl-6-(triflorometyl)pyridin-3,4-diamin (II-01)

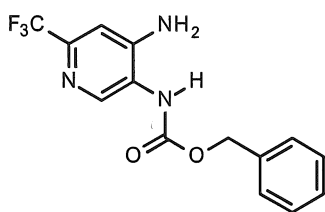


Dung dịch chứa 0,93 g (3,0 mmol) benzyl [4-amino-6-(triflorometyl)pyridin-3-yl]carbamate trong 85 ml tetrahydrofuran được làm lạnh đến nhiệt độ 0°C và được phối trộn với 0,65 g (17 mmol) lithium nhôm hydrit. Hỗn hợp được khuấy dưới khí argon ở

nhệt độ 0°C trong 15 phút và sau đó, ở nhiệt độ tổng phòng trong 4 giờ. Lượng dư lithium nhôm hydrit bị phá vỡ nhờ bổ sung etyl axetat, hỗn hợp này được lọc và dịch lọc được chiết hai lần, mỗi lần bằng 50 ml axit hydrochloric 2 N. Các dịch chiết hydrochloric axit kết hợp được điều chỉnh đến độ pH = 8 bằng natri cacbonat trong khi làm nguội. Tiếp đó, hỗn hợp được chiết hai lần mỗi lần bằng 100 ml etyl axetat, các pha hữu cơ được kết hợp và làm khô bằng natri sulphat, và dung môi được chưng cất loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm này được tinh chế tiếp bằng cách tái kết tinh ra khỏi hỗn hợp gồm hexan/isopropanol.

(MH⁺: 192; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 2,81 (d, 3H), 5,22 (q, 1H), 5,82 (br, s, 2H), 6,84 (s, 1H), 7,57 (s, 1H).

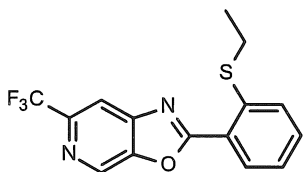
Điều chế benzyl [4-amino-6-(triflorometyl)pyridin-3-yl]carbamate



0,91 g 6-(triflorometyl)pyridin-3,4-diamin được hòa tan trong hỗn hợp gồm 20 ml tetrahydrofuran và 2 ml pyridin. Dung dịch chứa 1,07 g (6,3 mmol) benzyl clorocacbonat (benzyl cloroformate) trong 2 ml tetrahydrofuran được bổ sung nhỏ giọt trong khi vẫn khuấy. Tiếp đó, hỗn hợp phản ứng được khuấy qua đêm, pha loãng bằng 100 ml nước và được chiết hai lần mỗi lần bằng 100 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng 50 ml nước, làm khô qua natri sulphat và cô đặc. By washing cặn with 50 ml cloroform, thu được sản phẩm ở dạng chất rắn màu trắng.

(¹H NMR (500 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 5,15 (s, 2H), 6,40 (br, s 2H), 7,05 (s, 1H), 7,30-7,45 (m, 5H), 8,35 (s, 1H), 9,00 (br, s, 1H).

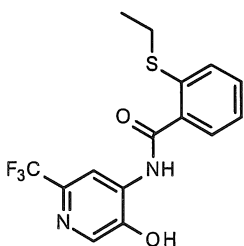
Ví dụ điều chế 2: 2-[2-(Etylsulphanyl)phenyl]-6-(triflorometyl)[1,3]oxazolo[5,4-c]pyridin (I-35)



400 mg (1,16 mmol) 2-(ethylsulphanyl)-N-[5-hydroxy-2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]benzamidit và 398 mg (1,51 mmol) triphenylphosphin được hòa tan trong 12 ml THF, và 661 mg (1,51 mmol) diethyl azodicarboxylate (DEAD) 40% trong toluen được bổ sung nhỏ giọt ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 3 giờ. Tiếp đó, dung môi được chưng cất loại bỏ dưới áp suất giảm và cặn được tinh chế bằng phép tinh chế trên sắc ký cột với chất rửa giải là gradient nước/axetonitril.

(logP (trung hòa): 4,07; MH^+ : 325; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,10 (q, 2H), 7,42 (t, 1H), 7,60-7,69 (m, 2H), 8,21 (d, 1H), 8,54 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

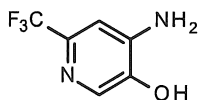
Điều chế 2-(ethylsulphanyl)-N-[5-hydroxy-2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]benzamidit (VIII-02)



206 mg (1,12 mmol) axit 2-(ethylsulphanyl)benzoic và 201 mg (1,12 mmol) 4-amino-6-(trifluoromethyl)pyridin-3-ol được hòa tan trong 5 ml pyridin, 325 mg (1,69 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (EDCI) được bổ sung và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 50°C trong 2 giờ và ở 80°C trong 3 giờ. Dung môi được chưng cất loại bỏ dưới áp suất giảm, và cặn được hòa tan trong nước và được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri clorua, được loại bỏ, làm khô qua natri sulphat và cô đặc. Cặn tinh chế bằng phép tinh chế trên sắc ký cột nhờ HPLC điều chế với chất rửa giải là gradient nước/axetonitril.

(logP (trung hòa): 1,59; MH^+ : 343; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,21 (t, 3H), 2,98 (q, 2H), 7,29-7,34 (m, 1H), 7,48-7,53 (m, 2H), 7,61 (d, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 9,99 (s, 1H), 11,31 (br. S, 1H).

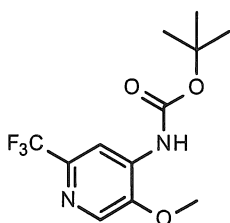
Điều chế 4-amino-6-(triflorometyl)pyridin-3-ol (II-02)



12,3 g (42,1 mmol) tert-butyl [5-metoxi-2-(triflorometyl)pyridin-4-yl]carbamate được hòa tan trong 300 ml diclorometan và làm lạnh đến $-78^\circ C$, và 42,2 g (168 mmol) boron tribromua trong 150 ml diclorometan được bổ sung nhỏ giọt ở nhiệt độ này. Hỗn hợp được để đạt đến nhiệt độ trong phòng qua đêm, sau đó, 400 ml natri hydrocacbonat dung dịch được bổ sung và hỗn hợp được chiết ba lần mỗi lần bằng 100 ml diclorometan. Dung môi được chưng cất loại bỏ và cặn tinh chế bằng sắc ký trên silica gel.

(1H NMR (90 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 7,00 (s, 1H), 7,9 (s, 1H).

Điều chế tert-butyl [5-metoxi-2-(triflorometyl)pyridin-4-yl]carbamate

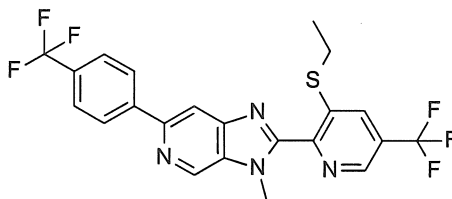


65 g sàng phân tử 4Å, 14,6 g (53,1 mmol) diphenylphosphoryl azit (DPPA) và 5,37 g (53,1 mmol) triethylamin được bổ sung, ở nhiệt độ trong phòng, vào dung dịch chứa 9,80 g (44,3 mmol) axit 5-metoxi-2-(triflorometyl)isonicotinic trong 980 ml tert-butanol. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ $81^\circ C$ trong 23 giờ và sau đó, sàng phân tử 4Å được lọc bỏ. Sau khi tert-butanol được chưng cất loại bỏ dưới áp suất giảm, cặn được phối trộn với 500 ml etyl axetat, được rửa bằng 250 ml axit hydrochloric 2 N, 250 ml dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa trong nước, 250 ml nước và 250 ml dung dịch natri clorua, và làm khô qua natri sulphat. Dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm và cặn được rửa

ba lần mỗi lần bằng 15 ml etyl axetat và làm khô dưới áp suất giảm. Pha etyl axetat được tinh chế bằng sắc ký trên silica gel (hexan/EtOAc 4:1 => 2:1).

(¹H NMR (90 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1,5 (s, 9H), 4,0 (s, 3H), 8,2 (s, 1H), 8,5 (s, 1H).

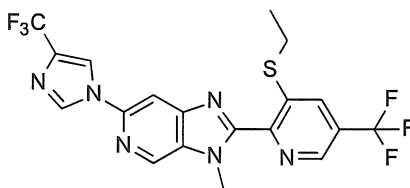
Điều chế 2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-6-[4-(triflorometyl)-phenyl]imidazo[4,5-c]pyridin (I-64)



Dung dịch chứa 62 mg (0,58 mmol) natri cacbonat trong 2 ml hỗn hợp 4:1 của 1,2-dimetoxyetan và nước được loại khí trong bể siêu âm, và 73 mg (0,19 mmol) 6-cloro-2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-6-[4-(triflorometyl)-phenyl]imidazo[4,5-c]pyridin và 67 mg axit (0,35 mmol) [4-(triflorometyl)phenyl]boronic được bổ sung. Bình phản ứng được sục ngập argon và sau đó, 23 mg (20 μmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi được bổ sung. Hỗn hợp được gia nhiệt trong lò vi sóng CEM Discover đến nhiệt độ 140°C trong 2 giờ 10 phút, sau đó, được phối trộn với thêm 68 mg (59 μmol) tetrakis(triphenylphosphine)paladi và được gia nhiệt đến 140°C trong 4 giờ nữa. Hỗn hợp phản ứng được lọc qua đệm xelit mà đã được tráng bằng etyl axetat. Sau khi dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm, cặn được phân tách bằng sắc ký nhờ MPLC trên silicagel (gradient: etyl axetat/xyclohexan). Tiếp theo, phân tách tiếp bằng sắc ký nhờ HPLC điều chế (gradient: H₂O/axetonitril). Theo cách này, thu được 14 mg (độ tinh khiết 99%, năng suất 15%) 2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-6-[4-(triflorometyl)phenyl]imidazo[4,5-c]pyridin.

(logP (trung hòa): 3,95; MH⁺: 483; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,275 (2,6); 9,271 (2,5); 8,943 (4,3); 8,584 (2,6); 8,580 (2,6); 8,318 (0,5); 7,701 (3,0); 7,680 (3,9); 7,548 (3,8); 7,527 (3,0); 7,410 (4,6); 3,890 (16,0); 3,329 (75,4); 3,140 (1,3); 3,122 (4,2); 3,104 (4,3); 3,086 (1,4); 2,676 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,507 (140,3); 2,502 (179,9); 2,498 (134,5); 2,334 (0,9); 2,329 (1,2); 2,325 (0,9); 1,281 (4,6); 1,263 (9,7); 1,245 (4,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (84,0); -0,150 (0,4).

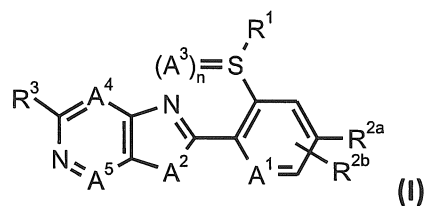
Điều chế 2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-6-[4-(triflorometyl)-imidazol-1-yl]imidazo[4,5-c]pyridin (I-74)



Trong argon, 99 mg (0,27 mmol) 6-cloro-2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-imidazo[4,5-c]pyridin, 23 μ l (0,15 mmol) *trans*-*N,N'*-dimetylxcyclohexan-1,2-diamin, 6,8 mg (36 μ mol) đồng(I) iodua, 30 mg (0,22 mmol) 4-(triflorometyl)-1H-imidazol và 64 mg (0,46 mmol) kali cacbonat được bổ sung vào 1 ml toluen khử khí. Bình phản ứng được đóng và hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt trong lò phản ứng vi sóng CEM Discover đến nhiệt độ 110°C trong 4 giờ. Sau khi để nguội đến nhiệt độ trong phòng, etyl axetat được bổ sung và hỗn hợp được lọc qua đệm xelit, tiếp đó được tráng rửa bằng etyl axetat. Dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm và cặn được phân tách bằng sắc ký nhò MPLC trên silicagel (gradient: etyl axetat/xyclohexan). Theo cách này, thu được 22 mg (độ tinh khiết 100%, năng suất 18%) 2-[3-ethylsulphanyl-5-(triflorometyl)-2-pyridyl]-3-metyl-6-[4-(triflorometyl)imidazol-1-yl]imidazo[4,5-c]pyridin.

(logP (trung hòa): 3,36; MH^+ : 473; 1H NMR (600 MHz, CD_3CN) δ ppm: 8,905 (3,0); 8,903 (3,0); 8,852 (1,6); 8,850 (1,6); 8,500 (1,9); 8,313 (1,5); 8,311 (2,1); 8,309 (1,4); 8,183 (1,7); 8,181 (1,7); 7,962 (3,4); 7,961 (3,4); 4,001 (16,0); 3,940 (0,4); 3,124 (1,1); 3,111 (3,4); 3,099 (3,5); 3,087 (1,2); 2,639 (0,7); 2,184 (55,7); 2,109 (1,2); 2,005 (2,2); 1,998 (195,7); 1,989 (2,7); 1,985 (1,8); 1,981 (10,0); 1,977 (18,2); 1,973 (26,5); 1,969 (18,0); 1,965 (9,0); 1,882 (1,2); 1,419 (0,4); 1,404 (0,7); 1,373 (0,6); 1,330 (4,1); 1,318 (9,0); 1,309 (1,6); 1,305 (5,2); 1,301 (3,4); 0,914 (0,6).

