(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) **1-0032289**

(51)[7] **C07D 401/14**; A01N 43/78; C07D 401/04; C07D 403/04; C07D 405/14; C07D 513/04; C07D 409/14; C07D 413/04; C07D 413/14; C07D 417/04; C07D 417/14; C07D 471/04; A01N 43/56; C07D 407/14

(13) **B**

(21) 1-2016-01039
(22) 09/09/2014
(86) PCT/US2014/054671 09/09/2014
(87) WO2015/038503 19/03/2015
(30) 61/877,329 13/09/2013 US
(45) 25/06/2022 411
(43) 27/06/2016 339A

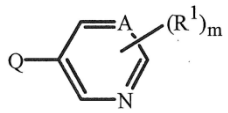
(73) FMC CORPORATION (US)
2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America

(72) CLARK, David, Alan (US); FRAGA, Breena, Gloriana (US); ZHANG, Wenming (CN).

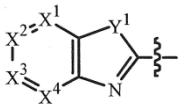
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) AZOL HAI VÒNG ĐƯỢC THẾ BẰNG DỊ VÒNG, CHẾ PHẨM VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ LOÀI GÂY HẠI KHÔNG XƯƠNG SỐNG VÀ HẠT GIỐNG ĐÃ ĐƯỢC XỬ LÝ

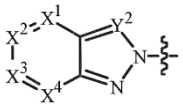
(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức 1, bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình và đồng phân lập thể, các N-oxit, và các muối của chúng, và A, R^1, m, X^1, X^2, X^3, X^4, Y^1, Y^2 và Y^3 là như được xác định trong phần mô tả. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 và phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế với lượng hữu hiệu sinh học.



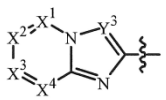
1



Q-1

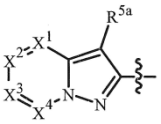


Q-2



Q-3

hoặc



Q-4

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các azol hai vòng được thế nhất định, các *N*-oxit, muối và các chế phẩm chứa chúng thích hợp đối với các ứng dụng nông nghiệp và phi nông nghiệp, và mô tả các phương pháp dùng chúng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống như các động vật chân đốt trong các môi trường nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

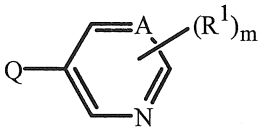
Việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống là vô cùng quan trọng để đạt được năng suất thu hoạch cao. Thiệt hại do các loài gây hại không xương sống gây ra đối với cây trồng đang sinh trưởng và nông sản trong quá trình bảo quản có thể làm giảm đáng kể năng suất và do đó dẫn đến tăng chi phí cho người tiêu dùng. Việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong lâm nghiệp, cây trồng nhà kính, cây cảnh, vườn ươm cây trồng, lương thực bảo quản và các sản phẩm sợi, gia súc, đồ gia dụng, bãi cỏ, các sản phẩm gỗ, và trong y tế cũng rất quan trọng. Nhiều sản phẩm đáp ứng được các mục đích này hiện có bán trên thị trường, nhưng vẫn cần có các hợp chất mới có hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, ít độc hơn, an toàn hơn đối với môi trường hoặc có các vị trí tác động khác nhau.

WO2013/106254 đề cập các hợp chất có hoạt tính trừ sâu có nhân hai vòng bao gồm vòng pyrazol đã được ngưng tụ với vòng phenyl, pyriđin hoặc pyrimiđin.

EP-A2274983 đề cập đến các hợp có hoạt tính trừ động vật chân khớp có nhân hai vòng bao gồm vòng oxazol đã được ngưng tụ với vòng phenyl, pyriđin hoặc pyrimiđin.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

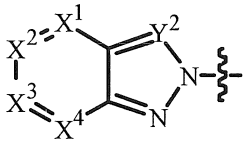
Sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình và đồng phân lập thể), các N-oxit, và các muối của chúng, và các chế phẩm chứa chúng và mô tả việc dùng chúng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống:



1

trong đó:

Q là hợp chất có công thức:



Q-2

A là CH, CR^1 hoặc N;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, C_1-C_4 alkylthio hoặc C_1-C_4 haloalkylthio;

m bằng 0, 1, 2 hoặc 3;

X^1 là CR^2, và mỗi X^2, X^3 và X^4 độc lập là CR^3; hoặc X^2 là CR^2, và mỗi X^1, X^3 và X^4 độc lập là CR^3;

R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$, $N(R^8)C(=Z)R^9$, $C(=NR^{10})R^{11}$ hoặc Q^a;

mỗi Z độc lập là O hoặc S;

mỗi R^3 độc lập là H, halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy hoặc C_1-C_4 haloalkoxy; Y^2 là CR^{5a};

R^{5a} là H, halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy hoặc C_1-C_4 haloalkoxy;

R^6 là H, $NR^{15}R^{16}$, OR^{17}, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R^7 là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc

R^6 và R cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 10 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng tối đa 4 R^x; hoặc

R^6 và R^7 cùng nhau là $=S(O)_pR^{18}R^{19}$ hoặc $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy, C_3-C_6 xycloalkoxy, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $OC(O)R^{22}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$ $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$, $Si(R^{28})_3$, $OSi(R^{28})_3$ hoặc Q^b;

R^8 là H, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R^9 là H, $C(=NR^{10})R^{11}$, OR^{21} hoặc $NR^{15}R^{16}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc phenyl, phenoxy hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc vòng không

thơm dị vòng có 3 tơi 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 1 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; mỗi R^{10} độc lập là OR^{12}, $S(O)_nR^{13}$ hoặc NHR^{14};

mỗi R^{11} độc lập là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗinhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy, C_3-C_6 xycloalkoxy, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$, $C(O)R^{22}$ hoặc Q^b;

mỗi R^{12} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{13}$ hoặc Q^b; mỗi R^{13} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{14} là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$ hoặc $C(O)OR^{21}$; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{15} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{27}$ hoặc $S(O)_2R^{27}$; hoặc phenyl hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{16} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc

R^{15} và R^{16} cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 7 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử

cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

R^{17} là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{18} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{19} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{18} và R^{19} cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào để tạo ra vòng;

R^{20} là H, xyano, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl hoặc $C(O)R^{22}$; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{21} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{22} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần

tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_6 haloxycloalkyl, C_3-C_6 xycloalky- lalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkylalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1-C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} một cách độc lập cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 7 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{27} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy hoặc $NR^{29}R^{30}$; hoặc phenyl hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4

haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{28} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R^{29} độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{30} độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{29} và R^{30} cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 10 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

Q^a là hệ vòng hoặc vòng thơm có 5 tới 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc vòng no một phần có 3 tới 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên

tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh hoặc vòng không thơm dị vòng có 3 tơi 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng. Theo một phương án, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất các chế phẩm phun để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, hoặc chế phẩm nêu trên, và tác nhân đẩy. Sáng chế cũng đề xuất các chế phẩm làm mồi để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit

hoặc muối của nó, hoặc chế phẩm đã được mô tả theo các phương án nêu trên, một hoặc nhiều chất làm thức ăn, tùy ý chất dẫn dụ, và tùy ý chất làm ẩm.

Sáng chế cũng đề xuất các dụng cụ bẫy để phòng trừ loài gây hại không xương sống gồm chế phẩm làm mồi nêu trên và hộp đựng được làm thích ứng để chứa chế phẩm làm mồi nêu trên, trong đó hộp này có ít nhất một lỗ hổng được định cỡ để cho phép loài gây hại không xương sống lọt qua lỗ hổng này khiến cho loài gây hại không xương sống có thể tiếp cận với chế phẩm làm mồi nêu trên từ một vị trí bên ngoài thân, và trong đó hộp này cũng được làm thích ứng để đặt trong hoặc gần với khu vực hoạt động đã biết hoặc có thể có loài gây hại không xương sống.

Sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó tiếp xúc với hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong Bản mô tả này) với lượng hữu hiệu sinh học, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp trị liệu để điều trị cho cơ thể người hoặc động vật.. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp như vậy mà trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó được cho tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó với lượng hữu hiệu sinh học, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn gồm một lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho hạt giống này tiếp xúc với hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong Bản mô tả này) với lượng hữu hiệu sinh học. Sáng chế cũng đề cập đến hạt giống đã được xử lý này. Sáng chế cũng mô tả việc bảo vệ động vật khỏi loài gây hại ký sinh trùng không xương sống bao gồm việc cho động vật này dùng hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong Bản mô tả này) với lượng hữu hiệu diệt trừ ký sinh trùng. Sáng chế cũng mô

tả việc dùng hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong Bản mô tả này) để dùng chi việc bảo vệ động vật khỏi loài gây hại không xương sống.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm việc cho cây trồng, hạt giống để trồng cây trồng này hoặc khu vực (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của cây trồng tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong Bản mô tả này) với lượng hữu hiệu sinh học.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả này, các thuật ngữ "bao gồm", "chứa", "có", "mang", "đặc trưng bởi" hoặc biến thể khác bất kỳ của chúng, được dự định để bao hàm phương án không mang tính loại trừ, tùy thuộc vào giới hạn được chỉ ra một cách rõ ràng. Ví dụ, chế phẩm, hỗn hợp, quy trình, phương pháp mà bao gồm một số phần tử thì nó không nhất thiết chỉ giới hạn ở các phần tử này mà có thể bao gồm các phần tử khác được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có đối với chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp này.

Thuật ngữ "bao gồm" không gồm phần tử, bước hoặc thành phần bất kỳ không được quy định. Nếu trong yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ này có thể khoanh vùng giới hạn yêu cầu bảo hộ để bao gồm các chất khác với chất được nêu trừ các tạp chất liên quan với chúng. Thuật ngữ "bao gồm" thể hiện một mệnh đề của yêu cầu bảo hộ, chứ không phải trong phần mở đầu, nó chỉ giới hạn yếu tố được chỉ ra trong mệnh đề này; các yếu tố khác không bị giới hạn từ toàn bộ yêu cầu bảo hộ này.

Thuật ngữ "chủ yếu gồm" được dùng để xác định chế phẩm hoặc phương pháp mà bao gồm các chất, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các nguyên tố, ngoài các loại đã được mô tả cụ thể, còn bao gồm các chất, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các nguyên tố bổ sung không ảnh hưởng tới các đặc tính mới và cơ bản của sáng chế được yêu cầu bảo hộ. Thuật ngữ "chủ yếu gồm" nằm trung gian giữa "chứa" và "bao gồm".

Nếu sáng chế hoặc một phần của nó được xác định bằng thuật ngữ mở như "bao gồm", thì dễ dàng hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả này sẽ mô tả sáng chế bằng cách sử dụng các thuật ngữ "chủ yếu gồm" hoặc "gồm có".

Hơn nữa, trừ khi có quy định khác, thuật ngữ "hoặc" được dùng để chỉ hoặc bao hàm chứ không phải hoặc loại trừ. Ví dụ, điều kiện "A hoặc B" được thoả mãn bởi trường hợp bất kỳ sau: A đúng (hoặc có mặt) và B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Ngoài ra, các mạo từ không xác định "một" đứng trước phần tử hoặc thành phần theo sáng chế không bị giới hạn để chỉ một số trường hợp (có nghĩa là biến cố) của phần tử hoặc thành phần này. Vì vậy "một" phải được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của phần tử hoặc thành phần cũng dùng để chỉ cả số nhiều trừ khi số này có nghĩa rõ ràng là số ít.