Tương tự với các ví dụ này và theo các quy trình điều chế nêu trên, có thể thu được hợp chất có công thức (I) sau:



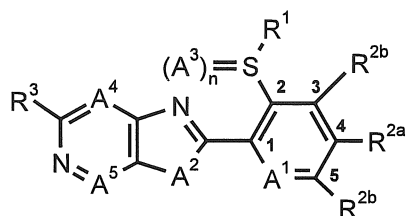
trong đó A³ là oxy và mỗi nhóm thế khác được xác định trong bảng sau:

Ví dụ	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	3	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-27	oxetan-3-yl	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H

Ví dụ	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-40	oxetan-3-yl	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	3-Cl*

Ví dụ	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	CF ₃	H
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-metyl	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H

*Trong các Ví dụ này, R^{2b} được gắn kết ở vị trí 3 hoặc 5:



Các giá trị logP được đo theo EEC Directive 79/831 Annex V.A8 nhờ HPLC (sắc ký lỏng tính năng cao) trên cột pha đảo (C 18). Nhiệt độ: 55°C.

Việc xác định LC-MS trong khoảng axit được thực hiện ở độ pH 2,7 bằng cách sử dụng dung dịch nước axit formic 0,1% và axetonitril (chứa 0,1% axit formic) làm chất rửa giải, gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. LogP (HCOOH) được nêu trong bảng.

Việc xác định LC-MS trong khoảng trung hòa được thực hiện ở độ pH 7,8 với dung dịch nước amoniac hydrocacbonat 0,001 mol và axetonitril làm chất rửa giải; gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. LogP (trung hòa) được nêu trong bảng.

Việc chuẩn độ được thực hiện với alkan-2-on không phân nhánh (có từ 3 đến 16 nguyên tử cacbon) có các giá trị logP đã được biết đến (giá trị logP được xác định trên cơ sở thời gian lưu nhờ nội suy tuyến tính giữa hai alkanon liên tiếp).

Số liệu NMR đối với các ví dụ đã chọn được nêu ở dạng thông thường (giá trị δ , phân chia đỉnh, số nguyên tử hydro) hoặc ở dạng danh mục đỉnh NMR.

Dung môi trong đó phổ NMR đã ghi được báo cáo trong mỗi trường hợp.

Phương pháp liệt kê đỉnh NMR

Số liệu ^1H NMR đối với các Ví dụ đã chọn được nêu ở dạng danh mục đỉnh ^1H NMR. Đối với mỗi nhóm đỉnh tín hiệu, đầu tiên là giá trị δ tính theo ppm và sau đó, cường độ tín hiệu trong ngoặc đơn. Các cặp giá trị δ –số cường độ tín hiệu đối với các đỉnh tín hiệu khác nhau được liệt kê cách biệt nhau bằng dấu chấm phẩy.

Do đó, danh mục đỉnh cho một Ví dụ sẽ ở dạng:

δ_1 (cường độ₁); δ_2 (cường độ₂);.....; δ_i (cường độ_i);.....; δ_n (cường độ_n)

Cường độ của các tín hiệu mạnh tương ứng với độ cao tín hiệu trong dạng in của phổ NMR tính theo cm và thể hiện các tỷ lệ thực sự của cường độ tín hiệu. Trong trường hợp của tín hiệu rộng, một số đỉnh hoặc giá trị trung bình của tín hiệu và cường độ tương đối của nó có thể được thể hiện trong mỗi so sánh với tín hiệu mạnh nhất trong phổ.

Đề chuẩn độ độ dịch chuyển hóa học của phổ ^1H NMR, sử dụng tetrametylsilan và/hoặc dung môi dịch chuyển hóa học hóa, cụ thể là trong trường hợp phổ được đo bằng DMSO. Do đó, đỉnh tetrametylsilan có thể, nhưng không cần thiết, xuất hiện trong danh mục đỉnh NMR.

Danh mục các đỉnh ^1H NMR tương tự với dữ liệu ^1H NMR in ra thông thường và do đó, thường chứa tất cả các đỉnh được nêu khi diễn giải NMR thông thường.

Ngoài ra, giống như dữ liệu ^1H NMR in thông thường, chúng có thể thể hiện tín hiệu dung môi, tín hiệu của chất đồng phân lập thể của hợp chất đích, mà cũng là một phần đối tượng của sáng chế, và/hoặc đỉnh của các chất không tinh khiết.

Khi báo cáo các tín hiệu hợp chất trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, danh mục đỉnh ^1H NMR thể hiện các đỉnh dung môi thông thường, ví dụ các đỉnh DMSO trong DMSO- D_6 và các đỉnh của nước, mà thường có cường độ trung bình cao.

Các đỉnh của chất đồng phân lập thể của hợp chất đích và/hoặc các đỉnh của chất không tinh khiết thường có cường độ trung bình thấp hơn so với các đỉnh của hợp chất đích (Ví dụ có độ tinh khiết $> 90\%$).

Chất đồng phân lập thể và/hoặc chất không tinh khiết có thể là thường có trong quy trình điều chế. Do đó, trong trường hợp này, các đỉnh của chúng có thể giúp xác định hiệu suất của quy trình điều chế về khía cạnh "dấu ấn sản phẩm phụ".

Một chuyên gia, khi tính toán các đỉnh của hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (mô phỏng MestreC, ACD, nhưng cũng kèm theo các giá trị dự tính theo lý thuyết) có thể, nếu cần, phải phân tách các đỉnh của hợp chất đích, tùy ý là sử dụng bộ lọc cường độ nhiễu. Việc phân tách này tương tự với việc chọn đỉnh thích hợp khi diễn giải ^1H NMR thông thường.

Chi tiết hơn về danh mục đỉnh ^1H NMR có thể được nêu trong cơ sở dữ liệu mô tả nghiên cứu số 564025.

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
I-1	3,77	3,86	Ví dụ 1: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,544 (6,4); 8,335 (3,9); 8,314 (4,1); 7,568 (2,9); 7,563 (3,5); 7,534 (2,5); 7,529 (1,9); 7,513 (2,3); 7,508 (1,9); 3,323 (17,6); 2,671 (0,3); 2,631 (16,0); 2,524 (1,1); 2,511 (19,3); 2,507 (38,0); 2,502 (49,6); 2,498 (35,5); 2,493 (16,9); 2,075 (0,5); 0,008 (0,9); 0,000 (21,7); -0,008 (0,7)
I-2	3,48	3,52	Ví dụ 2: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,283 (3,7); 8,960 (2,3); 8,958 (2,3); 8,334 (2,7); 8,328 (4,1); 4,030 (16,0); 3,323 (69,7); 3,181 (1,1); 3,162 (3,6); 3,144 (3,6); 3,126 (1,1); 2,891 (1,2); 2,731 (1,0); 2,676 (0,4); 2,671 (0,6); 2,667 (0,4); 2,506 (64,4); 2,502 (83,6); 2,498 (61,3); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,324 (0,4); 1,234 (4,1); 1,215 (8,1); 1,197 (3,8); 0,008 (0,6); 0,000 (17,0); -0,008 (0,7)
I-3	3,16	3,22	Ví dụ 3: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,290 (4,0); 8,947 (2,7); 8,316 (4,5); 8,267 (2,9); 7,953 (0,4); 4,059 (16,0); 4,019 (0,7); 3,327 (63,2); 3,036 (0,3); 2,965 (0,4); 2,892 (2,5); 2,882 (0,5); 2,870 (0,5); 2,732 (2,2); 2,673 (0,5); 2,580 (15,1); 2,507 (59,9); 2,503 (71,6); 2,499 (52,5); 2,330 (0,5); 2,078 (0,4); 1,234 (0,4); 0,000 (0,4)
I-4	2,65	2,70	Ví dụ 4: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,833 (0,3); 9,210 (3,9); 8,226 (4,1); 8,082 (0,6); 7,993 (0,5); 7,608 (1,3); 7,593 (1,5); 7,587 (1,6); 7,572 (1,4); 7,411 (1,3); 7,405 (1,4); 7,386 (1,4); 7,380 (1,4); 7,244 (1,0); 7,238 (0,9); 7,222 (1,6); 7,216 (1,5); 7,201 (0,8); 7,195 (0,7); 3,785 (16,0); 3,325 (80,3); 2,875 (1,0); 2,863 (1,0); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,506 (76,1); 2,502 (99,5); 2,498 (78,2); 2,464 (2,7); 2,329 (0,6); 2,075 (0,3); 0,000 (2,6)
I-5	3,26	3,30	Ví dụ 5: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,249 (3,5); 8,267 (3,7); 7,787 (1,2); 7,778 (2,7); 7,768 (2,9); 7,749 (2,1); 7,729 (0,7); 3,807 (16,0); 3,324 (21,7); 2,671 (0,4); 2,557 (15,5); 2,524 (1,1); 2,511 (22,7); 2,507 (44,4); 2,502 (57,4); 2,498 (41,7); 2,493 (20,4); 2,329 (0,4); 0,008 (2,1); 0,000 (52,3); -0,009 (2,1)
I-6	2,74	2,75	Ví dụ 6: ¹ H-NMR (601,6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9,182 (3,5); 7,526 (1,9); 7,523 (2,0); 7,459 (1,7); 7,445 (2,7); 7,403 (1,7); 7,400 (1,6); 7,390 (1,1); 7,386 (1,0); 3,927 (0,3); 3,770 (16,0); 2,978 (0,3); 2,494 (14,5); 2,222 (0,5); 2,152 (1,6); 1,966 (0,6); 1,958 (1,5); 1,954 (1,8); 1,950 (9,9); 1,946 (17,5); 1,942 (25,9); 1,938 (17,6); 1,934 (8,7); 1,387 (5,1); 1,269 (0,3); 1,212 (0,4); 0,005 (0,3); 0,000 (11,9); -0,006 (0,4)
I-7	2,67	2,72	Ví dụ 7: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,411 (2,3); 9,408 (2,3); 9,379 (3,9); 9,333 (0,4); 8,751 (2,4); 8,746 (2,5); 8,460 (4,1); 8,316 (0,5); 7,903 (0,3); 4,391 (16,0); 4,199 (1,2); 4,147 (0,5); 4,138 (0,4); 4,121 (0,8); 4,114 (0,6); 4,107 (0,7); 4,100 (0,7); 4,088 (0,7); 4,068 (0,4); 3,976 (0,7); 3,854 (0,6); 3,843 (0,6); 3,833 (0,7); 3,829 (0,7); 3,819 (0,8); 3,803 (0,5); 3,795 (0,6); 3,556 (0,6); 3,543 (0,8); 3,531 (0,5); 3,523 (0,6); 3,518 (0,8); 3,510 (0,9); 3,494 (1,8); 3,477 (0,8); 3,468 (0,8); 3,464 (0,6); 3,455 (0,5); 3,443 (0,6); 3,429 (0,4); 3,325 (63,6); 3,260 (0,8); 3,257 (0,8); 3,241 (2,2); 3,238 (2,3); 3,223 (2,3); 3,219 (2,3); 3,201 (0,9); 2,676 (0,5); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,524 (1,8); 2,511 (41,0); 2,506 (84,3); 2,502 (113,7); 2,498 (86,8); 2,493 (45,8); 2,333 (0,5); 2,329 (0,7); 2,324 (0,6); 1,252 (4,4); 1,233 (9,5); 1,214 (4,3); 0,146 (0,4); 0,008 (2,7); 0,000 (79,8); -0,008 (4,6); -0,150 (0,4)
I-8	3,46	3,54	Ví dụ 8: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,390 (2,1); 9,387 (2,1); 9,377 (3,6); 8,577 (2,1); 8,572 (2,2); 8,379 (3,7); 8,316 (0,6); 4,384 (16,0); 4,362 (0,4); 3,802 (0,3); 3,785 (0,9); 3,767 (1,3); 3,750 (0,9); 3,733 (0,4); 3,322 (86,4); 2,675 (1,0); 2,671 (1,4); 2,666 (1,0); 2,524 (3,7);

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			2,511 (79,1); 2,506 (160,9); 2,502 (213,1); 2,497 (155,9); 2,493 (76,9); 2,333 (1,0); 2,329 (1,4); 2,324 (1,0); 1,569 (6,3); 1,551 (6,2); 0,906 (6,4); 0,889 (6,3); 0,146 (1,3); 0,008 (10,0); 0,000 (280,2); -0,008 (11,2); -0,150 (1,3)
I-9	3,64	3,66	Ví dụ 9: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,544 (9,2); 8,314 (2,7); 8,311 (2,8); 8,294 (2,9); 8,291 (2,8); 7,739 (1,1); 7,735 (1,2); 7,719 (2,5); 7,715 (2,1); 7,701 (2,2); 7,697 (2,1); 7,646 (3,6); 7,627 (2,2); 7,464 (1,9); 7,462 (1,8); 7,444 (3,0); 7,426 (1,6); 7,424 (1,5); 3,322 (31,6); 3,155 (1,9); 3,136 (6,3); 3,118 (6,4); 3,100 (2,0); 2,676 (0,6); 2,671 (0,8); 2,666 (0,6); 2,541 (0,6); 2,524 (2,7); 2,511 (49,3); 2,507 (97,6); 2,502 (126,8); 2,497 (89,7); 2,493 (42,1); 2,333 (0,6); 2,329 (0,8); 2,324 (0,6); 2,075 (0,3); 1,360 (7,3); 1,341 (16,0); 1,323 (7,0); 0,146 (0,3); 0,008 (3,4); 0,000 (84,9); -0,009 (2,9); -0,150 (0,3)
I-10	2,08	2,15	Ví dụ 10: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,271 (3,7); 8,267 (3,9); 8,137 (2,9); 8,132 (3,0); 7,975 (2,1); 7,954 (3,6); 7,900 (2,2); 7,895 (2,1); 7,880 (1,3); 7,874 (1,3); 6,870 (0,3); 3,977 (15,9); 3,748 (0,9); 3,444 (0,8); 3,327 (95,2); 2,967 (16,0); 2,676 (0,3); 2,671 (0,5); 2,667 (0,3); 2,525 (1,4); 2,507 (54,5); 2,502 (70,2); 2,498 (50,6); 2,494 (24,6); 2,333 (0,3); 2,329 (0,4); 2,184 (0,5); 1,355 (3,8); 1,298 (0,9); 1,259 (1,2); 1,234 (0,6); 0,008 (2,1); 0,000 (54,1); -0,009 (2,3)
I-11	2,34	2,39	Ví dụ 11: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,279 (0,6); 9,262 (3,9); 8,380 (0,5); 8,317 (0,5); 8,260 (4,2); 8,164 (2,8); 8,159 (3,4); 8,152 (0,5); 8,115 (1,7); 8,110 (1,5); 8,095 (2,1); 8,089 (1,9); 7,937 (3,4); 7,917 (3,0); 7,902 (0,8); 7,897 (0,9); 7,885 (0,5); 7,565 (0,4); 7,545 (0,6); 5,757 (1,6); 3,770 (0,5); 3,747 (16,0); 3,621 (0,4); 3,592 (1,6); 3,445 (15,1); 3,436 (2,1); 3,327 (141,8); 2,675 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,524 (4,2); 2,506 (141,2); 2,502 (182,5); 2,498 (131,5); 2,333 (0,8); 2,329 (1,1); 2,324 (0,8); 1,298 (0,8); 1,259 (1,1); 1,235 (0,5); 1,166 (0,3); 0,008 (2,3); 0,000 (56,4); -0,008 (2,3)
I-12	1,83	1,88	Ví dụ 12: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,272 (4,2); 8,266 (4,5); 8,036 (1,3); 8,023 (1,4); 8,015 (1,6); 8,002 (1,5); 7,966 (1,4); 7,959 (1,6); 7,944 (1,5); 7,937 (1,5); 7,706 (0,8); 7,699 (0,8); 7,685 (1,5); 7,678 (1,5); 7,664 (0,8); 7,657 (0,7); 3,973 (16,0); 3,336 (80,5); 2,958 (16,0); 2,678 (0,4); 2,549 (0,3); 2,509 (67,3); 2,337 (0,4)
I-13	2,34	2,44	Ví dụ 13: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,285 (3,9); 8,280 (4,2); 8,088 (2,3); 8,066 (4,9); 8,060 (3,8); 8,009 (2,3); 8,004 (2,0); 7,988 (1,4); 7,983 (1,3); 3,973 (16,0); 3,327 (56,5); 3,313 (1,6); 3,294 (1,2); 3,279 (1,2); 3,261 (1,1); 3,242 (0,3); 2,905 (1,1); 2,886 (1,2); 2,871 (1,0); 2,853 (1,0); 2,671 (0,4); 2,507 (41,3); 2,502 (56,0); 2,498 (43,9); 2,329 (0,4); 1,150 (3,8); 1,132 (8,2); 1,113 (3,7); 0,000 (2,5)
I-14	2,63	2,67	Ví dụ 14: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,289 (3,7); 8,430 (1,3); 8,412 (5,2); 8,288 (3,9); 8,287 (3,9); 8,180 (1,6); 8,159 (1,4); 3,772 (16,0); 3,493 (14,4); 3,324 (34,4); 2,524 (0,9); 2,511 (17,9); 2,506 (36,4); 2,502 (48,8); 2,497 (36,6); 2,493 (18,8); 0,008 (1,9); 0,000 (52,6); -0,008 (2,6)
I-15	1,92	1,95	Ví dụ 15: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,295 (3,5); 9,139 (1,7); 9,135 (1,9); 9,127 (1,9); 9,123 (1,8); 8,579 (1,7); 8,575 (1,8); 8,559 (1,9); 8,555 (1,8); 8,300 (3,6); 8,298 (3,7); 8,021 (1,9); 8,009 (1,8); 8,001 (1,7); 7,989 (1,7); 3,867 (16,0); 3,794 (1,0); 3,775 (3,5); 3,757 (3,5); 3,738 (1,0); 3,327 (10,2); 2,526 (0,5); 2,521 (0,7); 2,512 (10,8); 2,508 (22,2); 2,503 (29,5); 2,499 (21,4); 2,494 (10,4); 1,209 (3,6); 1,191 (7,9); 1,172 (3,5); 0,008 (1,8); 0,000 (50,2); -0,009 (1,9)

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
I-16	3,21	3,26	Ví dụ 16: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,588 (2,0); 9,585 (2,1); 9,314 (3,5); 8,780 (2,2); 8,776 (2,2); 8,331 (3,7); 8,316 (0,4); 4,409 (0,3); 4,392 (1,0); 4,375 (1,4); 4,357 (1,0); 4,340 (0,3); 3,914 (16,0); 3,322 (36,9); 2,676 (0,6); 2,671 (0,8); 2,667 (0,6); 2,524 (2,0); 2,520 (3,2); 2,511 (42,6); 2,507 (88,2); 2,502 (118,2); 2,497 (86,9); 2,493 (42,9); 2,333 (0,5); 2,329 (0,7); 2,324 (0,6); 1,260 (13,3); 1,243 (13,2); 0,146 (0,8); 0,008 (6,7); 0,000 (191,2); -0,009 (7,6); -0,150 (0,8)
I-17	2,87	2,94	Ví dụ 17: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,204 (3,8); 8,228 (4,1); 7,627 (3,7); 7,618 (4,2); 7,536 (1,5); 7,517 (2,1); 7,433 (0,9); 7,422 (1,2); 7,413 (1,2); 7,403 (1,1); 7,392 (0,6); 3,768 (16,0); 3,327 (67,1); 2,986 (1,3); 2,968 (4,1); 2,950 (4,1); 2,931 (1,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,3); 2,507 (57,2); 2,503 (74,4); 2,498 (54,2); 2,334 (0,3); 2,329 (0,5); 2,325 (0,4); 1,180 (4,3); 1,161 (8,7); 1,143 (4,1); 0,146 (0,5); 0,008 (3,9); 0,000 (88,8); -0,007 (3,9); -0,150 (0,5)
I-18	2,11	2,13	Ví dụ 18: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,255 (3,5); 8,253 (3,7); 8,251 (3,6); 8,156 (1,3); 8,153 (1,3); 8,138 (1,8); 8,134 (1,6); 8,020 (0,4); 8,017 (0,5); 8,002 (1,4); 7,998 (1,4); 7,984 (1,6); 7,979 (1,5); 7,976 (1,4); 7,971 (1,6); 7,957 (1,5); 7,953 (1,5); 7,938 (0,6); 7,934 (0,5); 7,878 (1,7); 7,875 (1,8); 7,860 (1,2); 7,857 (1,2); 3,728 (16,0); 3,526 (0,5); 3,509 (1,3); 3,490 (1,3); 3,473 (0,5); 3,330 (61,8); 2,671 (0,4); 2,525 (1,2); 2,511 (25,5); 2,507 (50,6); 2,502 (65,3); 2,498 (46,3); 2,493 (21,9); 2,329 (0,4); 1,119 (3,5); 1,101 (7,8); 1,082 (3,4); 0,008 (0,6); 0,000 (15,4); -0,009 (0,6)
I-19	3,38	3,43	Ví dụ 19: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,226 (3,9); 8,243 (4,1); 7,705 (0,9); 7,699 (1,3); 7,684 (1,6); 7,678 (2,9); 7,667 (3,6); 7,662 (2,3); 7,640 (3,4); 7,619 (1,8); 3,788 (16,0); 3,323 (25,4); 2,999 (1,2); 2,981 (4,0); 2,963 (4,1); 2,944 (1,3); 2,671 (0,4); 2,626 (0,3); 2,507 (47,1); 2,502 (61,4); 2,498 (45,8); 2,329 (0,4); 2,300 (0,5); 1,177 (4,3); 1,159 (8,9); 1,140 (4,1); 0,008 (1,9); 0,000 (45,5)
I-20	2,05	2,08	Ví dụ 20: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,258 (4,1); 8,253 (4,3); 7,997 (1,5); 7,990 (2,5); 7,976 (2,4); 7,969 (3,3); 7,956 (1,7); 7,918 (1,1); 7,911 (0,9); 7,897 (1,6); 7,890 (1,4); 7,876 (0,7); 7,869 (0,6); 3,739 (16,0); 3,430 (15,0); 3,326 (81,6); 2,671 (0,7); 2,666 (0,6); 2,506 (84,7); 2,502 (108,3); 2,498 (84,4); 2,328 (0,7); 2,325 (0,5); 0,146 (0,6); 0,000 (128,1); -0,150 (0,6)
I-21	2,93	2,98	Ví dụ 21: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,586 (2,4); 9,583 (2,5); 9,317 (4,1); 8,798 (2,5); 8,794 (2,6); 8,341 (4,3); 3,925 (16,0); 3,912 (1,3); 3,893 (3,6); 3,874 (3,7); 3,856 (1,1); 3,324 (30,3); 2,671 (0,5); 2,506 (56,1); 2,502 (72,8); 2,498 (55,3); 2,329 (0,5); 1,258 (3,8); 1,239 (8,2); 1,221 (3,7); 0,146 (0,4); 0,007 (3,2); 0,000 (79,6); -0,150 (0,4)
I-22	1,87	1,90	Ví dụ 22: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,261 (3,9); 8,261 (4,1); 8,107 (1,6); 8,087 (2,0); 7,942 (0,8); 7,940 (1,0); 7,921 (1,7); 7,904 (2,1); 7,901 (2,4); 7,885 (2,2); 7,820 (1,2); 7,818 (1,3); 7,801 (1,6); 7,799 (1,6); 7,783 (0,6); 7,780 (0,7); 5,757 (1,1); 3,946 (16,0); 3,728 (0,5); 3,328 (59,2); 3,305 (1,0); 3,286 (1,1); 3,272 (1,1); 3,253 (1,1); 2,885 (1,1); 2,867 (1,2); 2,852 (1,0); 2,833 (1,0); 2,672 (0,3); 2,507 (37,2); 2,502 (48,9); 2,498 (35,7); 1,149 (3,9); 1,130 (8,2); 1,112 (3,7); 1,102 (0,4); 0,007 (1,5); 0,000 (35,2); -0,008 (1,5)
I-23	3,96	4,02	Ví dụ 23: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,288 (4,1); 8,977 (2,7); 8,456 (2,7); 8,327 (4,3); 8,317 (0,4); 4,033 (16,0); 3,395 (2,0); 3,377 (2,7); 3,357 (2,4); 3,327 (77,5); 2,720 (2,3); 2,701 (2,8); 2,682