Trong bản mô tả này, thuật ngữ "loài gây hại không xương sống" bao gồm loài chân khớp, loài chân bụng và giun tròn gây ảnh hưởng về mặt kinh tế như các loài gây hại. Thuật ngữ "loài chân khớp" bao gồm côn trùng, bét, nhện, bọ cạp, rết, loài nhiều chân, rệp tròn và loài chân rết. Thuật ngữ "loài chân bụng" bao gồm ốc sên, sên và các loài thuộc bộ ốc cạn (Stylommatophora) khác. Thuật ngữ "giun tròn" bao gồm tất cả các loài giun sán như: giun tròn, giun hình tim, và giun tròn ăn thực vật (Nematoda), sán lá (Tematoda), Acanthocephala, và sán xơ mít (Cestoda).

Trong bản mô tả này "phòng trừ loài gây hại không xương sống" nghĩa là ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (bao gồm tỷ lệ tử vong, làm giảm ăn đáng kể và/hoặc phá vỡ giao cấu; các biểu hiện có liên quan được xác định tương tự.

Thuật ngữ "nông nghiệp" được dùng để chỉ việc trồng cây trên cánh đồng dùng làm lương thực và sợi và bao gồm sự sinh trưởng của ngô, đậu tương và các cây họ đậu khác, lúa, ngũ cốc (ví dụ, lúa mỳ, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, lúa, ngô), các loại rau lấy lá (ví dụ, rau diếp, cải bắp, và các cây cuộn lá khác), các loại rau lấy quả (ví dụ, cà chua, hồ tiêu, cà, cải bắp và bầu bí), khoai tây, khoai tây

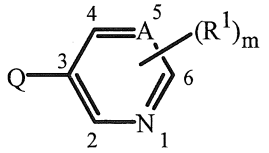
ngọt, nho, bông, các cây ăn quả (ví dụ, táo, quả hột cứng và cam quýt), quả nhỏ (trứng cá, anh đào) và cây trồng đặc sản khác (ví dụ, cây cải dầu, cây hướng dương, oliu).

Thuật ngữ "phi nông nghiệp" được dùng để chỉ các cây trồng trong vườn khác (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây cảnh không trồng ngoài đồng), các công trình thương mại và nhà ở thành phố và các khu công nghiệp, lớp đất mặt (trong lĩnh vực thương mại, sân gôn, nhà ở, khu vui chơi giải trí, v.v.), các sản phẩm gỗ, sản phẩm bảo quản trong nông lâm nghiệp và các ứng dụng trong lĩnh vực y tế (người) và thú y (vật nuôi cảnh, gia súc, gia cầm, các động vật không thuần hoá như động vật hoang dại).

Thuật ngữ "sức sống cây trồng" được dùng để chỉ tỷ lệ sinh trưởng hoặc mức độ tích tụ sinh khối của cây trồng. Thuật ngữ "tăng sức sống" được dùng để chỉ sự gia tăng về sự sinh trưởng hoặc sự tích tụ sinh khối trên một cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý. Thuật ngữ "năng suất cây trồng" được dùng để chỉ hoa lợi của cây trồng, về cả chất lượng lẫn số lượng, thu được sau khi thu hoạch cây trồng. Thuật ngữ "tăng năng suất cây trồng" được dùng để chỉ sự gia tăng về năng suất cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý.

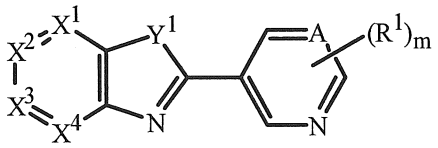
Thuật ngữ "lượng hữu hiệu sinh học" được dùng để chỉ lượng hợp chất có hoạt tính sinh học (ví dụ, hợp chất có công thức 1) đủ để tạo ra tác dụng sinh học mong muốn khi được áp dụng cho (tức là, tiếp xúc với) loài gây hại không xương sống cần được phòng trừ hoặc môi trường sống của nó, hoặc thực vật, hạt giống để trồng thực vật này, hoặc khu vực có thực vật (ví dụ, môi trường sinh trưởng) để bảo vệ cho thực vật không bị gây hại bởi loài gây hại không xương sống hoặc cho tác dụng được mong muốn khác (ví dụ, tăng sức sống của thực vật).

Vị trí của biến R^1 trong cấu trúc của công thức 1 được mô tả theo hệ thống đánh số được thể hiện dưới đây.



1

Đường lượn sóng trong một đoạn cấu trúc biểu thị điểm gắn kết của đoạn này với phần còn lại của phân tử. Ví dụ, khi biến Q trong công thức 1 được xác định là Q-1 (không yêu cầu bảo hộ), thì việc đường lượn sóng chia đôi liên kết trong Q-1 có nghĩa là Q-1 được gắn vào phần còn lại của cấu trúc có công thức 1 ở vị trí này, như được thể hiện dưới đây.



Trong cấu trúc Q-2, các biến X^1, X^2, X^3 và X^4 được xác định như được thể hiện trong bảng dưới.

Sự kết hợp	X^1	X^2	X^3	X^4
1	CR^2	CR^3	CR^3	CR^3
5	CR^3	CR^2	CR^3	CR^3

Trong các phần mô tả nêu trên, thuật ngữ "alkyl", được dùng riêng biệt hoặc trong hợp chất như "alkylthio" hoặc "haloalkyl" bao gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như, metyl, etyl, *n*-propyl, *i*-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl, pentyl hoặc hexyl khác nhau. Thuật ngữ "alkenyl" bao gồm các alken mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, và các chất đồng phân butenyl, pentenyl và hexenyl khác nhau. Thuật ngữ "alkenyl" cũng bao gồm các polyen như 1,2-propađienyl và 2,4-hexađienyl. Thuật ngữ "alkynyl" gồm các alkyn mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl và các chất đồng phân butynyl, pentynyl và hexynyl khác nhau. Thuật ngữ "alkynyl" cũng có thể bao gồm các gốc có các liên kết ba như 2,5-hexađiynyl.

Thuật ngữ "alkoxy" bao gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy và các chất đồng phân butoxy, pentoxy và hexyloxy khác nhau. Thuật ngữ "alkylthio" bao gồm các gốc alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metylthio, etylthio, và các chất đồng phân propylthio, butylthio, pentylthio và hexylthio khác nhau.

Thuật ngữ "xycloalkyl" bao gồm, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl.

Thuật ngữ "halogen", được sử dụng riêng biệt hoặc trong từ kết hợp như "haloalkyl" hoặc khi được sử dụng trong bản mô tả như "alkyl được thế bằng halogen" bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Hơn nữa, khi được sử dụng trong từ kết hợp như "haloalkyl" hoặc khi được sử dụng trong bản mô tả như "alkyl được thế bằng halogen", alkyl có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau. Ví dụ về "haloalkyl" hoặc "alkyl được thế bằng halogen" bao gồm F_3C-, $ClCH_2$-, CF_3CH_2- và CF_3CCl_2-. Các thuật ngữ "haloxycloalkyl", "haloalkoxy", "haloalkylthio", "haloalkenyl", "haloalkynyl", và tương tự, được định nghĩa tương tự như thuật ngữ "haloalkyl". Các ví dụ về "haloalkoxy" bao gồm CF_3O-, CCl_3CH_2O-, $HCF_2CH_2CH_2O$- và CF_3CH_2O-. Các ví dụ về "haloalkylthio" bao gồm CCl_3S-, CF_3S-, CCl_3CH_2S- và $ClCH_2CH_2CH_2S$-.

Các chữ viết tắt hóa học S(O) và S(=O) khi được sử dụng trong bản mô tả này chỉ gốc sulfinyl. Các chữ viết tắt hóa học SO_2, $S(O)_2$ và $S(=O)_2$ khi được sử dụng trong bản mô tả này chỉ gốc sulfonyl. Các chữ viết tắt hóa học C(O) và C(=O) khi được sử dụng trong bản mô tả này chỉ gốc carbonyl. Các chữ viết tắt hóa học CO_2, C(O)O và C(=O)O khi được sử dụng trong bản mô tả này chỉ gốc oxycarbonyl. Thuật ngữ "CHO" khi được sử dụng trong bản mô tả này chỉ formyl.

Tổng số lượng nguyên tử cacbon trong phần tử thế được biểu thị bằng tiền tố "C_i-C_j" trong đó i và j là các số nằm trong khoảng từ 2 đến 6. Ví dụ, C_1-C_4 alkylsulfonyl biểu thị metylsulfonyl tới butylsulfonyl; C_2 alkoxyalkyl biểu thị CH_3OCH_2-; C_3 alkoxyalkyl biểu thị, ví dụ, $CH_3CH(OCH_3)$-, $CH_3OCH_2CH_2$- hoặc $CH_3CH_2OCH_2$-; và C_4 alkoxyalkyl biểu thị các chất đồng phân khác nhau của nhóm alkyl được thế bằng nhóm alkoxy chứa tổng cộng bốn nguyên tử cacbon, các ví dụ bao gồm $CH_3CH_2CH_2OCH_2$- và $CH_3CH_2OCH_2CH_2$-.

Khi một hợp chất được thế bằng phần tử thế mang một chỉ số dưới thì có nghĩa là số lượng phần tử thế có thể lớn hơn 1, các phần tử thế (nếu lớn hơn 1) độc lập được chọn từ nhóm các phần tử thế đã được xác định, ví dụ, $(R^1)_m$, m bằng 0,

1, 2 hoặc 3. Hơn nữa, khi chỉ số dưới này biểu thị một khoảng, ví dụ, $(R)_{i-j}$, thì khi đó số lượng phần tử thế có thể được chọn trong số các số nguyên nằm trong khoảng từ i đến j kể cả hai đầu mút. Khi một nhóm chứa phần tử thế mà có thể là hyđro, ví dụ R^3 hoặc R^4, thì khi phần tử thế này là hyđro, điều sẽ được ghi nhận là tương đương với trường hợp không được thế. Khi một nhóm biến được chỉ ra là tùy ý được gắn vào một vị trí, ví dụ, $(R^1)_m$ trong đó m có thể bằng 0, thì hyđro có thể nằm ở cả vị trí không được xác định trong nhóm biến. Khi một hoặc nhiều vị trí trên một nhóm được chỉ ra "không được thế" hoặc "không được thế", thì các nguyên tử hyđro được gắn vào nhận hóa trị tự do bất kỳ.

Trừ khi có quy định khác, thuật ngữ "vòng" hoặc "hệ vòng" khi là một thành phần của công thức 1 (ví dụ, phần tử thế Q^a) chỉ vòng cacbon hoặc dị vòng. Thuật ngữ "hệ vòng" chỉ hai hoặc nhiều vòng được nối với nhau. Các thuật ngữ "hệ vòng hai vòng" và "hệ vòng hai vòng được ngưng tụ" chỉ hệ vòng cấu thành từ hai vòng được nối với nhau, nó có thể là hệ vòng "được ngưng tụ ortho", "hai vòng được liên kết cầu" hoặc "hai vòng spiro". Thuật ngữ "hệ vòng hai vòng được ngưng tụ ortho" chỉ hệ vòng trong đó hai vòng cấu thành có hai nguyên tử liền kề thông thường. "Hệ vòng hai vòng được liên kết cầu" được tạo ra bởi việc liên kết một đoạn gồm một hoặc nhiều nguyên tử với các thành viên vòng không liên kề của vòng. "Hệ vòng hai vòng spiro" được tạo ra bởi việc liên kết một đoạn gồm hai hoặc nhiều nguyên tử với cùng một thành viên vòng của vòng. Thuật ngữ "hệ vòng hai vòng dị vòng được ngưng tụ" chỉ hệ vòng hai vòng được ngưng tụ trong đó ít nhất một nguyên tử trên vòng không phải là nguyên tử cacbon. Thuật ngữ "thành viên vòng" được dùng để chỉ nguyên tử hoặc một gốc khác (ví dụ, C(=O), C(=S), S(O) hoặc $S(O)_2$) tạo ra mạch chính của vòng hoặc hệ vòng.