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			(2,2); 2,672 (0,7); 2,579 (1,5); 2,560 (4,6); 2,542 (4,9); 2,523 (3,2); 2,507 (65,1); 2,502 (87,7); 2,498 (70,2); 2,329 (0,6); 2,075 (0,9); 1,233 (0,6); 1,152 (4,7); 1,133 (9,3); 1,115 (4,4); 0,000 (3,7)
I-24	2,32	2,39	Ví dụ 24: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,241 (3,7); 8,588 (1,6); 8,585 (1,8); 8,577 (1,7); 8,574 (1,8); 8,279 (3,8); 8,090 (1,5); 8,087 (1,6); 8,069 (1,7); 8,066 (1,8); 7,638 (1,6); 7,627 (1,6); 7,618 (1,5); 7,606 (1,5); 3,975 (16,0); 3,324 (34,0); 3,041 (1,1); 3,022 (3,7); 3,004 (3,8); 2,986 (1,2); 2,672 (0,3); 2,525 (0,8); 2,507 (40,5); 2,503 (55,3); 2,498 (43,4); 2,329 (0,4); 1,218 (4,0); 1,199 (8,3); 1,181 (3,9); 0,008 (1,5); 0,000 (45,1)
I-25	2,97	3,08	Ví dụ 25: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,217 (3,6); 8,235 (3,9); 7,564 (2,9); 7,560 (3,0); 7,555 (3,0); 7,544 (3,5); 7,460 (2,0); 7,455 (1,8); 7,440 (1,4); 7,435 (1,3); 3,791 (16,0); 3,323 (28,6); 2,671 (0,3); 2,506 (48,4); 2,502 (56,6); 2,498 (37,8); 2,329 (0,4); 1,398 (0,8); 0,008 (2,5); 0,000 (64,5); -0,008 (2,5)
I-26	2,76	2,81	Ví dụ 26: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,389 (2,0); 9,386 (2,0); 9,366 (3,5); 8,849 (2,2); 8,845 (2,1); 8,370 (3,7); 6,870 (0,5); 5,756 (0,4); 4,452 (0,5); 4,347 (15,7); 4,018 (0,6); 3,995 (0,4); 3,326 (80,4); 3,151 (16,0); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,3); 2,524 (1,2); 2,511 (28,7); 2,507 (56,3); 2,502 (72,6); 2,498 (52,3); 2,494 (25,3); 2,334 (0,4); 2,329 (0,5); 2,325 (0,3); 2,183 (0,8); 1,355 (5,8); 1,233 (0,6); 0,008 (1,2); 0,000 (33,6); -0,009 (1,3)
I-27	1,84	1,87	Ví dụ 27: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,253 (3,5); 8,275 (3,8); 8,273 (3,7); 8,257 (1,5); 8,254 (1,4); 8,237 (1,8); 8,234 (1,7); 8,038 (0,5); 8,035 (0,6); 8,020 (1,5); 8,016 (1,6); 8,001 (1,5); 7,998 (1,3); 7,984 (1,2); 7,980 (1,4); 7,965 (1,6); 7,961 (1,7); 7,946 (0,7); 7,942 (0,6); 7,903 (0,9); 7,895 (2,1); 7,892 (2,0); 7,877 (1,4); 7,873 (1,3); 7,567 (0,4); 7,547 (0,6); 5,756 (8,2); 5,231 (0,7); 5,226 (0,6); 5,216 (0,5); 5,211 (1,3); 5,205 (0,5); 5,196 (0,7); 5,190 (0,8); 5,175 (0,4); 4,802 (2,1); 4,783 (4,1); 4,763 (2,6); 4,673 (2,9); 4,657 (3,1); 4,639 (2,0); 3,746 (16,0); 3,732 (0,5); 3,602 (0,5); 3,594 (0,5); 3,325 (51,0); 2,676 (0,3); 2,671 (0,4); 2,524 (1,2); 2,511 (26,7); 2,507 (53,3); 2,502 (69,4); 2,498 (49,5); 2,493 (23,4); 2,333 (0,3); 2,329 (0,5); 1,760 (0,5); 1,236 (0,7); 1,190 (0,3); 0,000 (2,3)
I-28	3,22	3,29	Ví dụ 28: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,561 (4,9); 8,983 (2,2); 8,362 (2,2); 8,359 (2,2); 4,075 (16,0); 4,032 (0,3); 4,022 (0,4); 3,323 (56,4); 3,202 (1,1); 3,184 (3,5); 3,165 (3,5); 3,147 (1,1); 2,676 (0,4); 2,671 (0,6); 2,667 (0,4); 2,511 (33,1); 2,507 (65,1); 2,502 (84,7); 2,498 (61,6); 2,494 (30,1); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,324 (0,4); 1,355 (0,7); 1,252 (4,0); 1,233 (8,3); 1,215 (3,7); 0,008 (2,6); 0,000 (63,4); -0,008 (2,5)
I-29	2,93	3,04	Ví dụ 29: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,302 (3,5); 8,962 (1,6); 8,959 (1,8); 8,951 (1,8); 8,947 (1,8); 8,457 (1,3); 8,437 (1,4); 8,334 (3,7); 7,856 (1,7); 7,845 (1,7); 7,836 (1,6); 7,824 (1,6); 4,092 (16,0); 3,329 (37,7); 2,526 (0,6); 2,512 (14,7); 2,508 (30,1); 2,504 (40,6); 2,499 (31,1); 2,495 (16,5); 0,000 (1,9)
I-30	2,36	2,41	Ví dụ 30: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,307 (3,8); 8,443 (2,9); 8,305 (4,0); 8,190 (6,5); 4,008 (15,9); 3,327 (62,6); 2,995 (16,0); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,511 (28,7); 2,507 (57,0); 2,502 (75,3); 2,498 (56,9); 2,334 (0,4); 2,329 (0,5); 2,325 (0,4); 0,000 (3,6)
I-31	3,86	3,94	Ví dụ 31: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,283 (3,4); 8,955 (2,1); 8,952 (2,1); 8,347 (2,1); 8,343 (2,2); 8,334 (3,8); 4,021 (16,0); 3,324 (17,5); 3,137 (2,1); 3,119 (3,6); 3,101 (2,2); 2,892 (1,6); 2,732

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			(1,3); 2,672 (0,4); 2,525 (0,7); 2,512 (20,3); 2,507 (42,4); 2,503 (57,6); 2,498 (43,7); 2,494 (22,9); 2,329 (0,4); 1,607 (1,2); 1,588 (2,4); 1,570 (2,5); 1,552 (1,4); 0,961 (4,2); 0,943 (8,6); 0,924 (3,8); 0,008 (1,3); 0,000 (42,0); -0,009 (2,2)
I-32	3,32	3,37	Ví dụ 32: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,580 (2,3); 9,577 (2,3); 9,316 (3,9); 8,796 (2,4); 8,792 (2,4); 8,350 (4,1); 7,903 (0,5); 7,898 (0,5); 7,547 (0,5); 5,756 (2,2); 3,923 (16,0); 3,898 (2,3); 3,883 (1,8); 3,878 (2,4); 3,873 (1,8); 3,859 (2,3); 3,775 (0,8); 3,323 (27,3); 2,676 (0,3); 2,671 (0,5); 2,667 (0,3); 2,524 (1,0); 2,511 (25,7); 2,507 (52,2); 2,502 (69,6); 2,498 (51,6); 2,493 (26,0); 2,329 (0,4); 2,324 (0,3); 1,737 (1,1); 1,718 (1,9); 1,699 (2,0); 1,680 (1,2); 1,013 (4,1); 1,002 (0,9); 0,995 (8,4); 0,976 (3,8); 0,000 (9,4); -0,008 (0,4)
I-33	2,11	2,12	Ví dụ 33: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,315 (3,7); 8,969 (1,6); 8,966 (1,8); 8,958 (1,8); 8,954 (1,7); 8,556 (1,6); 8,552 (1,7); 8,536 (1,8); 8,532 (1,7); 8,319 (4,0); 7,938 (1,7); 7,926 (1,6); 7,918 (1,6); 7,906 (1,5); 4,318 (16,0); 3,552 (0,9); 3,533 (1,0); 3,519 (1,1); 3,500 (1,1); 3,481 (0,3); 3,324 (25,2); 3,031 (1,1); 3,012 (1,2); 2,998 (1,0); 2,979 (1,0); 2,507 (37,9); 2,503 (49,7); 2,499 (37,5); 1,303 (3,8); 1,285 (8,0); 1,266 (3,7); 0,000 (5,3)
I-34	4,41	4,38	Ví dụ 34: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,332 (3,7); 8,517 (4,3); 8,515 (4,4); 8,272 (3,7); 8,251 (3,9); 7,627 (0,5); 7,623 (0,6); 7,614 (0,4); 7,597 (0,5); 7,575 (0,4); 7,566 (0,4); 7,556 (0,4); 7,542 (2,9); 7,538 (3,4); 7,509 (2,4); 7,504 (1,7); 7,488 (2,1); 7,483 (1,8); 3,321 (35,3); 2,680 (0,4); 2,675 (0,9); 2,671 (1,2); 2,666 (0,8); 2,662 (0,4); 2,610 (16,0); 2,524 (3,5); 2,511 (65,6); 2,506 (129,9); 2,502 (168,9); 2,497 (120,0); 2,493 (56,5); 2,337 (0,4); 2,333 (0,8); 2,329 (1,1); 2,324 (0,8); 2,320 (0,4); 1,355 (1,2); 1,328 (0,4); 1,207 (0,3); 1,189 (0,7); 1,168 (2,5); 1,160 (2,3); 1,145 (0,4); 1,058 (0,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (97,2); -0,009 (3,2); -0,150 (0,4)
I-35	4,07	4,03	Ví dụ 35: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,334 (5,6); 8,540 (6,8); 8,538 (6,7); 8,234 (2,7); 8,231 (2,8); 8,214 (3,0); 8,211 (2,8); 7,693 (1,0); 7,690 (1,0); 7,673 (2,6); 7,669 (2,1); 7,655 (2,3); 7,651 (2,2); 7,621 (3,9); 7,602 (2,0); 7,440 (1,8); 7,437 (1,8); 7,420 (3,0); 7,402 (1,5); 7,399 (1,4); 3,323 (126,5); 3,130 (2,0); 3,112 (6,6); 3,093 (6,7); 3,075 (2,1); 2,680 (0,5); 2,675 (1,1); 2,671 (1,5); 2,666 (1,1); 2,662 (0,5); 2,524 (4,8); 2,511 (84,8); 2,506 (166,1); 2,502 (215,2); 2,497 (153,7); 2,493 (72,9); 2,333 (1,0); 2,329 (1,4); 2,324 (1,0); 1,333 (7,5); 1,315 (16,0); 1,297 (7,2); 0,008 (1,0); 0,000 (28,0); -0,009 (0,9)
I-36	2,64	2,67	Ví dụ 36: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,577 (2,7); 9,575 (2,7); 9,320 (4,2); 8,825 (2,8); 8,822 (2,8); 8,347 (4,5); 7,902 (0,7); 7,897 (0,7); 7,886 (0,4); 7,566 (0,3); 7,546 (0,5); 5,757 (1,3); 4,018 (1,1); 3,934 (16,0); 3,700 (15,4); 3,325 (73,6); 2,671 (0,7); 2,506 (74,4); 2,502 (95,9); 2,498 (76,5); 2,328 (0,6); 1,258 (0,3); 1,236 (1,0); 1,169 (0,8); 0,000 (2,4)
I-37	3,10	3,17	Ví dụ 37: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,392 (2,2); 9,388 (2,3); 9,369 (3,8); 8,726 (2,3); 8,721 (2,4); 8,385 (3,9); 8,316 (0,5); 4,362 (16,0); 3,627 (0,9); 3,608 (1,1); 3,594 (1,1); 3,575 (1,0); 3,324 (136,2); 3,117 (1,0); 3,098 (1,2); 3,084 (1,0); 3,065 (0,9); 2,676 (0,8); 2,671 (1,1); 2,667 (0,9); 2,507 (127,4); 2,502 (169,6); 2,498 (129,7); 2,333 (0,8); 2,329 (1,1); 2,325 (0,9); 1,330 (3,8); 1,312 (8,1); 1,293 (3,6); 0,146 (0,9); 0,008 (7,7); 0,000 (196,4); -0,150 (0,9)
I-38	2,63	2,68	Ví dụ 38: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO):

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			δ = 9,273 (3,9); 8,266 (4,2); 8,141 (2,4); 8,120 (3,8); 8,105 (2,9); 8,100 (3,4); 8,055 (2,4); 8,049 (2,0); 8,033 (1,5); 8,028 (1,3); 7,904 (0,8); 7,899 (0,7); 7,894 (0,5); 7,887 (0,5); 7,697 (0,3); 7,568 (0,5); 7,548 (0,8); 7,528 (0,3); 3,763 (16,0); 3,530 (0,6); 3,513 (1,3); 3,495 (1,4); 3,476 (0,6); 3,357 (0,5); 3,328 (61,7); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,525 (1,3); 2,507 (57,0); 2,502 (75,7); 2,498 (56,3); 2,333 (0,3); 2,329 (0,5); 2,325 (0,3); 1,125 (3,8); 1,107 (8,1); 1,088 (3,6); 0,000 (0,6)
I-39	3,45	3,52	Ví dụ 39: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,386 (2,2); 9,383 (2,3); 9,374 (3,8); 8,774 (2,3); 8,769 (2,3); 8,316 (0,4); 8,302 (3,8); 5,756 (0,4); 4,362 (16,0); 3,637 (0,5); 3,616 (0,9); 3,605 (0,6); 3,596 (0,6); 3,585 (1,0); 3,564 (0,6); 3,322 (68,3); 2,993 (0,6); 2,981 (0,7); 2,973 (0,7); 2,961 (1,1); 2,949 (0,7); 2,941 (0,7); 2,928 (0,6); 2,676 (0,6); 2,671 (0,8); 2,666 (0,6); 2,511 (49,6); 2,506 (97,4); 2,502 (127,7); 2,497 (95,5); 2,493 (49,9); 2,333 (0,6); 2,329 (0,8); 2,324 (0,6); 2,029 (0,5); 2,010 (0,7); 1,994 (0,8); 1,975 (0,7); 1,956 (0,4); 1,804 (0,4); 1,789 (0,6); 1,783 (0,5); 1,770 (0,6); 1,757 (0,4); 1,754 (0,4); 1,146 (3,8); 1,128 (8,0); 1,109 (3,6); 0,146 (0,8); 0,008 (8,1); 0,000 (174,8); -0,008 (10,0); -0,150 (0,8)
I-40	3,10	3,15	Ví dụ 40: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,347 (4,8); 8,561 (5,7); 8,293 (2,2); 8,291 (2,3); 8,274 (2,4); 8,271 (2,3); 7,668 (1,0); 7,665 (1,1); 7,647 (2,2); 7,630 (1,4); 7,627 (1,3); 7,480 (1,7); 7,460 (2,8); 7,442 (1,3); 7,179 (2,9); 7,159 (2,6); 6,870 (1,5); 6,647 (0,8); 5,165 (3,3); 5,147 (6,3); 5,130 (3,6); 4,804 (0,5); 4,788 (1,2); 4,771 (1,9); 4,755 (1,2); 4,738 (0,4); 4,512 (3,8); 4,496 (6,3); 4,480 (3,3); 3,328 (53,8); 2,672 (0,6); 2,507 (73,4); 2,503 (93,5); 2,499 (70,8); 2,330 (0,6); 2,183 (2,4); 1,355 (16,0); 1,233 (0,9); 1,182 (0,6); 0,008 (3,2); 0,000 (57,9)
I-41	3,73	3,80	Ví dụ 41: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,277 (3,9); 8,989 (2,5); 8,456 (2,5); 8,453 (2,5); 8,345 (0,3); 8,333 (4,2); 7,954 (0,5); 4,021 (0,4); 4,003 (1,1); 3,988 (16,0); 3,949 (0,4); 3,932 (1,0); 3,916 (1,4); 3,899 (1,1); 3,883 (0,4); 3,325 (35,1); 2,892 (3,7); 2,732 (3,3); 2,672 (0,3); 2,507 (40,5); 2,503 (53,7); 2,499 (41,6); 2,330 (0,4); 1,235 (14,8); 1,219 (14,7); 0,008 (1,4); 0,000 (30,8)
I-42	3,39	3,46	Ví dụ I-42: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,881 (0,4); 9,213 (3,4); 8,238 (3,6); 8,236 (3,6); 8,136 (0,4); 8,085 (0,7); 7,683 (0,3); 7,639 (2,8); 7,634 (2,9); 7,572 (2,4); 7,552 (3,7); 7,504 (0,5); 7,499 (0,5); 7,483 (2,1); 7,478 (2,0); 7,462 (1,4); 7,457 (1,3); 6,870 (0,4); 3,779 (16,0); 3,618 (0,4); 3,608 (0,3); 3,602 (1,0); 3,585 (0,4); 3,325 (20,2); 3,098 (0,6); 3,067 (1,2); 3,048 (3,9); 3,030 (4,0); 3,016 (0,9); 3,012 (1,3); 2,877 (1,1); 2,865 (1,1); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,525 (1,4); 2,520 (2,1); 2,511 (30,1); 2,507 (61,5); 2,502 (81,2); 2,498 (58,8); 2,493 (28,4); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,324 (0,4); 2,183 (0,7); 1,776 (0,4); 1,769 (0,4); 1,760 (1,2); 1,752 (0,4); 1,744 (0,4); 1,355 (5,3); 1,245 (0,8); 1,236 (0,4); 1,226 (1,7); 1,218 (0,5); 1,208 (0,8); 1,193 (4,1); 1,175 (8,7); 1,156 (3,9); 0,146 (0,4); 0,008 (2,9); 0,000 (88,8); -0,009 (3,1); -0,150 (0,4)
I-43	2,61	2,69	Ví dụ I-43: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,259 (3,8); 8,259 (4,0); 8,123 (6,1); 8,118 (3,1); 8,107 (2,5); 8,102 (1,5); 7,945 (2,9); 7,939 (0,8); 7,929 (0,7); 7,923 (2,3); 5,757 (11,4); 3,742 (16,0); 3,600 (0,7); 3,581 (2,2); 3,563 (2,2); 3,545 (0,7); 3,329 (38,9); 2,671 (0,4); 2,525 (1,2); 2,511 (23,7); 2,507 (48,0); 2,502 (63,6); 2,498 (47,5); 2,494 (24,1); 2,329 (0,4); 1,146 (3,7); 1,128 (8,2); 1,109 (3,6); 0,008 (0,3); 0,000 (9,3); -0,008 (0,4)
I-44	2,36	2,45	Ví dụ I-44: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO):

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			δ = 9,270 (3,8); 8,317 (0,5); 8,273 (4,1); 8,022 (2,9); 8,016 (3,1); 7,986 (2,2); 7,966 (3,6); 7,905 (2,1); 7,899 (1,9); 7,884 (1,3); 7,879 (1,2); 3,969 (16,0); 3,377 (1,0); 3,359 (1,3); 3,344 (1,9); 3,329 (150,3); 3,307 (0,6); 2,945 (1,1); 2,927 (1,2); 2,912 (1,0); 2,893 (0,9); 2,676 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,524 (3,1); 2,507 (141,2); 2,502 (185,0); 2,498 (135,5); 2,333 (0,9); 2,329 (1,2); 2,325 (0,9); 1,179 (3,8); 1,160 (8,2); 1,142 (3,7); 0,008 (2,3); 0,000 (70,9); -0,009 (2,6); -0,150 (0,3)
I-45		2,53	Ví dụ I-45: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,295 (3,9); 8,364 (3,2); 8,342 (3,4); 8,292 (4,1); 7,347 (3,4); 7,325 (3,3); 4,015 (1,0); 3,987 (16,0); 3,922 (15,6); 3,910 (1,3); 3,733 (1,0); 3,714 (3,4); 3,695 (3,4); 3,677 (1,0); 3,506 (0,3); 3,331 (66,6); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,507 (58,9); 2,503 (75,4); 2,498 (56,9); 2,334 (0,4); 2,329 (0,5); 2,325 (0,4); 2,087 (2,0); 1,234 (0,8); 1,203 (3,6); 1,185 (7,9); 1,166 (3,5); 0,008 (2,1); 0,000 (43,3)
I-46	2,92	2,98	Ví dụ I-46: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,269 (4,1); 8,592 (1,8); 8,590 (1,9); 8,581 (1,9); 8,578 (1,8); 8,306 (4,3); 8,094 (1,7); 8,092 (1,7); 8,074 (1,9); 8,071 (1,8); 7,955 (0,8); 7,642 (1,6); 7,631 (1,6); 7,622 (1,5); 7,610 (1,5); 3,979 (16,0); 3,334 (9,6); 3,046 (1,2); 3,027 (3,8); 3,009 (3,9); 2,991 (1,3); 2,893 (4,9); 2,734 (4,4); 2,509 (22,7); 2,505 (28,6); 2,501 (21,4); 1,220 (4,2); 1,202 (8,6); 1,184 (4,1); 0,000 (4,6)
I-47	4,02	4,10	Ví dụ I-47: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,308 (3,5); 8,964 (2,1); 8,961 (2,1); 8,355 (3,9); 8,353 (3,9); 8,341 (2,2); 8,338 (2,2); 8,317 (0,3); 4,030 (16,0); 3,328 (183,2); 3,184 (1,1); 3,165 (3,5); 3,147 (3,6); 3,129 (1,1); 2,676 (0,8); 2,671 (1,1); 2,667 (0,8); 2,525 (2,5); 2,520 (3,8); 2,511 (53,3); 2,507 (109,8); 2,502 (147,2); 2,498 (110,1); 2,494 (55,4); 2,334 (0,7); 2,329 (1,0); 2,325 (0,7); 1,235 (4,2); 1,217 (8,3); 1,198 (3,8); 0,146 (1,1); 0,008 (8,0); 0,000 (229,8); -0,009 (9,5); -0,150 (1,1)
I-48	2,64	2,70	Ví dụ I-48: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,337 (2,2); 9,324 (2,3); 9,295 (4,0); 8,366 (2,9); 8,353 (2,8); 8,273 (4,3); 5,757 (0,8); 3,919 (16,0); 3,894 (0,7); 3,879 (1,3); 3,862 (1,3); 3,327 (92,4); 2,676 (0,6); 2,671 (0,8); 2,667 (0,6); 2,507 (88,5); 2,502 (113,9); 2,498 (86,6); 2,333 (0,6); 2,329 (0,8); 2,325 (0,6); 1,243 (3,6); 1,224 (7,4); 1,206 (3,4); 0,146 (0,6); 0,008 (6,3); 0,000 (128,4); -0,150 (0,6)
I-49	1,99	2,05	Ví dụ I-49: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 11,328 (3,1); 9,295 (4,3); 8,532 (1,7); 8,509 (4,8); 8,487 (4,4); 8,465 (1,5); 8,318 (0,6); 8,304 (4,7); 3,876 (16,0); 3,847 (0,7); 3,658 (1,1); 3,639 (3,5); 3,621 (3,5); 3,602 (1,1); 3,331 (78,4); 2,892 (0,3); 2,676 (1,0); 2,672 (1,3); 2,668 (1,0); 2,565 (0,4); 2,507 (157,3); 2,503 (200,0); 2,498 (150,8); 2,344 (0,8); 2,334 (1,0); 2,329 (1,4); 2,169 (15,8); 1,989 (1,1); 1,234 (0,5); 1,184 (3,8); 1,175 (1,3); 1,166 (8,3); 1,148 (3,7); 0,008 (0,9); 0,000 (19,7)
I-50	2,27	2,39	Ví dụ I-50: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 10,770 (2,6); 9,256 (3,9); 8,290 (1,9); 8,277 (4,3); 8,268 (2,5); 8,242 (0,7); 8,115 (3,0); 8,093 (2,4); 8,063 (0,4); 4,456 (1,9); 4,038 (0,6); 4,020 (0,7); 3,979 (16,0); 3,332 (83,1); 2,966 (1,2); 2,948 (4,0); 2,929 (4,1); 2,911 (1,3); 2,676 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,507 (62,3); 2,503 (81,2); 2,498 (61,4); 2,334 (0,4); 2,330 (0,5); 2,325 (0,4); 2,184 (1,9); 2,119 (15,2); 1,989 (2,6); 1,193 (0,7); 1,172 (4,5); 1,154 (9,1); 1,135 (4,2); 0,008 (2,6); 0,000 (55,6); -0,008 (3,1)
I-51		2,48	Ví dụ I-51: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,259 (4,5); 9,210 (2,4); 9,198 (2,5); 8,278 (4,7); 8,276 (4,8); 8,226 (3,2); 8,214 (3,1); 5,757 (2,5); 3,965 (0,7); 3,946 (0,8); 3,932 (0,8); 3,920 (0,7); 3,914 (0,8); 3,795 (16,0); 3,375 (0,6); 3,356 (0,8); 3,328 (59,8); 3,305 (0,3); 2,676 (0,4); 2,672 (0,5); 2,667 (0,4); 2,525 (1,2); 2,511 (27,2); 2,507 (56,1); 2,502 (75,0);

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			2,498 (55,5); 2,494 (27,5); 2,334 (0,4); 2,329 (0,5); 2,325 (0,4); 1,264 (3,7); 1,245 (7,9); 1,227 (3,8); 0,008 (1,2); 0,000 (39,0); -0,008 (1,4)
I-52	2,51	2,61	Ví dụ I-52: $^1\text{H-NMR}$ (601,6 MHz, CD_3CN): δ = 9,321 (2,5); 8,780 (3,9); 8,736 (2,6); 7,746 (3,8); 3,824 (1,3); 3,809 (16,0); 3,799 (3,9); 3,787 (1,3); 2,141 (2,3); 1,965 (10,4); 1,957 (0,4); 1,944 (3,9); 1,940 (5,2); 1,937 (3,8); 1,933 (2,0); 1,297 (3,8); 1,285 (7,6); 1,273 (3,7); 0,000 (3,3)
I-53		3,12	Ví dụ I-53: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,242 (3,5); 8,270 (3,7); 8,119 (0,4); 8,064 (2,9); 8,042 (3,1); 7,123 (3,3); 7,101 (3,1); 4,012 (16,0); 3,959 (0,4); 3,909 (1,6); 3,899 (16,0); 3,332 (95,1); 2,942 (1,2); 2,923 (3,9); 2,905 (3,9); 2,887 (1,3); 2,677 (0,4); 2,672 (0,6); 2,668 (0,4); 2,525 (1,6); 2,511 (32,5); 2,507 (64,4); 2,503 (84,3); 2,499 (63,2); 2,334 (0,4); 2,330 (0,6); 2,325 (0,4); 1,990 (0,8); 1,175 (0,5); 1,144 (4,1); 1,126 (8,6); 1,107 (4,0); 0,008 (2,3); 0,000 (60,3); -0,008 (3,0)
I-54	3,07	3,16	Ví dụ I-54: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,293 (3,9); 8,987 (2,7); 8,490 (2,7); 8,335 (4,1); 5,757 (0,6); 4,713 (1,2); 4,699 (2,4); 4,685 (1,2); 4,595 (1,1); 4,581 (2,3); 4,567 (1,3); 4,041 (16,0); 3,581 (1,1); 3,567 (2,2); 3,553 (1,1); 3,521 (1,2); 3,507 (2,2); 3,493 (1,1); 3,327 (105,4); 2,671 (0,8); 2,506 (88,1); 2,502 (120,1); 2,498 (96,8); 2,333 (0,6); 2,329 (0,8); 1,234 (0,4); 0,146 (0,4); 0,008 (2,7); 0,000 (84,4); -0,150 (0,4)
I-55	3,01	3,12	Ví dụ I-55: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,956 (3,9); 8,953 (4,0); 8,942 (2,0); 8,940 (2,0); 8,317 (2,1); 7,904 (3,7); 7,902 (3,7); 3,950 (16,0); 3,332 (109,0); 3,172 (1,0); 3,154 (3,3); 3,135 (3,4); 3,117 (1,0); 2,676 (0,3); 2,672 (0,5); 2,667 (0,4); 2,525 (1,2); 2,520 (1,8); 2,512 (26,2); 2,507 (53,9); 2,503 (71,3); 2,498 (52,0); 2,494 (25,3); 2,334 (0,3); 2,330 (0,5); 2,325 (0,4); 1,251 (0,5); 1,232 (5,1); 1,214 (7,9); 1,195 (3,5); 1,103 (0,3); 0,000 (6,1)
I-56	1,56	1,61	Ví dụ I-56: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,502 (3,9); 9,497 (3,4); 9,306 (4,1); 8,900 (4,0); 8,895 (3,4); 8,645 (1,9); 8,322 (4,5); 8,057 (1,9); 3,892 (16,0); 3,843 (1,3); 3,825 (3,8); 3,806 (3,7); 3,788 (1,1); 3,332 (180,7); 2,676 (0,9); 2,672 (1,1); 2,667 (0,8); 2,507 (135,9); 2,503 (156,6); 2,498 (111,5); 2,334 (0,9); 2,330 (1,0); 2,325 (0,7); 1,298 (0,5); 1,259 (1,0); 1,235 (5,5); 1,217 (8,5); 1,198 (3,8); 0,000 (14,4); -0,062 (0,6)
I-57	2,82	2,89	Ví dụ I-57: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,596 (2,3); 9,593 (2,2); 9,330 (3,8); 9,320 (0,5); 8,830 (2,3); 8,826 (2,2); 8,353 (4,1); 4,994 (1,0); 4,982 (1,5); 4,969 (1,1); 4,877 (1,0); 4,865 (1,5); 4,852 (1,2); 4,493 (1,1); 4,480 (1,5); 4,468 (1,0); 4,427 (1,2); 4,414 (1,5); 4,402 (1,0); 3,957 (16,0); 3,947 (1,6); 3,919 (0,4); 3,813 (0,3); 3,328 (182,7); 2,676 (0,7); 2,671 (1,0); 2,667 (0,7); 2,663 (0,4); 2,524 (3,6); 2,511 (61,5); 2,507 (120,1); 2,502 (156,5); 2,498 (114,9); 2,493 (57,0); 2,333 (0,7); 2,329 (1,0); 2,325 (0,7); 2,074 (0,5); 1,235 (0,6); 0,008 (2,3); 0,000 (63,1); -0,008 (2,5)
I-58		2,19	Ví dụ I-58: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,553 (2,2); 9,550 (2,2); 9,320 (3,9); 8,786 (2,4); 8,781 (2,4); 8,336 (4,1); 5,755 (1,0); 5,119 (1,2); 5,106 (2,9); 5,093 (1,3); 4,066 (1,6); 4,052 (3,3); 4,038 (2,1); 3,919 (16,0); 3,869 (1,1); 3,855 (2,7); 3,842 (2,5); 3,828 (0,9); 3,400 (0,4); 3,393 (0,4); 3,384 (0,5); 3,345 (268,1); 3,309 (0,6); 2,672 (0,4); 2,526 (1,1); 2,512 (22,7); 2,508 (46,1); 2,503 (61,2); 2,499 (45,2); 2,494 (22,6); 2,330 (0,4); 0,000 (0,6)
I-59	2,31	2,41	Ví dụ I-59: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, CD_3CN): δ = 9,085 (2,6); 8,843 (1,4); 8,842 (1,6); 8,840 (1,5); 8,333 (1,7); 8,331 (1,6); 8,165 (2,9); 5,447 (1,4); 3,979 (16,0); 3,725 (0,9); 3,715 (2,8); 3,705 (2,9); 3,695