Các thuật ngữ "vòng cacbon" hoặc "hệ vòng cacbon" chỉ vòng hoặc hệ vòng trong đó các nguyên tử tạo ra mạch chính của vòng chỉ được chọn từ cacbon. Các thuật ngữ "vòng dị vòng", "dị vòng" hoặc "hệ vòng dị vòng" chỉ vòng hoặc hệ vòng trong đó ít nhất một nguyên tử tạo ra mạch chính của vòng không phải là cacbon, ví dụ nitơ, oxy hoặc lưu huỳnh. Thông thường vòng dị vòng chứa không

nhiều hơn 4 nguyên tử nitơ, không nhiều hơn 2 nguyên tử oxy và không nhiều hơn 2 nguyên tử lưu huỳnh. Trừ khi có quy định khác, vòng cacbon hoặc vòng dị vòng có thể là bão hòa hoặc không bão hòa. Thuật ngữ "bão hòa" được dùng để chỉ vòng có mạch chính cấu thành từ các nguyên tử được liên kết với với nhau bởi các liên kết đơn; trừ khi có quy định khác, các hóa trị của nguyên tử còn lại được chiêm giữ bởi các nguyên tử hyđro. Trừ khi có quy định khác, "vòng không bão hòa" có thể là không bão hòa một phần hoặc không bão hòa hoàn toàn. Thuật ngữ "không bão hòa hoàn toàn" chỉ nguyên tử trên vòng trong đó các liên kết giữa các nguyên tử trên vòng là các liên kết đơn hoặc đôi tùy thuộc vào nguyên tắc liên kết hóa trị và hơn thế nữa các liên kết giữa các nguyên tử trên vòng bao gồm nhiều liên kết đôi tới mức có thể mà không liền kề nhau (tức là, không phải là C=C=C hoặc C=C=N). Thuật ngữ "vòng bão hòa một phần" chỉ vòng bao gồm ít nhất một thành viên vòng được liên kết với thành viên vòng liền kề thông qua một liên kết đôi và về mặt lý thuyết có khả năng chứa đựng một số lượng liên kết đôi không liền kề nhau giữa các thành viên vòng liền kề (tức là, ở dạng không bão hòa hoàn toàn của nó) lớn hơn số lượng liên kết có mặt (tức là ở dạng không bão hòa một phần).

Trừ khi có quy định khác, các hệ vòng và vòng dị vòng có thể được gắn vào thông qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có thể có bất kỳ bởi việc thay thế nguyên từ hyđro trên nguyên tử cacbon hoặc nitơ này.

Thuật ngữ "thơm" được dùng để chỉ rằng mỗi trong số các nguyên tử của vòng về cơ bản là nằm trên cùng một mặt phẳng và có quy đạo *p* vuông góc với mặt phẳng vòng, và có (4n + 2) điện tử π, trong đó n là một số nguyên dương, được gắn kết với vòng này để thỏa mãn quy tắc Huckel. Thuật ngữ "hệ vòng thơm" được dùng để chỉ hệ vòng vòng cacbon hoặc hệ vòng dị vòng trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là thơm. Khi một vòng cacbon không bão hòa hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Huckel, thì vòng này còn được gọi là "vòng thơm" hoặc "vòng cacbon thơm".

Thuật ngữ "hệ vòng cacbon thơm" chỉ hệ vòng cacbon trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là thơm. Khi một vòng dị vòng không bão hòa hoàn toàn

thỏa mãn quy tắc Huckel, thì vòng này còn được gọi là "vòng dị thơm", "vòng dị vòng thơm" hoặc "vòng thơm dị vòng". Thuật ngữ "hệ vòng dị vòng thơm" chỉ hệ vòng dị vòng trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là thơm. Thuật ngữ "hệ vòng không thơm" chỉ hệ vòng cacbon hoặc hệ vòng dị vòng có thể bão hòa hoàn toàn, cũng như không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn, với điều kiện không một vòng nào trong số các vòng trong hệ vòng này là thơm. Thuật ngữ "hệ vòng cacbon không thơm" chỉ vòng cacbon trong đó không có vòng nào trong hệ vòng này là thơm. Thuật ngữ "hệ vòng dị vòng không thơm" chỉ hệ vòng dị vòng trong đó không có vòng nào trong hệ vòng này là thơm.

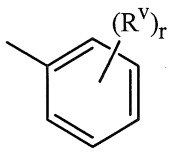
Thuật ngữ "tùy ý được thế" liên quan tới các vòng dị vòng dùng để chỉ các nhóm không được thế hoặc có ít nhất một phần tử thế không phải là hyđro mà nó không làm mất đi hoạt tính sinh học có được bởi chất tương tự không được thế. Khi được sử dụng trong bản mô tả, các định nghĩa sau có thể được áp dụng trừ khi có quy định khác được chỉ ra cụ thể. Thuật ngữ "tùy ý được thế" được sử dụng hoán đổi với thuật ngữ "được thế hoặc không được thế" hoặc với thuật ngữ "không được thế". Trừ khi có quy định khác, nhóm đã được thế tùy ý có thể có phần tử thế ở mọi vị trí có thể thế được của nhóm này, và mỗi phần tử thế này là độc lập với phần tử thế khác.

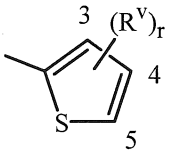
Khi phần tử thế là vòng dị vòng chứa nitơ có 5 hoặc 6 cạnh, thì nó có thể được gắn vào phần còn lại của công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bất kỳ trên vòng, trừ khi có quy định khác được chỉ ra cụ thể. Như nêu trên, Q^a có thể là (trong đó, có loại khác) phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm các phần tử thế như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về phenyl tùy ý được thế bằng một tới năm phần tử thế được minh họa là vòng có công thức U-1 trong Tập hợp 1, trong đó R^V là R^x như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^a và r là một số nguyên nằm trong khoảng từ 0 tới 5.

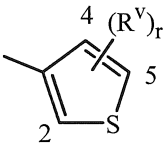
Như nêu trên, Q^b có thể là (trong đó, có loại khác) vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm các phần tử thế như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Các

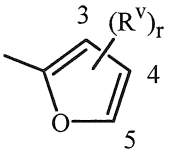
ví dụ về vòng dị vòng thơm không bão hòa có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế bao gồm các vòng có công thức U-2 tới U-61 được minh họa trong Tập hợp 1 trong đó R^V là phần tử thế bất kỳ như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^b và r là một số nguyên nằm trong khoảng từ 0 tới 4, được giới hạn bởi số lượng vị trí có thể có trên mỗi nhóm U. Do U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 và U-43 chỉ có duy nhất một vị trí sẵn có, nên đối với các nhóm U này r bị giới hạn ở các số nguyên 0 hoặc 1, và r bằng 0 có nghĩa là nhóm U không được thế và nguyên tử hyđro có mặt ở vị trí được ký hiệu bởi $(R^V)_r$.