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			(1,0); 3,459 (0,9); 3,449 (1,8); 3,439 (0,8); 3,177 (2,4); 3,167 (4,3); 3,157 (2,2); 2,145 (5,7); 1,957 (0,5); 1,953 (0,6); 1,949 (3,0); 1,945 (5,2); 1,941 (7,5); 1,937 (5,0); 1,933 (2,5)
I-60	1,76	1,77	Ví dụ I-60: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,262 (4,0); 8,968 (3,2); 8,963 (3,3); 8,415 (1,6); 8,354 (3,0); 8,350 (3,1); 8,303 (4,3); 7,862 (1,6); 4,008 (16,0); 3,331 (33,2); 3,113 (1,1); 3,095 (3,7); 3,076 (3,8); 3,058 (1,2); 2,508 (35,4); 2,504 (46,2); 2,499 (34,8); 1,246 (4,0); 1,228 (8,5); 1,209 (3,9); 0,008 (1,7); 0,000 (46,1); -0,008 (2,2)
I-61	2,63	2,71	Ví dụ I-61: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,343 (3,7); 8,973 (1,6); 8,969 (1,8); 8,961 (1,8); 8,957 (1,8); 8,559 (1,6); 8,555 (1,7); 8,539 (1,8); 8,535 (1,8); 8,347 (4,0); 8,345 (4,0); 7,941 (1,7); 7,929 (1,6); 7,921 (1,6); 7,909 (1,6); 4,320 (16,0); 3,561 (1,0); 3,542 (1,0); 3,528 (1,1); 3,509 (1,1); 3,490 (0,3); 3,330 (33,2); 3,048 (1,1); 3,030 (1,2); 3,015 (1,0); 2,997 (1,0); 2,677 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,525 (1,3); 2,507 (56,6); 2,503 (75,2); 2,499 (56,4); 2,334 (0,4); 2,330 (0,5); 2,325 (0,4); 1,301 (3,8); 1,282 (8,2); 1,264 (3,7); 0,146 (0,5); 0,008 (4,0); 0,000 (110,8); -0,008 (5,6); -0,150 (0,5)
I-62	2,15	2,17	Ví dụ I-62: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,207 (3,4); 8,318 (0,5); 8,194 (3,7); 8,192 (3,6); 8,062 (1,6); 8,059 (1,7); 8,042 (2,2); 8,039 (2,2); 7,947 (1,8); 7,928 (2,7); 7,908 (1,6); 7,735 (2,0); 7,732 (2,1); 7,716 (1,8); 7,713 (1,7); 3,742 (16,0); 3,593 (1,0); 3,574 (3,5); 3,556 (3,6); 3,537 (1,2); 3,329 (74,8); 2,676 (0,7); 2,671 (0,9); 2,667 (0,7); 2,662 (0,4); 2,525 (2,4); 2,520 (3,6); 2,511 (50,5); 2,507 (105,6); 2,502 (140,5); 2,498 (101,4); 2,493 (48,8); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,324 (0,6); 2,086 (0,7); 1,235 (1,3); 1,184 (4,0); 1,166 (9,0); 1,147 (3,9); 1,140 (0,6); 0,146 (0,7); 0,008 (5,0); 0,000 (161,5); -0,009 (5,9); -0,150 (0,7)
I-63	3,62	3,75	Ví dụ I-63: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,396 (5,6); 8,728 (2,2); 8,723 (2,3); 8,416 (4,1); 8,414 (3,9); 8,318 (0,5); 4,362 (16,0); 3,635 (0,9); 3,617 (1,0); 3,602 (1,1); 3,583 (1,0); 3,332 (165,3); 3,134 (1,0); 3,116 (1,2); 3,101 (1,0); 3,083 (1,0); 2,676 (0,8); 2,672 (1,1); 2,667 (0,8); 2,525 (2,6); 2,511 (62,1); 2,507 (126,3); 2,503 (165,5); 2,498 (121,7); 2,494 (60,8); 2,334 (0,8); 2,329 (1,1); 2,325 (0,8); 1,327 (3,7); 1,308 (8,1); 1,290 (3,6); 0,146 (0,4); 0,008 (3,1); 0,000 (96,0); -0,008 (4,1); -0,150 (0,4)
I-64	3,95	3,93	Ví dụ I-64: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,275 (2,6); 9,271 (2,5); 8,943 (4,3); 8,584 (2,6); 8,580 (2,6); 8,318 (0,5); 7,701 (3,0); 7,680 (3,9); 7,548 (3,8); 7,527 (3,0); 7,410 (4,6); 3,890 (16,0); 3,329 (75,4); 3,140 (1,3); 3,122 (4,2); 3,104 (4,3); 3,086 (1,4); 2,676 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,507 (140,3); 2,502 (179,9); 2,498 (134,5); 2,334 (0,9); 2,329 (1,2); 2,325 (0,9); 1,281 (4,6); 1,263 (9,7); 1,245 (4,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (84,0); -0,150 (0,4)
I-65	4,31	4,37	Ví dụ I-65: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,217 (3,1); 9,076 (4,1); 9,074 (4,1); 8,959 (2,3); 8,956 (2,3); 8,334 (2,3); 8,318 (1,7); 8,288 (3,7); 8,211 (4,1); 8,209 (4,1); 5,758 (1,1); 4,005 (16,0); 3,328 (226,4); 3,189 (1,1); 3,171 (3,5); 3,153 (3,6); 3,134 (1,1); 2,676 (2,7); 2,671 (3,8); 2,667 (2,8); 2,525 (9,3); 2,520 (14,6); 2,511 (211,4); 2,507 (434,4); 2,502 (573,8); 2,498 (421,2); 2,493 (209,9); 2,333 (2,7); 2,329 (3,7); 2,324 (2,8); 1,258 (0,3); 1,243 (4,1); 1,225 (8,8); 1,206 (3,9); 1,148 (0,3); 0,146 (1,3); 0,008 (9,7); 0,000 (308,8); -0,008 (13,1); -0,150 (1,4)
I-66	3,42	3,50	Ví dụ I-66: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,243 (3,5); 8,317 (0,4); 8,274 (3,7); 8,069 (2,9); 8,047 (3,1); 7,116 (3,3); 7,094 (3,2); 4,017 (0,4); 4,000 (16,0); 3,893 (15,8); 3,329 (74,5); 2,884 (2,3);

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			2,867 (3,7); 2,848 (2,4); 2,676 (0,7); 2,671 (0,9); 2,667 (0,7); 2,525 (2,3); 2,511 (50,8); 2,507 (105,0); 2,502 (139,6); 2,498 (102,9); 2,494 (51,4); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,325 (0,7); 1,496 (1,2); 1,478 (2,4); 1,460 (2,5); 1,442 (1,4); 0,875 (4,2); 0,857 (8,4); 0,838 (3,7); 0,008 (0,8); 0,000 (28,2); -0,008 (1,2)
I-67	2,70	2,75	Ví dụ I-67: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,028 (0,5); 9,850 (0,4); 9,268 (0,7); 9,248 (3,0); 8,317 (1,0); 8,302 (0,7); 8,262 (3,1); 8,236 (0,6); 8,194 (0,5); 8,119 (1,3); 8,097 (0,7); 8,026 (2,6); 8,004 (2,6); 7,996 (0,5); 7,978 (0,6); 7,181 (0,8); 7,159 (0,6); 7,133 (2,8); 7,111 (2,7); 4,442 (2,5); 4,071 (13,8); 4,017 (3,3); 4,014 (3,6); 3,959 (1,9); 3,910 (16,0); 3,329 (346,6); 2,881 (1,4); 2,869 (1,4); 2,676 (1,7); 2,671 (2,3); 2,667 (1,7); 2,525 (5,8); 2,511 (128,4); 2,507 (263,1); 2,502 (348,1); 2,498 (256,2); 2,494 (127,6); 2,422 (14,2); 2,334 (1,7); 2,329 (2,3); 2,325 (1,7); 1,989 (0,9); 1,234 (0,3); 1,175 (0,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,2); 0,000 (99,9); -0,008 (3,8); -0,150 (0,5)
I-68	2,46	2,50	Ví dụ I-68: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,319 (4,1); 9,142 (1,6); 9,139 (1,9); 9,130 (1,8); 9,126 (1,9); 8,582 (1,6); 8,578 (1,8); 8,562 (1,9); 8,558 (1,9); 8,328 (4,3); 8,024 (1,7); 8,012 (1,7); 8,003 (1,6); 7,991 (1,6); 3,870 (16,0); 3,802 (1,0); 3,783 (3,5); 3,765 (3,6); 3,746 (1,1); 3,333 (44,0); 2,676 (0,3); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,507 (56,6); 2,503 (74,8); 2,499 (56,9); 2,330 (0,5); 1,209 (3,7); 1,191 (8,1); 1,172 (3,6); 0,008 (1,1); 0,000 (28,7)
I-69	4,32	4,37	Ví dụ I-69: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,080 (4,3); 9,078 (4,2); 8,959 (2,4); 8,956 (2,4); 8,873 (1,8); 8,871 (2,0); 8,867 (2,1); 8,865 (1,8); 8,337 (2,4); 8,334 (2,4); 8,181 (4,2); 8,180 (4,2); 7,062 (2,5); 7,056 (2,5); 4,007 (16,0); 3,330 (22,5); 3,189 (1,1); 3,170 (3,7); 3,152 (3,7); 3,133 (1,2); 2,677 (0,3); 2,672 (0,5); 2,668 (0,3); 2,526 (1,2); 2,512 (26,3); 2,508 (53,3); 2,503 (70,1); 2,499 (51,8); 2,495 (26,3); 2,330 (0,4); 2,326 (0,3); 2,077 (0,6); 1,244 (4,0); 1,225 (8,7); 1,207 (3,9); 0,008 (1,3); 0,000 (37,3); -0,008 (1,8)
I-70	3,24	3,29	Ví dụ I-70: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,272 (4,0); 9,057 (2,0); 9,044 (2,1); 8,309 (4,2); 8,135 (2,8); 8,122 (2,7); 4,021 (0,4); 3,846 (16,0); 3,328 (22,9); 2,736 (1,1); 2,717 (3,4); 2,699 (3,5); 2,680 (1,3); 2,507 (37,7); 2,503 (49,4); 2,499 (37,9); 1,990 (1,3); 1,397 (1,1); 1,193 (0,3); 1,176 (0,7); 1,158 (0,4); 0,985 (4,0); 0,966 (8,1); 0,948 (3,8); 0,008 (1,7); 0,000 (44,7); -0,008 (2,1)
I-71		2,93	Ví dụ I-71: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,293 (4,1); 8,368 (3,1); 8,345 (3,3); 8,299 (4,3); 7,342 (3,4); 7,320 (3,2); 5,758 (0,9); 4,017 (0,4); 3,985 (16,0); 3,918 (15,5); 3,716 (2,2); 3,701 (1,9); 3,696 (2,5); 3,692 (1,8); 3,677 (2,2); 3,330 (25,0); 2,676 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,507 (54,4); 2,503 (69,4); 2,499 (51,7); 2,330 (0,5); 2,326 (0,3); 1,668 (1,1); 1,649 (2,0); 1,630 (2,0); 1,611 (1,2); 1,235 (0,7); 0,993 (4,1); 0,974 (8,2); 0,956 (3,7); 0,000 (2,4)
I-72	2,26	2,32	Ví dụ I-72: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,581 (3,0); 9,576 (3,0); 9,312 (4,1); 9,070 (3,3); 9,065 (3,2); 8,716 (1,0); 8,704 (0,9); 8,335 (4,3); 8,091 (0,4); 7,660 (0,6); 7,645 (0,8); 7,641 (0,7); 7,626 (0,6); 3,916 (16,0); 3,872 (1,3); 3,854 (3,8); 3,835 (3,9); 3,817 (1,4); 3,736 (0,6); 3,694 (0,7); 3,626 (0,8); 3,613 (0,8); 2,671 (1,0); 2,506 (105,6); 2,502 (135,4); 2,498 (103,6); 2,333 (0,7); 2,329 (0,9); 1,989 (0,7); 1,298 (0,6); 1,252 (4,0); 1,234 (9,7); 1,215 (3,9); 1,193 (0,3); 1,175 (0,5); 0,000 (3,0)
I-73	2,20	2,25	Ví dụ I-73: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,297 (3,6); 9,268 (0,9); 9,255 (0,6); 9,208 (0,4); 8,404 (3,2); 8,382 (3,4); 8,317 (0,4); 8,298 (3,9); 8,238 (0,6); 8,119 (0,8); 8,106 (0,4); 8,097 (0,9); 8,084