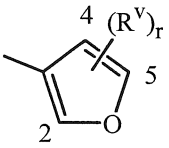
<u>Tập hợp 1</u>

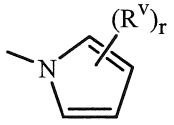

U-1 ,

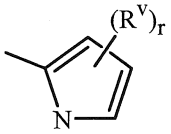

U-2 ,

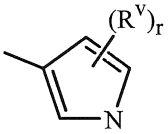

U-3 ,

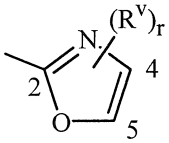

U-4 ,

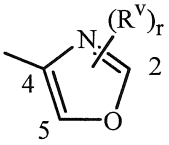

U-5 ,

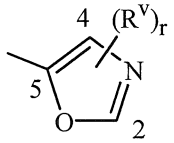

U-6 ,

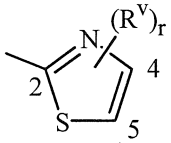

U-7 ,

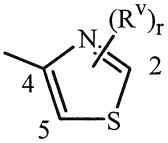

U-8 ,

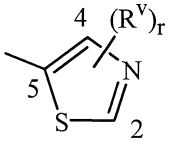

U-9 ,

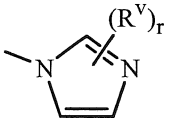

U-10 ,

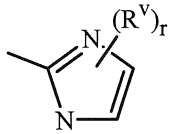

U-11 ,

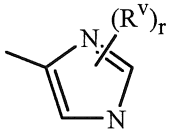

U-12 ,

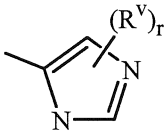

U-13 ,

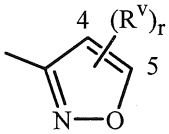

U-14 ,

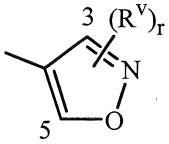

U-15 ,

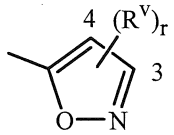

U-16 ,

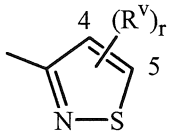

U-17 ,

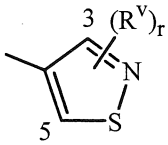

U-18 ,

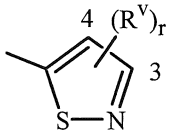

U-19 ,

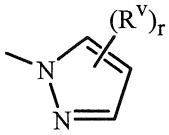

U-20 ,

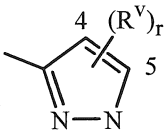

U-21 ,

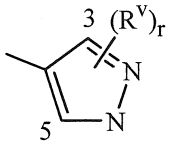

U-22 ,

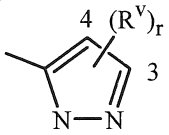

U-23 ,

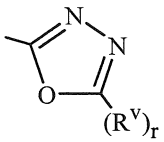

U-24 ,

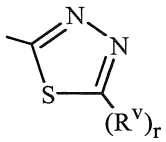

U-25 ,

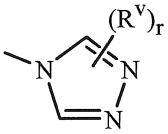

U-26 ,

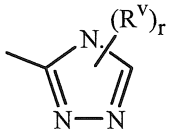

U-27 ,

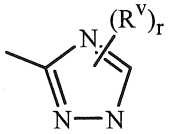

U-28 ,

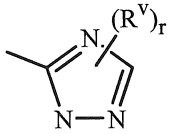

U-29 ,

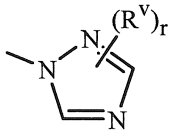

U-30 ,

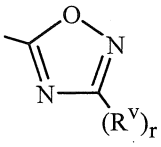

U-31 ,

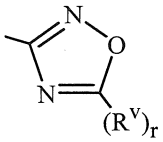

U-32 ,

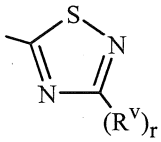

U-33 ,

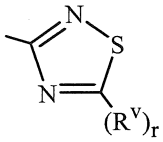

U-34 ,

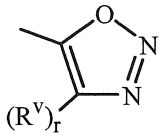

U-35 ,

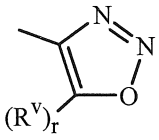

U-36 ,

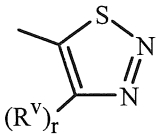

U-37 ,

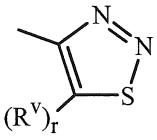

U-38 ,

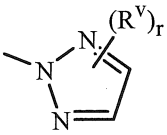

U-39 ,

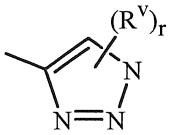

U-40 ,

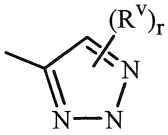

U-41 ,

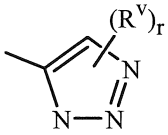

U-42 ,

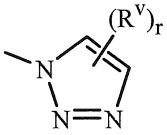

U-43 ,

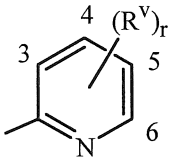

U-44 ,

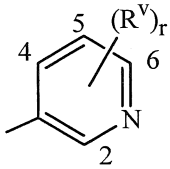

U-45 ,

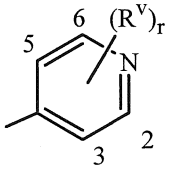

U-46 ,

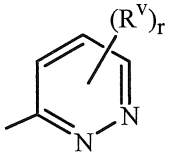

U-47 ,

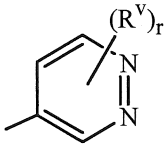

U-48 ,

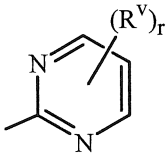

U-49 ,

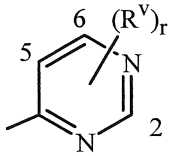

U-50 ,

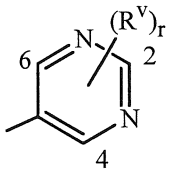

U-51 ,

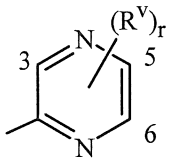

U-52 ,

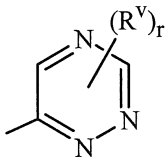

U-53 ,

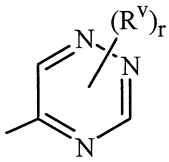

U-54 ,

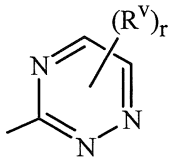

U-55 ,

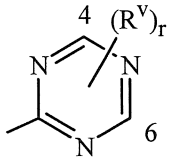

U-56 ,


U-57 ,


U-58 ,

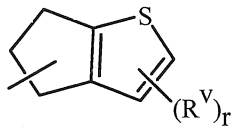

U-59 ,

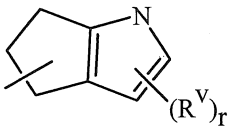

U-60 và

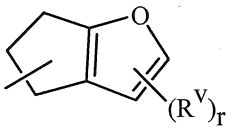

U-61 .

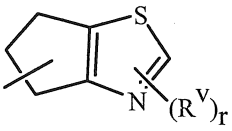
Như nêu trên, Q^a có thể là (trong đó, có loại khác) hệ vòng hai vòng được ngưng tụ ortho có 8, 9 hoặc 10 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm các phần tử thế như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Các ví dụ về hệ vòng hai vòng được ngưng tụ ortho có 8, 9 hoặc 10 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế bao gồm các vòng U-81 tới U-123 được minh họa trong Tập hợp 3 trong đó R^V là phần tử thế bất kỳ như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^a, và R thường là một số nguyên nằm trong khoảng từ 0 tới 4.

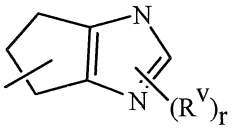
Tập hợp 3

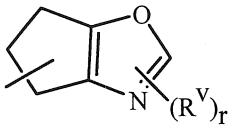

U-81

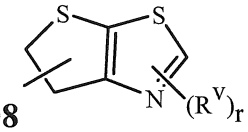

U-82

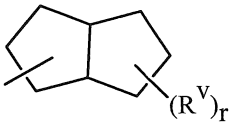

U-83

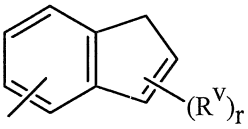

U-84

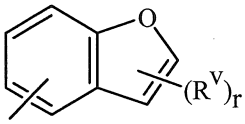

U-85

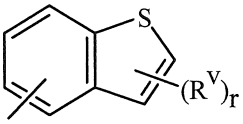

U-86

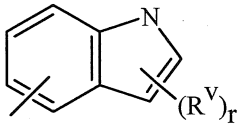

U-87

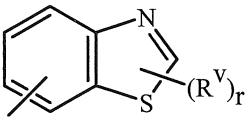

U-88

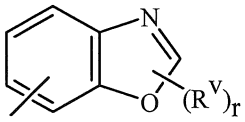

U-89

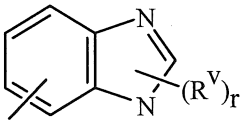

U-90

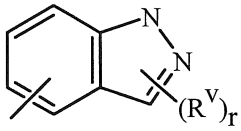

U-91

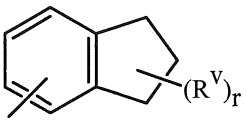

U-92

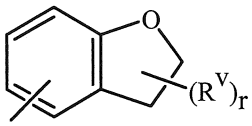

U-93

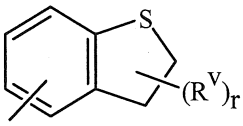

U-94

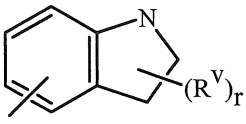

U-95

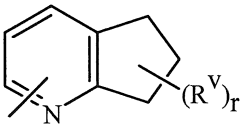

U-96

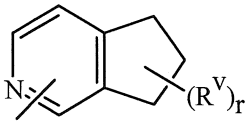

U-97

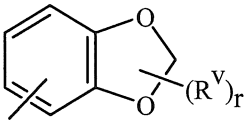

U-98

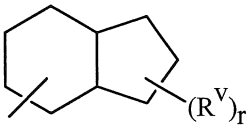

U-99

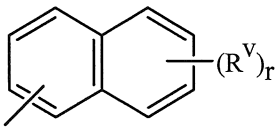

U-100

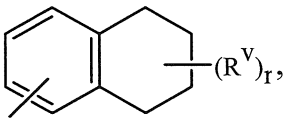

U-101

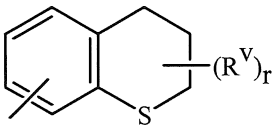

U-102

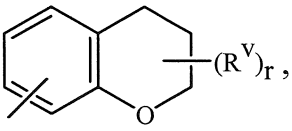

U-103

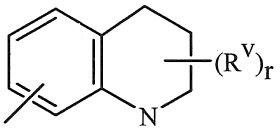

U-104

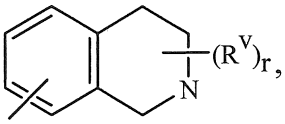

U-105

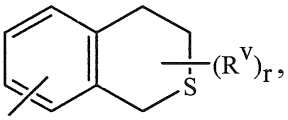

U-106

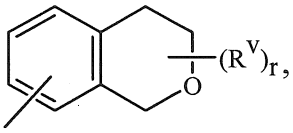

U-107

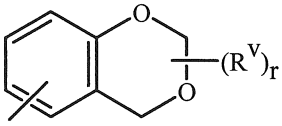

U-108

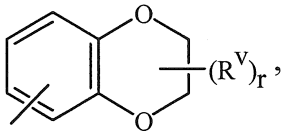

U-109

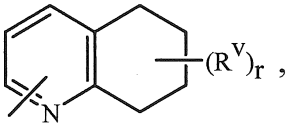

U-110

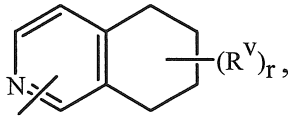

U-111

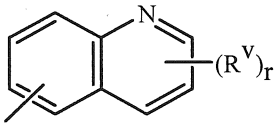

U-112

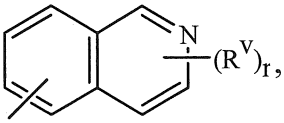

U-113

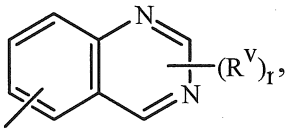

U-114

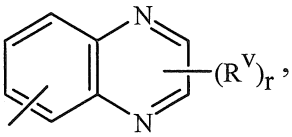

U-115

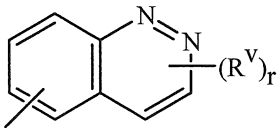

U-116

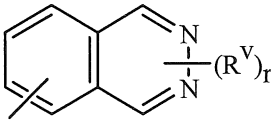

U-117


U-118

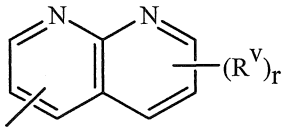

U-119


U-120


U-121


U-122

và


U-123

Mặc dù các nhóm R^V được thể hiện trong các cấu trúc U-1 tới U-123, song cần lưu ý rằng chúng không nhất thiết phải có mặt do chúng là các phần tử thế tùy ý. Lưu ý rằng nếu R^V là H khi được gắn vào một nguyên tử, thì sẽ trường hợp giống như trường hợp nguyên tử này không được thế. Các nguyên tử nitơ đòi hỏi việc thế để đáp ứng đủ hóa trị của chúng là được thế bằng H hoặc R^V. Lưu ý rằng khi điểm gắn giữa $(R^V)_r$ và nhóm U được minh họa dưới dạng di động, thì $(R^V)_r$ có thể được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử nitơ có sẵn bất kỳ của nhóm U này. Lưu ý rằng khi điểm gắn trên nhóm U được minh họa dưới dạng di động, thì nhóm U này có thể được gắn vào phần còn lại của công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bất kỳ của nhóm U này bởi việc thay thế nguyên tử hyđro. Lưu ý rằng một số nhóm U chỉ có thể thế được bằng dưới 4 nhóm R^V (ví dụ, U-2 tới U-5, U-7 tới qua U-48, và U-52 tới U-61).

Nhiều phương pháp tổng hợp khác nhau đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này để cho phép điều chế các vòng và các hệ vòng dị vòng thơm và không thơm; để đánh giá tổng quan, xem bộ ấn phẩm tám tập: *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 và bộ ấn phẩm mười hai tập: *Comprehensive Heterocyclic*

Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Các hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân lập thể. Các chất đồng phân lập thể là các chất đồng phân có thành phần giống nhau nhưng khác nhau về sự bố trí các nguyên tử của chúng trong không gian và bao gồm các chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân cis-trans (còn được gọi là chất đồng phân hình học) và chất đồng phân atropi. Chất đồng phân atropi có được do sự quay hạn chế quanh các liên kết đơn nơi mà hàng rào cản quay là đủ lớn để cho phép phân lập các chất đồng phân. Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ biết rằng một chất đồng phân lập thể có thể có nhiều hoạt tính và/hoặc có thể có nhiều tác dụng có lợi khi được làm giàu so với (các) chất đồng phân lập thể còn lại hoặc khi được tách ra khỏi (các) chất đồng phân lập thể khác. Hơn nữa, chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ biết rõ cách thức để tách, làm giàu, và/hoặc điều chế một cách có chọn lọc các chất đồng phân lập thể nêu trên. Để đánh giá tổng quan về tất cả các khía cạnh đối với chất đồng phân lập thể, xem ấn phẩm: Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Sáng chế bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể, các chất đồng phân cấu thành và hỗn hợp của chúng với mọi tỷ lệ cũng như các dạng đồng vị như các hợp chất đã được đơteri hóa.

Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này dễ nhận thấy rằng không phải tất cả các dị vòng chứa nitơ để có thể tạo ra các *N*-oxit do nitơ đòi hỏi sẵn có một cặp để oxy hóa thành oxit; chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ thừa nhận việc các dị vòng chứa nitơ này có thể tạo ra các *N*-oxit. Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng dễ nhận thấy rằng các amin bậc ba có thể tạo ra các *N*-oxit. Các phương pháp tổng hợp để điều chế các *N*-oxit của các dị vòng và các amin bậc ba đã biết rõ đối với chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này bao gồm việc oxy hóa các dị vòng và các amin bậc ba bằng các peroxy axit như axit peraxetic và 3-cloroperbenzoic (MCPBA), hyđro peroxit, các alkyl hyđroperoxit như *t*-butyl

hyđroperoxit, natri perborat, và đioxiran như đimetylđioxiran. Các phương pháp để điều chế các *N*-oxit này đã được mô tả và đã được nêu một cách kỹ lưỡng trong các tài liệu chuyên ngành, ví dụ, xem các ấn phẩm: T. L. Gilchrist trong *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, các trang 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler và B. Stanovnik trong *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, các trang 18–20, A. J. Boulton và A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett và B. R. T. Keene trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, các trang 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler và B. Stanovnik trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, các trang 285–291, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press; và G. W. H. Cheeseman và E. S. G. Werstiuk trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, các trang 390–392, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này dễ nhận thấy rằng do trong môi trường và trong các điều kiện sinh lý, các muối của các hợp chất hoá học đạt được trạng thái cân bằng với các dạng không muối tương ứng của chúng, các muối có chung khả năng áp dụng sinh học của các dạng không muối. Do vậy, có một khoảng rộng của các muối của các hợp chất có công thức 1 là hữu ích để phòng trừ các loài gây hại không xương sống. Các muối của các hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc hữu cơ như các axit bromhyđric, clohyđric, nitric, phosphoric, sulphuric, axetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salixylic, tartric, 4-toluensulfonic hoặc valeric. Khi hợp chất có công thức 1 chứa nhóm có tính axit như axit carboxylic hoặc phenol, thì các muối này cũng bao gồm các muối được tạo ra cùng với các bazơ hữu cơ hoặc vô cơ như pyriđin, trietylamin hoặc amoniac, hoặc các amit, các hyđrua, các hyđroxit hoặc các cacbonat của natri, kali, lithi, canxi, magie hoặc bari. Do đó, sáng chế bao gồm các hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, các *N*-oxit và các muối thích hợp của chúng.

Hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, các chất đồng phân lập thể, các chất hỗ biến, các N-oxit, và các muối của chúng, thông thường tồn tại

dưới nhiều dạng, và do đó công thức 1 bao gồm các hợp chất có công thức 1 dạng kết tinh và không kết tinh. Các dạng không kết tinh bao gồm các phương án là các chất rắn như các sáp và gôm cũng như các phương án là các chất lỏng như các dung dịch và các khối nóng chảy. Các dạng kết tinh bao gồm các phương án mà chủ yếu là dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp của các chất đa hình (tức là các dạng kết tinh khác nhau). Thuật ngữ "đa hình" được dùng để chỉ dạng kết tinh cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng kết tinh khác nhau, các dạng này có bố trí và/hoặc cấu hình riêng khác nhau của phân tử trong mạng tinh thể. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hoá học tương tự, song chúng cũng có thể có thành phần khác do sự có mặt hoặc không có mặt của nước hoặc phân tử khác đồng kết tinh, có thể liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng tinh thể. Chất đa hình có thể khác về đặc điểm hoá học, vật lý và sinh học như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ bền hoá học, điểm chảy, độ hút ẩm, khả năng tạo huyền phù, tốc độ hoà tan và độ sinh khả dụng. Chuyên gia trong lĩnh vực này sẽ đánh giá đúng dạng đa hình của hợp chất có công thức 1 có thể bộc lộ tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế chế phẩm hữu ích, có tính năng sinh học được cải thiện) hơn dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp chứa chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách dạng đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 có thể đạt được bằng phương pháp mà chuyên gia trong lĩnh vực này đã biết kể cả, ví dụ, việc kết tinh bằng cách sử dụng dung môi và nhiệt độ được chọn. Các hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng một hoặc nhiều chất đa hình kết tinh. Sáng chế bao gồm cả các chất đa hình riêng lẫn hỗn hợp của các chất đa hình, bao gồm các hỗn hợp được làm giàu đối với một chất đa hình so với các loại còn lại. Để đánh giá tổng quan về chất đa hình, có thể xem ấn phẩm: R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Các phương án theo sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Theo các phương án dưới đây, sự viện dẫn tới "hợp chất có công thức 1" bao gồm các định nghĩa về

các phần tử thế được đặc tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có quy định rõ khác theo các phương án này.

Phương án 10. Hợp chất có công thức 1 trong đó A là CH, CR^1 hoặc N, và R^1 là halogen.

Phương án 11. Hợp chất theo phương án 10 trong đó A là CH, CF hoặc N.

Phương án 11a. Hợp chất theo phương án 10 trong đó A là CF hoặc N.

Phương án 12. Hợp chất theo phương án 10 trong đó A là CH hoặc CF.

Phương án 13. Hợp chất theo phương án 10 trong đó A là CH.

Phương án 14. Hợp chất theo phương án 10 trong đó A là N.

Phương án 15. Hợp chất có công thức 1 trong đó m bằng 1, và R^1 là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy hoặc halogen.

Phương án 16. Hợp chất theo phương án 15 trong đó R^1 là CF3, OMe, Me, hoặc F.

Phương án 17. Hợp chất theo phương án 16 trong đó R^1 là CF3, OMe, Me, hoặc F, và nằm ở vị trí 4.

Phương án 18. Hợp chất theo phương án 17 trong đó R^1 là CF3, và nằm ở vị trí 4.

Phương án 19. Hợp chất có công thức 1 trong đó m bằng 0.

Phương án 21. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-19 trong đó X^1 là CR^2, và mỗi X^2, X^3 và X^4 độc lập là CR^3.

Phương án 22. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-19 trong đó X^2 là CR^2, và mỗi X^1, X^3 và X^4 độc lập là CR^3.

Phương án 23. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-22 trong đó mỗi R^3 độc lập là H hoặc halogen.

Phương án 24. Hợp chất theo phương án 23 trong đó mỗi R^3 độc lập là H hoặc F.

Phương án 25. Hợp chất theo phương án 24 trong đó mỗi R^3 là H.

Phương án 26. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$, $C(=NR^{10})R^{11}$ hoặc Q^a.

Phương án 27. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=NR^{10})R^{11}$.

Phương án 28. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=NR^{10})R^{11}$; R^{10} là C_1-C_4 alkoxy; và R^{11} là C_1-C_4 alkyl được thế bằng $S(O)_nR^{23}$.

Phương án 29. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc Q^a.

Phương án 30. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$.

Phương án 31. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$.

Phương án 32. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=S)NR^6R^7$.

Phương án 33. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là H, $C(O)OR^{21}$, $C(O)R^{22}$ hoặc C_1-C_6 alkyl.

Phương án 35. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là H, C(O)OMe, C(O)Me hoặc metyl.

Phương án 36. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là H.

Phương án 36a. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là C(O)OMe.

Phương án 36b. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là C(O)Me.

Phương án 36c. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là $C(=O)NR^6R^7$; và R^6 là metyl.

Phương án 37. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là Q^a.

Phương án 38. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là Q^a; và Q^a là vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, mỗi vòng này là không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x.

Phương án 39. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 10-25 trong đó R^2 là Q^a; và Q^a là vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, mỗi vòng này là không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x.

Phương án 40. Hợp chất theo phương án 39 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 5 cạnh.

Phương án 41. Hợp chất theo phương án 40 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 5 cạnh có nguyên tử nitơ tại vị trí 2.

Phương án 42. Hợp chất theo phương án 39 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 6 cạnh.

Phương án 43. Hợp chất theo phương án 42 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ tại vị trí 2.

Phương án 44. Hợp chất theo phương án 43 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ tại vị trí 2 và được thế bằng C_1-C_4 haloalkyl.

Phương án 45. Hợp chất theo phương án 44 trong đó vòng dị thơm là vòng dị thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ tại vị trí 2 và được thế bằng CF_3.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 10-45 nêu trên cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và các mô tả về các biến trong các phương án liên quan tới không chỉ các hợp chất có công thức 1 mà cả tới các hợp chất nguyên liệu và các hợp chất trung gian hữu

ích để điều chế các hợp chất có công thức 1. Hơn nữa, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 10-45 nêu trên cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả, và sự kết hợp bất kỳ của chúng, liên quan tới các chế phẩm và các phương pháp theo sáng chế.

Sự kết hợp của các phương án 1-45 được minh họa bởi:

Phương án A. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH hoặc CF; và

m bằng 0.

Phương án B. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH hoặc CF;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

X^1 là CR^2 và mỗi X^2, X^3 và X^4 là CH; hoặc X^2 là CR^2 và X^1, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc Q^a.

Phương án C. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH hoặc CF;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

X^1 là CR^2 và mỗi X^2, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc Q^a.

Phương án D. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH hoặc CF;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

X^2 là CR^2 và X^1, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc Q^a.

Phương án E. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

R^{5a} là H;

X^1 là CR^2 và mỗi X^2, X^3 và X^4 là CH; hoặc X^2 là CR^2 và X^1, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(O)NR^6R^7$; và

R^6 là H.

Phương án F. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

R^{5a} là H;

X^1 là CR^2 và mỗi X^2, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(O)NR^6R^7$; và

R^6 là H.

Phương án G. Hợp chất có công thức 1 trong đó:

A là CH;

m bằng 0;

Q là Q-2;

Y^2 là CR^{5a};

R^{5a} là H;

X^2 là CR^2 và X^1, X^3 và X^4 là CH;

R^2 là $C(O)NR^6R^7$; và

R^6 là H.

Các phương án cụ thể bao gồm các hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm bao gồm (số chỉ của hợp chất được nêu trong các Bảng danh mục A-N):

N-(1-metyletyl)-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit (hợp chất 8);

N-xyclopropyl-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit (hợp chất 14);

N-xyclohexyl-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit (hợp chất 16);

2-(3-pyriđinyl)-*N*-(2,2,2-trifloroetyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit (hợp chất 19);

2-(3-pyriđinyl)-*N*-[(tetrahyđro-2-furanyl)metyl]-2*H*-inđazol-5-carboxamit (hợp chất 41);

metyl 2-[[2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-yl]carbonyl]hyđrazincarboxylat (hợp chất 42);

N-(2,2-đifloropropyl)-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-carboxamit (hợp chất 54);

2-(3-pyriđinyl)-*N*-(2-pyrimiđinylmetyl)-2*H*-inđazol-5-carboxamit (hợp chất 55); và

N-[(5-metyl-2-pyrazinyl)metyl]-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-carboxamit (hợp chất 76).

Đáng lưu ý là hợp chất theo sáng chế được đặc trưng bởi sự chuyển hoá thuận lợi và/hoặc kiểu tồn dư đất và có hoạt tính phòng trừ phổ các loài gây hại không xương sống nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Đặc biệt lưu ý vì lý do phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống và ý nghĩa kinh tế, trong đó các phương án theo sáng chế bao gồm việc bảo vệ cây nông nghiệp khỏi thương tổn do loài gây hại không xương sống gây ra bằng cách phòng trừ loài gây hại không xương sống. Hợp chất theo sáng chế được quan tâm vì đặc điểm hoán chuyển thuận lợi của chúng hoặc nội hấp trong cây cũng bảo vệ lá hoặc các phần khác của cây không trực tiếp được tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

Cũng đáng lưu ý là các phương án theo sáng chế gồm các chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả, và sự kết hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tuỳ ý còn chứa ít nhất một chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Cũng đáng lưu ý là các phương án theo sáng chế gồm các chế phẩm phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả, và sự kết hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tuỳ ý còn chứa ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm các phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên (ví dụ, như chế phẩm được đề xuất theo sáng chế).