Ví dụ	LOGP_ TRUNG HÒA	LOGP_ HCOOH	
			(0,4); 8,024 (0,5); 8,022 (0,5); 7,996 (0,4); 7,975 (0,4); 7,352 (3,6); 7,330 (3,5); 7,181 (0,8); 7,159 (0,8); 7,087 (0,4); 7,069 (0,4); 7,067 (0,4); 5,758 (2,8); 4,564 (1,5); 4,442 (3,0); 4,115 (0,7); 4,015 (4,7); 3,988 (16,0); 3,931 (15,4); 3,909 (3,9); 3,568 (0,8); 3,544 (14,4); 3,331 (131,8); 2,676 (0,7); 2,672 (0,9); 2,667 (0,7); 2,525 (2,7); 2,511 (52,5); 2,507 (106,0); 2,503 (139,4); 2,498 (102,4); 2,494 (51,6); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,325 (0,7); 1,259 (0,5); 1,234 (1,5); 0,000 (5,6)
I-74	3,36	3,49	Ví dụ I-74: ¹ H-NMR (601,6 MHz, CD ₃ CN): δ= 8,905 (3,0); 8,903 (3,0); 8,852 (1,6); 8,850 (1,6); 8,500 (1,9); 8,313 (1,5); 8,311 (2,1); 8,309 (1,4); 8,183 (1,7); 8,181 (1,7); 7,962 (3,4); 7,961 (3,4); 4,001 (16,0); 3,940 (0,4); 3,124 (1,1); 3,111 (3,4); 3,099 (3,5); 3,087 (1,2); 2,639 (0,7); 2,184 (55,7); 2,109 (1,2); 2,005 (2,2); 1,998 (195,7); 1,989 (2,7); 1,985 (1,8); 1,981 (10,0); 1,977 (18,2); 1,973 (26,5); 1,969 (18,0); 1,965 (9,0); 1,882 (1,2); 1,419 (0,4); 1,404 (0,7); 1,373 (0,6); 1,330 (4,1); 1,318 (9,0); 1,309 (1,6); 1,305 (5,2); 1,301 (3,4); 0,914 (0,6)
I-75	2,84	2,94	Ví dụ I-75: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,582 (2,6); 9,107 (4,5); 8,797 (2,6); 8,794 (2,8); 8,761 (3,5); 8,668 (2,9); 8,361 (4,6); 8,314 (0,3); 5,754 (2,9); 3,939 (1,0); 3,920 (3,5); 3,897 (16,0); 3,883 (1,4); 3,316 (65,0); 2,675 (0,8); 2,671 (1,1); 2,666 (0,9); 2,506 (121,1); 2,502 (165,0); 2,497 (131,6); 2,333 (0,7); 2,328 (1,1); 2,324 (0,9); 1,988 (0,8); 1,272 (3,7); 1,253 (8,2); 1,235 (4,5); 1,175 (0,4); 0,146 (0,5); 0,008 (3,6); 0,000 (102,8); -0,150 (0,5)
I-76	3,73	3,84	Ví dụ I-76: ¹ H-NMR (601,6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9,334 (1,1); 9,333 (1,2); 9,331 (1,2); 9,329 (1,1); 9,015 (1,4); 9,014 (1,7); 8,867 (2,5); 8,865 (2,3); 8,751 (1,2); 8,750 (1,3); 8,747 (1,3); 8,287 (2,6); 8,286 (2,3); 8,036 (1,9); 5,446 (0,6); 3,879 (0,9); 3,867 (16,0); 3,855 (3,0); 3,842 (0,9); 2,129 (16,5); 1,964 (0,3); 1,955 (0,9); 1,951 (1,2); 1,947 (9,5); 1,943 (17,4); 1,939 (24,5); 1,935 (16,4); 1,931 (8,6); 1,313 (3,1); 1,300 (6,6); 1,288 (3,1); 1,270 (0,6); 0,005 (0,6); 0,000 (19,1); -0,006 (0,7)
I-77	3,81	3,90	Ví dụ I-77: ¹ H-NMR (601,6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9,333 (1,3); 9,332 (1,5); 9,330 (1,5); 8,871 (3,2); 8,869 (3,1); 8,750 (1,6); 8,748 (1,6); 8,736 (1,3); 8,734 (1,4); 8,731 (1,4); 8,730 (1,2); 8,250 (3,0); 8,249 (3,0); 6,869 (1,7); 6,865 (1,7); 5,446 (0,7); 3,884 (1,1); 3,871 (4,7); 3,869 (16,0); 3,859 (3,6); 3,847 (1,1); 2,133 (5,1); 1,956 (0,3); 1,952 (0,4); 1,948 (3,5); 1,944 (6,3); 1,940 (9,0); 1,936 (6,1); 1,932 (3,2); 1,314 (3,5); 1,302 (7,5); 1,290 (3,6); 1,285 (0,4); 1,267 (0,5); 0,000 (5,6)

Ví dụ sử dụng

Ctenocephalides felis – thử nghiệm tiếp xúc in vitro

Đề phủ lên ống thử nghiệm, đầu tiên 9 mg thành phần hoạt tính được hòa tan trong 1 ml axeton tuyệt đối nguyên chất và sau đó, được pha loãng đến nồng độ mong muốn với axeton tuyệt đối nguyên chất. 250 µl dung dịch được phân bố đồng đều trên thành bên trong và đáy của ống thử nghiệm 25 ml bằng cách lật và lắc ống trên máy lắc tròn (quay

lắc ở tốc độ 30 rpm trong 2 giờ). Với dung dịch thành phần hoạt tính 900 ppm và bề mặt bên trong 44,7 cm², phân bố đồng đều, thu được liều tính theo diện tích là 5 µg/cm².

Sau khi dung môi được làm bay hơi đi, đưa 5-10 con bọ chết mèo đã lớn (*Ctenocephalogenus felis*) vào ống, đóng kín bằng nắp nhựa thông khí và ủ ở vị trí nằm ngang ở nhiệt độ trong phòng và độ ẩm xung quanh. Sau 48 giờ, hiệu quả được xác định. Đến thời điểm cuối, ống thử nghiệm được dựng thẳng và các con bọ chết bị rơi xuống đáy ống. Các con bọ chết mà không động đậy ở dưới đáy hoặc cử động rời rạc được coi là đã chết hoặc gần chết.

Chất thể hiện tác dụng tốt chống lại *Ctenocephalogenus felis* nếu trong thử nghiệm này, nó có hiệu quả ít nhất là 80% ở tỷ lệ sử dụng là 5 µg/cm². Hiệu quả 100% là khi tất cả số bọ chết bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% nghĩa là không có con bọ chết nào bị tổn hại.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 5 µg/cm²: I-18, I-21

Boophilus microplus - thử nghiệm bọ (tiêm BOOPMI)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Đề tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 10 mg thành phần hoạt tính được phối trộn với 0,5 ml dung môi và nồng độ được pha loãng bằng dung môi đến nồng độ mong muốn.

1 µl dung dịch thành phần hoạt tính được tiêm vào bụng của 5 con tích cái trưởng thành đã no máu của ngựa (*Boophilus microplus*). Các con vật này được chuyển vào đĩa và giữ trong phòng kiểm soát khí hậu.

Hiệu quả được đánh giá sau 7 ngày bằng việc con tích đẻ ra các quả trứng nở được. Các quả trứng mà không thể hiện rõ là nở được thì sẽ được bảo quản trong khoang kiểm soát khí hậu đến khi nở ra ấu trùng sau khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% nghĩa là không con tích nào đẻ được trứng có thể nở được; 0% nghĩa là tất cả các trứng đều nở được.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 80% ở tỷ lệ sử dụng là 20 µg/động vật: I-21

Ctenocephalogenua felis - thử nghiệm qua đường miệng (CTECFE)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Đề tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 10 mg thành phần hoạt tính được phối trộn với 0,5 ml dimetyl sulphoxit. Pha loãng với máu ngựa xitrat hóa đến nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 con bọ chết mèo đã lớn (*Ctenocephalogenua felis*) bị bỏ đói được cho vào một khoang mà trên đỉnh và dưới đáy bị bịt kín bằng lưới thép. Một xylanh kim loại mà phần đáy bị bịt kín bằng parafilm được đặt lên trên khoang này. Xylanh này chứa máu/chế phẩm chứa thành phần hoạt tính, mà có thể hút bọ chết qua màng parafilm.

Sau 2 ngày, tỷ lệ diệt bọ chết % được xác định. 100% nghĩa là tất cả bọ chết đã bị giết; 0% nghĩa là không con bọ chết nào đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 90% ở tỷ lệ sử dụng là 100 ppm: I-21

Thử nghiệm trên Lucilia cuprina (LUCICU)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Đề tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 10 thành phần hoạt tính được phối trộn với 0,5 ml dimetyl sulphoxit, và nồng độ được pha loãng bằng nước đến nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 con ấu trùng L1 của ruồi trâu của cừu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào bình thử nghiệm chứa thịt ngựa băm nhỏ và chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả ấu trùng đã bị giết; 0% nghĩa là không có ấu trùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 100 ppm: I-18, I-2.

Thử nghiệm trên *Musca domestica* (MUSCDO)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 10 mg thành phần hoạt tính được phối trộn với 0,5 ml dimetyl sulphoxit, và nồng độ được pha loãng bằng nước đến nồng độ mong muốn.

10 con ruồi trong nhà (*Musca domestica*) được đưa vào bình phản ứng có miếng xốp được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn are populated with.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết tính theo % is được xác định. 100% nghĩa là all ruồi đã bị giết; 0% nghĩa là non ruồi đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 95% ở tỷ lệ sử dụng là 20 ppm: I-21.

Myzus persicae - thử nghiệm phun (MYZUPE)

Dung môi: 78 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi thu được nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa chứa lá bắp cải Trung quốc (*Brassica pekinensis*) mà bị nhiễm tất cả các giai đoạn của rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) được phun bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau 6 ngày, % hiệu quả được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết; 0% nghĩa là không có con rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-10, I-13, I-18, I-22, I-23, I-24, I-43, I-44, I-48, I-52

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 90% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-4, I-12, I-14, I-17, I-18, I-19, I-21, I-38, I-42, I-45, I-46, I-49, I-50, I-51, I-56, I-61, I-68

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 90% ở tỷ lệ sử dụng là 20 g/ha: I-39

Phaedon cochleariae - thử nghiệm phun (PHAECO)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa chứa lá bắp cải Trung quốc (*Brassica pekinensis*) được phun bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn và, sau khi làm khô, được thả ấu trùng bọ cánh cứng mù tạc (*Phaedon cochleariae*).

Sau 7 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả bọ cánh cứng ấu trùng đã bị giết; 0% nghĩa là không có con bọ cánh cứng ấu trùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-2, I-3, I-4, I-5, I-10, I-12, I-13, I-14, I-18, I-

19, I-21, I-22, I-24, I-25, I-26, I-28, I-29, I-31, I-36, I-37, I-38, I-39, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-61, I-68, I-73

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 83% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-30, I-63

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 100 g/ha: I-11

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 83% ở tỷ lệ sử dụng là 100 g/ha: I-17.

Spodoptera frugiperda - thử nghiệm phun (SPODFR)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa chứa lá ngô (*Zea mays*) được phun bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn và, sau khi làm khô, được thả sâu bướm của sâu xanh da láng (*Spodoptera frugiperda*).