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên ở dạng chế phẩm lỏng tưới cho đất. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm các phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho đất tiếp xúc với ché phẩm lỏng ở dạng ngấm vào đất chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm phun để phòng trừ loài gây hại không xương sống gồm lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên và tác nhân đẩy. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm làm mồi để phòng trừ loài gây hại không xương sống gồm lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, một hoặc nhiều nguyên liệu thức ăn, tùy chọn là chất hấp dẫn, và tùy chọn là chất giữ ẩm. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm dụng cụ để phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm chế phẩm làm mồi này và hộp đựng phù hợp để chứa chế phẩm làm mồi, trong đó hộp đựng này có ít nhất một lỗ hổng được tạo kích cỡ để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua để sao cho loài gây hại không xương sống có thể tiếp cận được với chế phẩm làm mồi từ vị trí nằm phía ngoài hộp đựng này, và trong đó hộp đựng

này còn phù hợp để đặt trong hoặc gần khu vực hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho hạt giống tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ động vật khỏi loài gây hại ký sinh trùng không xương sống bao gồm bước cho động vật dùng lượng diệt ký sinh trùng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh của nó với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong phần mô tả), với điều kiện là các phương pháp này không phải là các phương pháp sử dụng thuốc để điều trị y học cho người hoặc động vật bằng cách trị liệu.

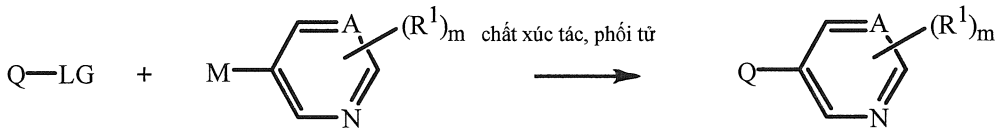
Sáng chế này cũng đề cập đến các phương pháp trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó được cho tiếp xúc với chế phẩm chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, các chất pha loãng rắn và các chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tùy ý chứa thêm lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung, với điều kiện là các phương pháp này không phải là các phương pháp sử dụng thuốc để điều trị y học cho người hoặc động vật bằng cách trị liệu.

Một hoặc nhiều phương pháp và biến thể dưới đây như được mô tả trong các Sơ đồ từ 1 đến 13 có thể được sử dụng để điều chế các hợp chất có công thức 1. Các định nghĩa của các phần tử thế trong các hợp chất có các công thức 1-23 ở dưới là như được xác định ở trên trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có quy định khác được lưu ý riêng. Các hợp chất có các công thức 1a-1g là các

nhóm nhỏ khác nhau của các hợp chất có công thức 1, và tất cả các phần tử thế cho các công thức 1a-1g là như được xác định ở trên cho công thức 1. Các chữ viết tắt sau được dùng: THF viết tắt cho tetrahyđrofuran, DMF viết tắt cho *N,N*-đimetylformamit, NMP viết tắt cho *N*-metylpyrolidinon, Ac viết tắt cho axetat, MS viết tắt cho mesylat, Tf viết tắt cho triflat, và Nf viết tắt cho nonaflat.

Các hợp chất có công thức 1a (công thức 1 trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4, không yêu cầu bảo hộ) có thể được điều chế như được thể hiện trên Sơ đồ 1 bởi việc ngẫu hợp hợp chất dị vòng có công thức 2 (trong đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp như Cl, Br, I, Tf hoặc Nf) với hợp chất dị vòng có công thức 3 (trong đó M là kim loại hoặc á kim thích hợp như Mg, Zn hoặc B) với sự có mặt của chất xúc tác và phối tử thích hợp. Các chất xúc tác có thể được tạo ra từ các kim loại thuộc nhóm chuyển tiếp như Pd (ví dụ, $Pd(OAc)_2$ hoặc $Pd_2(dba)_3$ và các phối tử một răng hoặc hai răng như PPh_3, PCy_3, Pt-Bu_3, x-phos, xantphos, s-phos, và dppf. Các bazơ tiêu biểu được dùng bao gồm các cacbonat như natri cacbonat hoặc xesi cacbonat, các phosphat như kali triphosphat, các amin như etylđiisopropylamin, hoặc các alkoxit như natri tert-butoxit. Các dung môi tiêu biểu bao gồm THF, đioxan, toluen, etanol, DMF, nước hoặc hỗn hợp của chúng. Nhiệt độ phản ứng tiêu biểu là nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến điểm sôi của dung môi.

Sơ đồ 1 (đối chứng)



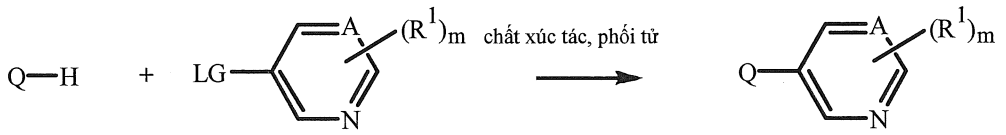
2 **3** **1a**

trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4

Các hợp chất có công thức 1a (công thức 1 trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4, không yêu cầu bảo hộ) cũng có thể được điều chế như được thể hiện trên Sơ đồ 2 bởi việc ngẫu hợp hợp chất có công thức 4 với hợp chất có công thức 5 (trong đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp như Cl, Br, I, Tf hoặc Nf) với sự có mặt của chất xúc tác và phối tử thích hợp. Nhiều chất xúc tác có thể được dùng theo phương

pháp theo Sơ đồ 2, và chúng có thể được tạo ra từ kim loại thuộc nhóm chuyển tiếp như đồng hoặc Pd (ví dụ, các phức chất như $Pd(OAc)_2$ hoặc $Pd_2(dba)_3$) và phối tử. Các phối tử tiêu biểu có thể có một hoặc hai răng, và bao gồm PPh_3, PCy_3, Pt-Bu_3, x-phos, xantphos, s-phos, và dppf. Các bazơ tiêu biểu được dùng bao gồm các cacbonat như natri cacbonat hoặc xesi cacbonat, các phosphat như kali triphosphat, các amin như etylđiisopropylamin hoặc các alkoxit như natri tert-butoxit. Các chất phụ gia như sàng phân tử, $Bu_4N^+Br^-$ hoặc các muối đồng hoặc bạc (ví dụ, AgOAc) có thể có lợi. Các dung môi phản ứng tiêu biểu bao gồm THF, đioxan, toluen, etanol, DMF, nước, hoặc hỗn hợp của chúng. Nhiệt độ phản ứng tiêu biểu là nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến điểm sôi của dung môi. Ví dụ, xem các ấn phẩm: *Chemical Communications* 2011, *47*(17), các trang 5043-5045; *Journal of the American Chemical Society* 2010, *132*(11), các trang 3674-3675; *Heterocycles* 2011, *83*(6), các trang 1371-1376; Công bố đơn patent Mỹ 20090076266; *Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1998, *71*(2), các trang 467-473; *Tetrahedron Letters* 2008, *49*(10), các trang 1598-1600; and *Tetrahedron Letters* 2010, *51*(42), các trang 5624-5627.

Sơ đồ 2 (đối chứng)



4 **5** **1a**

trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4

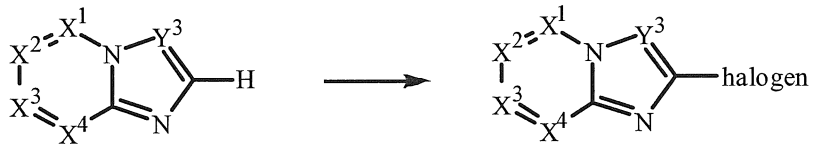
Các hợp chất có công thức 2 trong đó LG là halogen có thể được điều chế từ các amin tương ứng bằng cách xử lý bằng nguồn cấp ON^+ như isoamyl nitrit hoặc t-butyl nitrit hoặc axit nitơ với sự có mặt của nguồn cấp halogen như $CuBr_2$ hoặc $BnNEt_3^+Br^-$. Các điều kiện phản ứng được ưu tiên bao gồm nước hoặc các dung môi hữu cơ như THF hoặc axetonitril, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 0°C đến điểm sôi của dung môi.

Các hợp chất có công thức 2 trong đó LG là Cl hoặc Br cũng có thể được điều chế từ các hợp chất hyđroxy tương ứng bằng cách xử lý bằng chất halogen hóa như $POCl_3$, PCl_5, PBr_3 hoặc $SOCl_2$. Các hợp chất có công thức 2 trong đó LG là OMS hoặc OTf cũng có thể được điều chế từ các hợp chất hyđroxy tương ứng bằng cách xử lý bằng MsCl hoặc Tf_2O.

Các hợp chất có công thức 4 có thể được điều chế từ các hợp chất amin tương ứng bằng cách xử lý bằng nguồn cấp ON^+ như isoamyl nitrit hoặc t-butyl nitrit. Các điều kiện phản ứng được ưu tiên bao gồm các dung môi dạng ete như THF ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến điểm sôi của dung môi.

Các hợp chất có công thức 6 có thể được điều chế bởi việc halogen hóa ưa điện tử các hợp chất tương ứng có công thức 7 bằng cách xử lý bằng chất halogen hóa như *N*-bromsucxinimit trong dung môi thích hợp như DMF, NMP hoặc axit axetic ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến điểm sôi của dung môi (Sơ đồ 3).

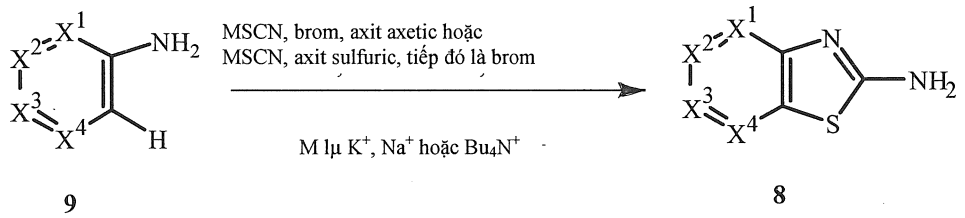
Sơ đồ 3 (đối chứng)



7 **6**

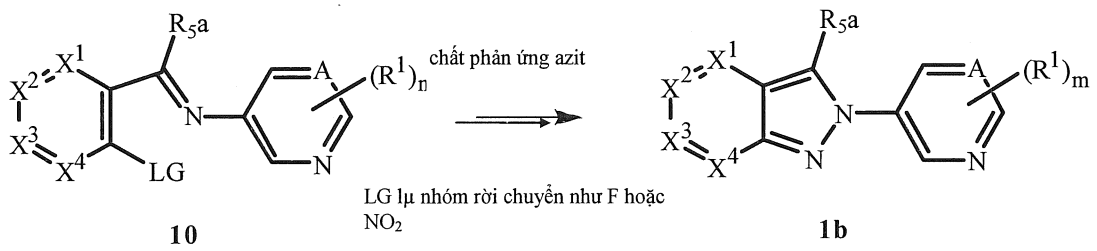
2-aminobenzothiazol có công thức 8 có thể được điều chế từ hoặc anilin không được thế ortho có công thức 9 và anion thioxyanat (trong đó M là K^+, Na^+ hoặc Bu_4N^+) như được thể hiện trên Sơ đồ 4. Phản ứng này có thể được tiến hành trong một bước duy nhất trong axit axetic chẳng hạn, hoặc thông qua trung gian là thio-ure trước khi oxy hóa. Các hợp chất oxy hóa thích hợp bao gồm brom.