Sau 7 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả sâu bướm đã bị giết; 0% nghĩa là không có con sâu bướm đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-2, I-21, I-26, I-37, I-39, I-42, I-46, I-47, I-54, I-61, I-63, I-68

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 83% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-14, I-19, I-48

Tetranychus urticae - thử nghiệm phun, kháng lai OP (TETRUR)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa chứa lá đậu (*Phazaelus vulgaris*) bị nhiễm tất cả các giai đoạn của nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) được phun bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau 6 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả nhện đỏ đã bị giết; 0% nghĩa là không có con nhện đỏ nào đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-68

trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 90% ở tỷ lệ sử dụng là 500 g/ha: I-2, I-13, I-19, I-22, I-28, I-42, I-44, I-53

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 90% ở tỷ lệ sử dụng là 100 g/ha: I-48

Myzus persicae - thử nghiệm phun (MYZUPE)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Nếu cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua, mỗi chất được bổ sung với nồng độ 1000 ppm vào dung dịch chế phẩm.

Cây ớt chuông (*Capsicum annuum*) bị nhiễm nghiêm trọng rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) được xử lý bằng cách phun với chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau 6 ngày, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết; 0% nghĩa là không con rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 97% ở tỷ lệ sử dụng là 100 ppm: I-11

Thử nghiệm trên *Meloidogyne incognita*

Dung môi: 125,0 phần trọng lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được phối trộn với lượng đã nêu của dung môi và nồng độ được pha loãng bằng nước đến nồng độ mong muốn.

Bình phản ứng được nạp cát, dung dịch thành phần hoạt tính, hỗn dịch trứng/ấu trùng của giun tròn gây sần rễ phương nam (*Meloidogyne incognita*) và hạt rau diếp. Hạt rau diếp nảy mầm và cây trồng phát triển. Các nốt sần phát triển trên rễ.

Sau 14 ngày, hiệu quả diệt giun tròn tính theo % được xác định nhờ sự hình thành nốt sần. 100% nghĩa là không tìm thấy nốt sần nào; 0% nghĩa là số nốt sần trên cây trồng xử lý được xử lý tương ứng với đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả là 100% ở tỷ lệ sử dụng là 20 ppm: I-68

Ví dụ so sánh:Myzus persicae - thử nghiệm tiếp xúc (MYZUPE c)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch sử dụng cuối cùng được pha loãng.

Cây ớt chuông một lá (*Capsicum annuum*) bị nhiễm nghiêm trọng rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) được xử lý bằng cách phun mặt dưới lá bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết và 0% nghĩa là không con rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

Myzus persicae – thử nghiệm di chuyển giữa các lá (MYZUPE t)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl

este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch thành phẩm được pha loãng.

Cây ớt chuông một lá (*Capsicum annuum*) bị nhiễm nghiêm trọng rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) được xử lý bằng cách phun lên mặt trên lá bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết và 0% nghĩa là không còn rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

Aphis gossypii – thử nghiệm tiếp xúc (APHIGO c)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch thành phẩm được pha loãng.

Cây bông một lá (*Gossypium hirsutum*) bị nhiễm nghiêm trọng rệp vùng cây bông (*Aphis gossypii*) được xử lý bằng cách phun mặt dưới lá bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết và 0% nghĩa là không có con rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

Aphis gossypii –thử nghiệm giữa các lá (APHIGO t)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch thành phẩm được pha loãng.

Cây bông một lá (*Gossypium hirsutum*) bị nhiễm nghiêm trọng cây bông rệp vùng (*Aphis gossypii*) được xử lý bằng cách phun mặt trên lá bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rệp vùng đã bị giết và 0% nghĩa là không con rệp vùng đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

Thử nghiệm trên Nephrotettix cincticeps (NEPHCI)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl

este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch thành phẩm được pha loãng.

Cây lúa gạo (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) được xử lý bằng cách phun với chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn và sau đó, được thả ấu trùng của rầy lá lúa xanh (*Nephotettix cincticeps*).

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ chết tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả rầy trên lá đã bị giết; 0% nghĩa là không có rầy trên lá đã bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các Ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

Thử nghiệm trên *Nilaparvata lugens* (NILALU)

Dung môi: 7 phần trọng lượng dimethylformamit

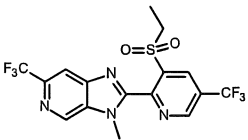
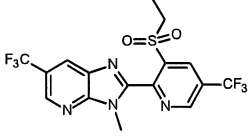
Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra dạng sử dụng phù hợp chứa thành phần hoạt tính, 1 phần trọng lượng thành phần hoạt tính được hòa tan bằng cách sử dụng các phần trọng lượng dung môi đã nêu và hòa vào nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm đến khi có nồng độ mong muốn. Để tạo ra nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa. Trong trường hợp cần bổ sung muối amoniac hoặc/và chất xuyên qua (metyl este của dầu hạt cải dầu), mỗi chất được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch thành phẩm được pha loãng.

Cây lúa gạo (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) được xử lý bằng cách phun với chế phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn và sau đó, được thả ấu trùng L3 của rầy nâu (*Nilaparvata lugens*).

Sau thời gian mong muốn, tỷ lệ tổn hại đến quá trình lớn tính theo % được xác định. 100% nghĩa là không phát hiện thấy tổn hại đến quá trình lớn; 0% nghĩa là tỷ lệ tổn hại đến quá trình lớn của cây được xử lý tương ứng với cây đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, hợp chất thu được từ các ví dụ điều chế sau thể hiện hiệu quả tốt so với hợp chất đã được nêu trong WO2013018928 (xem bảng):

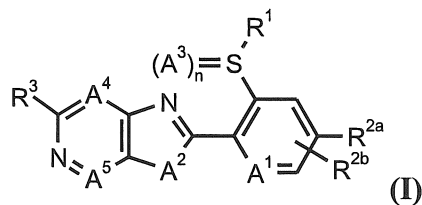
Chất	Cấu trúc	Loài động vật gây hại	Nồng độ	hiệu quả tính theo % số ngày sau khi xử lý*
Ví dụ I-21		MYZUPE c	2,4 g/ha	85 14 ngày sau khi xử lý
		MYZUPE t	12 g/ha	
		MYZUPE t	2,4 g/ha	98 14 ngày sau khi xử lý
		APHIGO c	2,4 g/ha	90 14 ngày sau khi xử lý
		APHIGO t	2,4 g/ha	
		NEPHCI	0,16 ppm	98 7 ngày sau khi xử lý
		NEPHCI	0,16 ppm	
		NEPHCI	0,16 ppm	65 7 ngày sau khi xử lý
		NILALU	4 ppm	90 14 ngày sau khi xử lý
		NILALU	4 ppm	95 21 ngày sau khi xử lý
Ví dụ 5 đã được biết đến trong WO2013018928		MYZUPE c	2,4 g/ha	50 14 ngày sau khi xử lý
		MYZUPE t	12 g/ha	
		MYZUPE t	2,4 g/ha	0 14 ngày sau khi xử lý
		APHIGO c	2,4 g/ha	0 14 ngày sau khi xử lý
		APHIGO t	2,4 g/ha	
		NEPHCI	0,16 ppm	15 7 ngày sau khi xử lý
		NEPHCI	0,16 ppm	
		NEPHCI	0,16 ppm	0 7 ngày sau khi xử lý
		NILALU	4 ppm	

		NILALU	4 ppm	0 14 ngày sau khi xử lý 0 21 ngày sau khi xử lý 0 34 ngày sau khi xử lý 35 21 ngày sau khi xử lý 20 28 ngày sau khi xử lý
--	--	--------	-------	---

*ngày = ngày sau khi xử lý (ngày)

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):



trong đó:

A¹ là nitơ (N) hoặc =C-H,

A² là -N-CH₃ hoặc oxy (O),

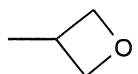
A³ là oxy,

A⁴ là nitơ (N) hoặc =C-H,

A⁵ là =C-H,

R¹ là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, triflorometyl, -CH₂-CH₂-F, -CH₂-CH₂-OH,

-(CH₂)₂-S-C₂H₅, -(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅ hoặc



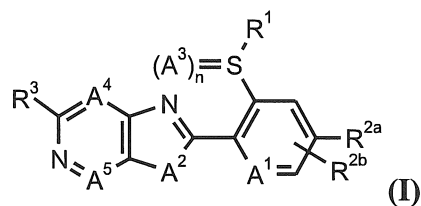
R^{2a} là hydro, triflorometyl, xyano, CONH₂, flo hoặc clo,

R^{2b} là hydro, clo, triflorometyl, metoxy hoặc NHCOCH₃,

R³ là pentafloroetyl, triflorometyl, clo, 4-CF₃(C₆H₄), 4-(CF₃)pyrazol-1-yl, 3-(CF₃)pyrazol-1-yl hoặc 4-(CF₃)imidazol-1-yl,

n là 0, 1 hoặc 2.

2. Hợp chất có công thức (I):



trong đó:

A^1 là nitơ (N) hoặc =C-H,

A^2 là -N-CH₃ hoặc oxy (O),

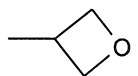
A^3 là oxy,

A^4 là nitơ (N) hoặc =C-H,

A^5 là =C-H,

R^1 là metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, triflorometyl, -CH₂-CH₂-F, -CH₂-CH₂-OH,

-(CH₂)₂-S-C₂H₅, -(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅ hoặc



R^{2a} là hydro, triflorometyl, xyano, CONH₂, flo hoặc clo,

R^{2b} là metoxy, etoxy hoặc NHCO-metyl,

R^3 là pentafloroetyl, triflorometyl, clo, 4-CF₃(C₆H₄), 4-(CF₃)pyrazol-1-yl,

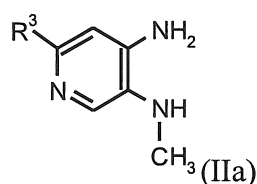
3-(CF₃)pyrazol-1-yl hoặc 4-(CF₃)imidazol-1-yl,

n là 0, 1 hoặc 2.

3. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n như được xác định theo điểm 1, và

R^{2b} là metoxy hoặc NHCOCH₃.

4. Chế phẩm hóa nông, khác biệt ở chỗ chế phẩm này chứa ít nhất là một hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt thông thường.
5. Phương pháp phi trị liệu để phòng trừ động vật gây hại, khác biệt ở chỗ hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm theo điểm 4 được đề tác dụng đến động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng, với điều kiện phương pháp phòng trừ động vật gây hại trên người bị loại trừ.
6. Hợp chất có công thức (IIa):



trong đó:

- R^3 là (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) haloalkylsulphinyl hoặc (C_1-C_4) haloalkylsulphonyl, trong đó R^3 không phải là CF_3 hoặc CHF_2 .
7. Hợp chất có công thức (IIa) theo điểm 6, trong đó:

R^3 là CH_2F , C_2H_4F , $C_2H_3F_2$, $C_2H_2F_3$, C_2HF_4 , C_2F_5 , $n-C_3F_7$, $i-C_3F_7$, OCH_2F , SCH_2F , $SOCH_2F$, SO_2CH_2F , $OCHF_2$, $SCHF_2$, $SOCHF_2$, SO_2CHF_2 , OCF_3 , OCF_2Cl , $OCFCl_2$, SCF_3 , $SOCF_3$, SO_2CF_3 , OC_2H_4F , SC_2H_4F , SOC_2H_4F , $SO_2C_2H_4F$, $OC_2H_3F_2$, $SC_2H_3F_2$, $SOC_2H_3F_2$, $SO_2C_2H_3F_2$, $OC_2H_2F_3$, $SC_2H_2F_3$, $SOC_2H_2F_3$, $SO_2C_2H_2F_3$, OC_2HF_4 , SC_2HF_4 , SOC_2HF_4 , $SO_2C_2HF_4$, OC_2F_5 , SC_2F_5 , SOC_2F_5 , $SO_2C_2F_5$, $n-OC_3F_7$, $n-SC_3F_7$, $n-SOC_3F_7$, $n-SO_2C_3F_7$, $i-OC_3F_7$, $i-SC_3F_7$, $i-SOC_3F_7$ hoặc $i-SO_2C_3F_7$.
 8. Hợp chất có công thức (IIa) theo điểm 6, trong đó:

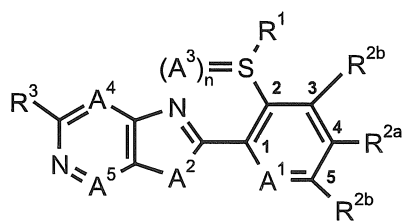
R^3 là CH_2F , OCF_3 , C_2H_4F , $C_2H_3F_2$, $C_2H_2F_3$, C_2HF_4 , C_2F_5 , SCF_3 , $SOCF_3$ hoặc SO_2CF_3 .

9. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó mỗi nhóm R^1 , R^{2a} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 và n như được xác định trong các Ví dụ từ I-1 đến I-77 trong bảng sau, với điều kiện A^3 là oxy:

Ví dụ	R^1	N	A^4	A^5	R^3	A^2	A^1	R^{2a}	R^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	3	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-27	oxetan-3-yl	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	5-Cl*

Vi dụ	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-40	oxetan-3-yl	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	CH	H	3-Cl*
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	CF ₃	H
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-metyl	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metyl	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metyl	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)pyrazol-1-yl	N-metyl	N	CF ₃	H

trong đó, trong bảng trên đây, R^{2b} được đánh dấu bằng “*” được gắn kết ở vị trí 3 hoặc 5 như được thể hiện trong công thức sau:



10. Hợp chất có công thức (II-02):