Sơ đồ 4 (đối chứng)



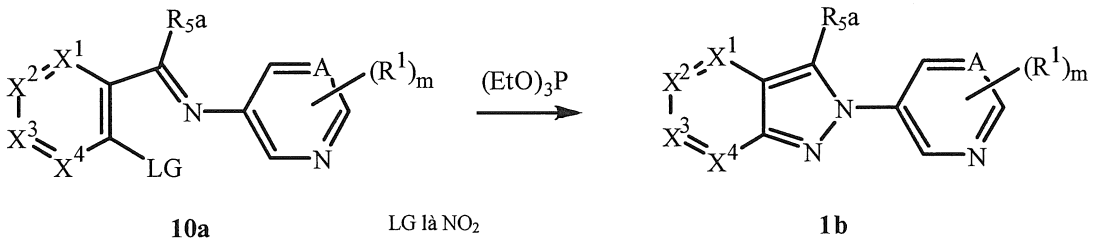
Các hợp chất có công thức 1b có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 10 bởi phương pháp được thể hiện trên Sơ đồ 5, trong đó hợp chất có công thức 10 được xử lý bằng chất phản ứng azit (ví dụ, natri azit hoặc tetrabutylamoni azit). Các điều kiện phản ứng tiêu biểu bao gồm DMF hoặc NMP làm dung môi, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 80°C đến điểm sôi của dung môi.

Sơ đồ 5



Các hợp chất có công thức 1b cũng có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 10a bởi phương pháp được thể hiện trên Sơ đồ 5a, trong đó hợp chất có công thức 10a được xử lý bằng trietyl phosphit.

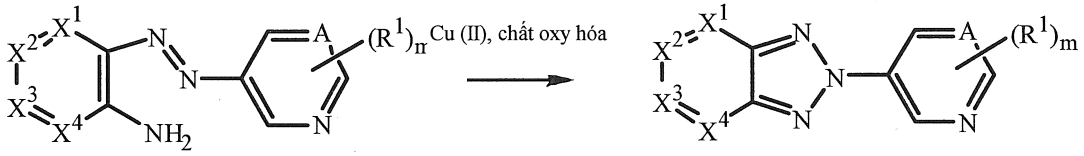
Sơ đồ 5a



Các hợp chất có các công thức 10 và 10a là các bazơ Schiff và có thể được điều chế bởi các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này (ví dụ, xem ấn phẩm: March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, các trang 896-898.

Các hợp chất có công thức 1c có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 11 bởi phương pháp được thể hiện trên Sơ đồ 6 nhờ việc oxy hóa hợp chất có công thức 11 bằng oxy phân tử hoặc peroxit như t-butyl hyđroperoxit với sự có mặt của chất xúc tác đồng (II) như $Cu(OAc)_2$ hoặc $CuBr_2$. Các điều kiện phản ứng tiêu biểu bao gồm dung môi rượu như rượu t-amyl, DMF, NMP hoặc nước amoniac, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 60°C đến điểm sôi của dung môi.

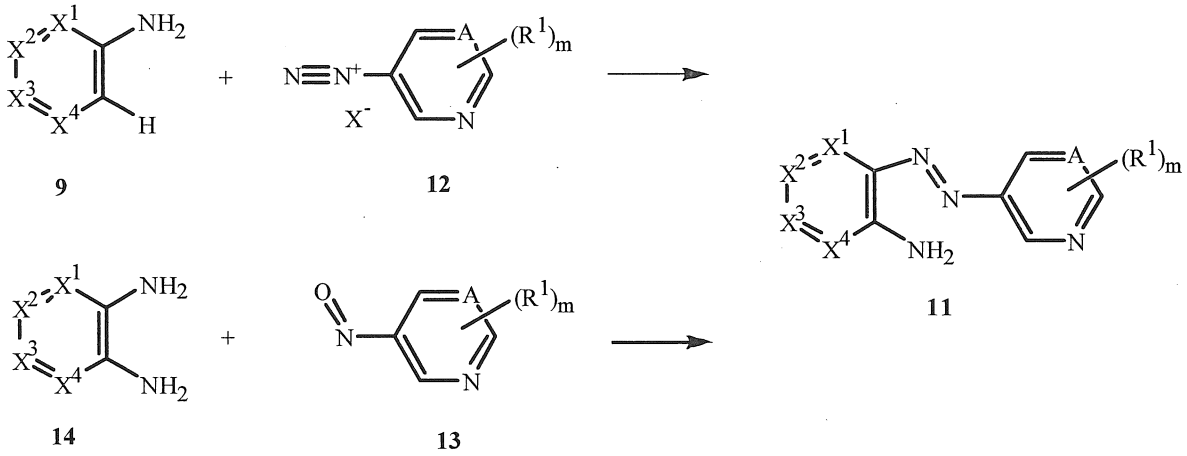
Sơ đồ 6 (đối chứng)



11 **1c**

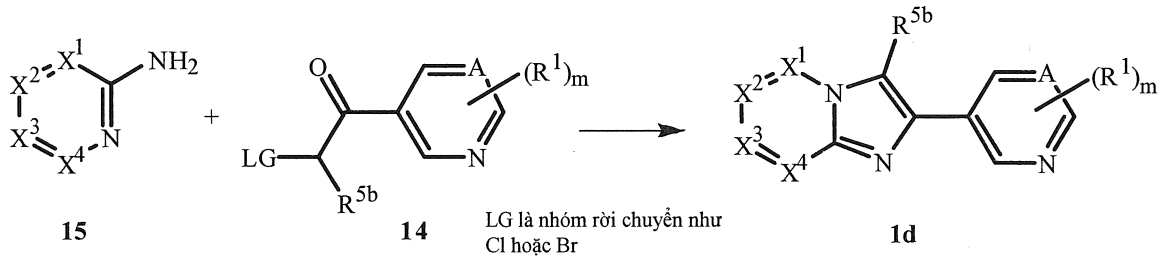
Các hợp chất 2-aminoazo có công thức 11 có thể được điều chế bởi phản ứng của anilin có công thức 9 với muối điazo có công thức 12 bởi các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này (ví dụ, xem ấn phẩm: March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, các trang 525-526). Các hợp chất có công thức 11 cũng có thể được điều chế bởi phản ứng của hợp chất aryl nitroso có công thức 13 với điamin có công thức 14 trong dung môi như axit axetic. Hai phương pháp này được thể hiện trên Sơ đồ 7.

Sơ đồ 7 (đối chứng)



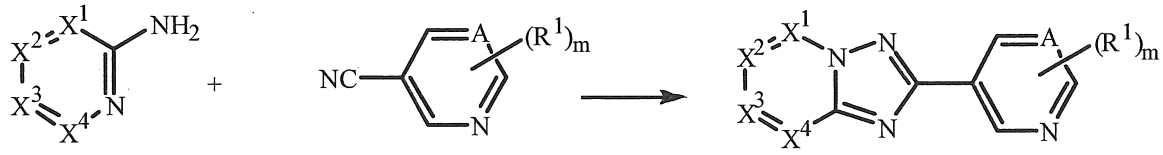
Các hợp chất có công thức 1d có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức 14 (trong đó Lg là nhóm rời chuyển thích hợp như Cl hoặc Br) với aminopyriđin hoặc aminođiazin có công thức 15 như được thể hiện trên Sơ đồ 8. Các điều kiện phản ứng tiêu biểu bao gồm dung môi rượu như etanol hoặc toluen, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến điểm sôi của dung môi. Pyriđin nitơ này có thể tùy ý được bảo vệ dưới dạng sản phẩm cộng BH_3, N-oxit, hoặc dẫn xuất 2- hoặc 6-halopyriđin.

Sơ đồ 8 (đối chứng)



Các hợp chất có công thức 1e có thể được điều chế như được thể hiện trên Sơ đồ 9 bởi việc thêm vòng 2-aminopyriđin có công thức 15 bằng arylnitril có công thức 16 (ví dụ, xem ấn phẩm: *Journal of the American Chemical Society* 2009, *131*(42), các trang 15080-15081, và WO 2013041472.

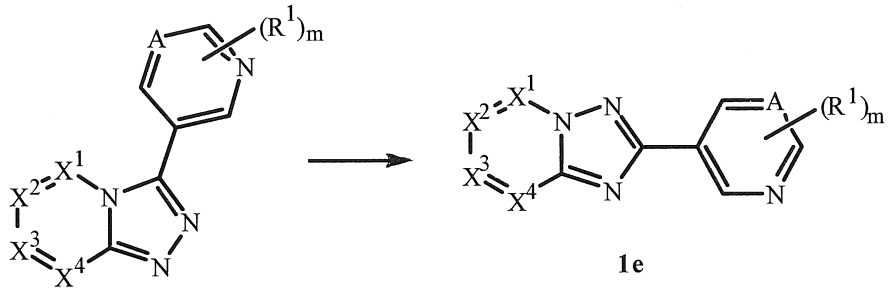
Sơ đồ 9 (đối chứng)



15 16 1e

Các hợp chất có công thức 1e cũng có thể được điều chế bởi quá trình chuyển vị các hợp chất có công thức 17 bằng cách xử lý bằng bazơ như được thể hiện trên Sơ đồ 10 (ví dụ, xem ấn phẩm: *J. Het Chem* 1970, *7* trang 1019). Các hợp chất có công thức 17 có thể được điều chế bởi các phương pháp được mô tả trong WO 2008006540 và *J. Org. Chem.*, 1966, trang 251.

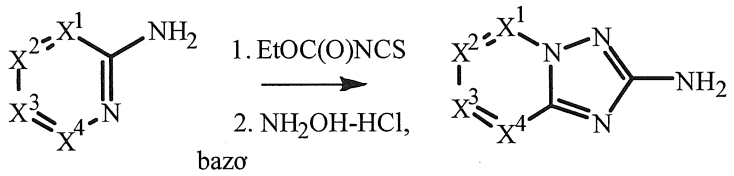
Sơ đồ 10 (đối chứng)



17 1e

Các hợp chất trung gian có công thức 18 có thể được điều chế bởi phương pháp được thể hiện trên Sơ đồ 11 bằng cách xử lý 2-aminopyriđin có công thức 15 bằng isoxyanat, tiếp đó bằng hyđroxylamin và bazơ thích hợp như trietylamin.

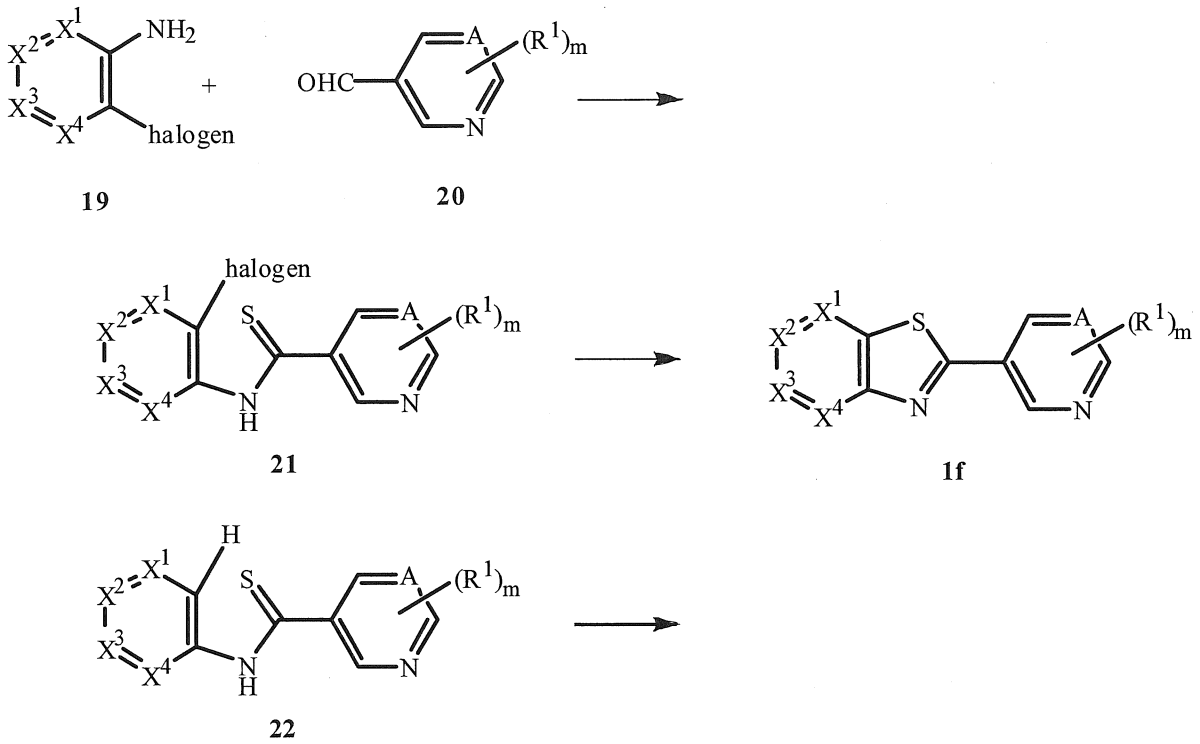
Sơ đồ 11 (đối chứng)



15 18

Các hợp chất có công thức 1f có thể được điều chế như được thể hiện trên Sơ đồ 12 bằng cách đóng vòng oxy hóa aryl alđehyt có công thức 20 bằng anilin có công thức 19 mang ortho-halogen, tốt hơn là iot, với sự có mặt của lưu huỳnh có tác dụng cả làm nguồn cấp lưu huỳnh lẫn làm chất oxy hóa. Phản ứng này được tiến hành với sự có mặt của một bazơ như K_2CO_3 trong dung môi thích hợp như nước hoặc DMF, và được xúc tác bằng cách bổ sung các muối đồng (ví dụ, CuI hoặc $CuCl_2$) và tốt hơn là phối tử thích hợp như 1,10-phenanthrolin. Nhiệt độ phản ứng tiêu biểu nằm trong khoảng từ 70°C đến điểm sôi của dung môi.

Sơ đồ 12 (đối chứng)



Các hợp chất có công thức 1f cũng có thể được điều chế bằng cách đóng vòng 2-halothioamit có công thức 21 như được thể hiện trong phản ứng thứ hai trên Sơ đồ 12 bằng bazơ như KOtBu, NaH, DBU hoặc Cs_2CO_3 trong dung môi thích hợp như toluen hoặc DMF, tùy ý có bổ sung các muối đồng như CuI, và tốt hơn là phối tử thích hợp như 1,10-phenanthrolin. Phản ứng này cũng có thể được xúc tác bởi hợp chất Pd như hợp chất được điều chế từ $Pd_2(dba)_3$ và $(t\text{-}Bu)_2P$-*o*-biphenyl, bazơ như Cs_2CO_3 trong dung môi thích hợp, như 1,2-đimetoxyetan hoặc

điioxan. Nhiệt độ phản ứng tiêu biểu nằm trong khoảng từ 80°C đến điểm sôi của dung môi. Đối với các phản ứng được xúc tác bằng đồng và Pd, tốt hơn, nếu phần tử thế halogen trên hợp chất có công thức 21 là Br hoặc I. Ví dụ, xem các ấn phẩm: *Journal of Organic Chemistry* 2006, *71*(5), các trang 1802-1808; *Tetrahedron Letters* 2003, *44*(32), các trang 6073-6077; *Synthetic Communications* 1991, *21*(5), các trang 625-33; và Eur. Pat. Appl. No. 450420.

Các hợp chất có công thức 1f cũng có thể được điều chế bằng cách đóng vòng oxy hóa thioamit có công thức 22 như được thể hiện trong phản thứ ba trên Sơ đồ 12. Các chất oxy hóa thường được dùng theo phương pháp này bao gồm brom hoặc iot, DDQ và $K_3Fe(CN)_6$. Ví dụ, xem các ấn phẩm: *Tetrahedron* 2007, *63*(41), các trang 10276-10281; *Synthesis* 2007, (6), 819-823; và Công bố đơn patent Mỹ 20120215154.

Ba phương pháp được mô tả trên Sơ đồ 12 có thể được dùng để điều chế các hợp chất trong đó X^1-X^4 là các nguyên tử cacbon, hoặc trong đó một trong số X^1-X^4 là nitơ (ví dụ, xem ấn phẩm: *J. Heterocyclic Chem.* 2009, 46, trang 1125 và các tài liệu trích dẫn trong bản mô tả).

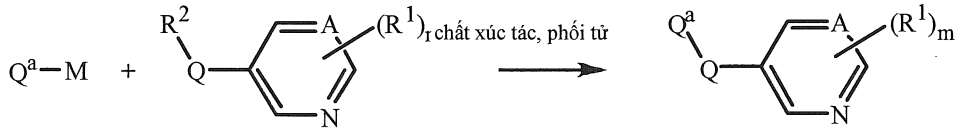
Các hợp chất có công thức 1, và các hợp chất trung gian được dùng để điều chế các hợp chất có công thức 1, trong đó Z là S có thể được điều chế bằng cách thionat hóa các hợp chất tương ứng trong đó Z là O bằng, ví dụ, chất phản ứng Lawesson (CAS No. 19172-47-5), chất phản ứng Belleau (CAS No. 88816-02-8) hoặc P_2S_5. Phản ứng thionat hóa thường được tiến hành trong các dung môi như toluen, xylen hoặc điioxan, và ở nhiệt độ cao nằm trong khoảng từ 80°C đến điểm sôi của dung môi.

Các hợp chất có công thức 1 trong đó R^2 là $C(O)NR^6R^7$ có thể được điều chế bằng cách carbonyl hóa các hợp chất tương ứng trong đó R^2 là halogen (tốt hơn là Br hoặc I), hoặc trong đó R^2 là sulfonat (ví dụ, triflat hoặc nonaflat). Phản ứng này được tiến hành với sự có mặt của nguồn cấp cacbon monoxit như khí cacbon monoxit hoặc $Mo(CO)_6$ ở áp suất nằm trong khoảng từ áp suất khí quyển đến 25 bar (25.10^5Pa), tùy ý có gia nhiệt bằng vi sóng, và nói chung ở nhiệt độ cao nằm

trong khoảng từ 80 đến160°C. Các dung môi phản ứng tiêu biểu bao gồm DMF, NMP, toluen hoặc các dung môi dạng ete như THF hoặc đioxan.

Các hợp chất có công thức 1 trong đó R^2 là Q^a có thể được điều chế như được thể hiện trên Sơ đồ 13. Phương pháp theo Sơ đồ 13 là tương tự như phương pháp được mô tả trên Sơ đồ 1; M là kim loại hoặc á kim thích hợp như Mg, Zn hoặc B, và R^2 cấu thành LG trong Sơ đồ 1 và là nhóm rời chuyển thích hợp như Cl, Br, I, Tf hoặc Nf.

Sơ đồ 13

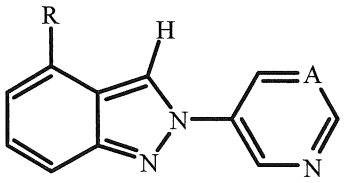


23 **1** **1g**

Các hợp chất có công thức 1 trong đó R^2 là Q^a và Q^a được liên kết với Q qua nguyên tử nitơ trong Q^a có thể được điều chế bởi phương pháp tương tự như phương pháp theo Sơ đồ 13. Theo phương pháp này, M trong hợp chất có công thức 23 là hyđro. Các chất phản ứng ngẫu hợp bao gồm các muối đồng(I) như CuI, và phối tử thích hợp như *trans*-bis(*N*,*N*-đimetyl-1.2-xyclohexanđiamin. Các điều kiện phản ứng tiêu biểu bao gồm dung môi như toluen hoặc đioxan, và nhiệt độ phản ứng cao nằm trong khoảng từ 80°C đến điểm sôi của dung môi.

Các ví dụ về các hợp chất trung gian hữu ích cho việc điều chế các hợp chất theo sáng chế được thể hiện trong các Bảng I-1 tới I-16. Các chữ viết tắt sau được dùng trong các bảng này: Me viết tắt cho metyl, Et viết tắt cho etyl, Ph viết tắt cho phenyl, C(O) viết tắt cho carbonyl và CHO viết tắt cho formyl.

Bảng I-1



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

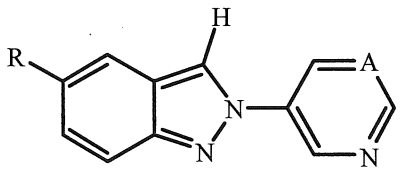
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

Bảng I-2



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

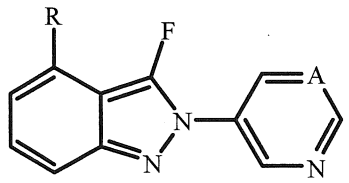
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

Bảng I-3



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

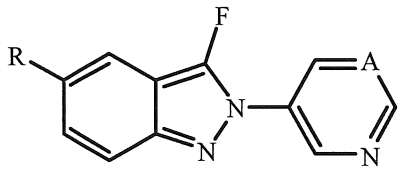
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

Bảng I-4



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

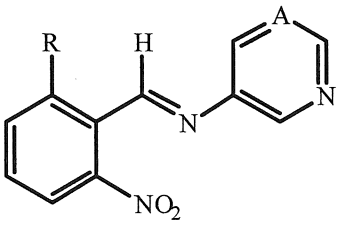
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

A là N

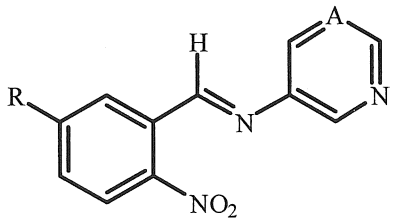
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
$-OS(O)_2CF_3$	NH_2
nitro	

Bảng I-13



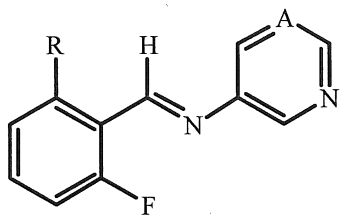
Bảng I-13 là giống hệt Bảng I-1, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1-1" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng I-14



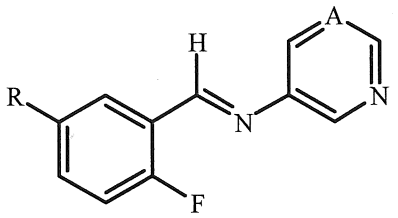
Bảng I-14 là giống hệt Bảng I-1, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1-1" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng I-15



Bảng I-15 là giống hệt Bảng I-1, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1-1" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng I-16



Bảng I-16 là giống hệt Bảng I-1, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1-1" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Điều cần phải lưu ý là một số chất phản ứng và điều kiện phản ứng được mô tả ở trên để điều chế các hợp chất có công thức 1 có thể không tương hợp với các nhóm chức nhất định có mặt trong các hợp chất trung gian. Trong các trường hợp này, việc kết hợp các trình tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc các chuyển hóa giữa các nhóm chức trong quá trình tổng hợp sẽ trợ giúp cho việc thu nhận sản phẩm được mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ sẽ là rõ ràng đối với chuyên gia trong lĩnh vực tổng hợp hoá học (ví dụ, xem ấn phẩm: Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này dễ nhận thấy rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng nêu ra như được thể hiện trong sơ đồ riêng rẽ bất kỳ, có thể cần thiết thực hiện thêm các bước tổng hợp thông thường không được mô tả chi tiết để hoàn toàn quá trình tổng hợp hợp chất có công thức 1. Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng dễ nhận thấy rằng có thể cần thiết thực hiện kết hợp các bước được minh họa trong các sơ đồ nêu trên theo một trật tự khác với trình tự cụ thể được trình bày để điều chế hợp chất có công thức 1.

Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng dễ nhận thấy rằng các hợp chất có công thức 1 và các hợp chất trung gian được mô tả trong bản mô tả này có thể được xử lý khác nhau bằng các phản ứng ưa điện tử, ưa nhân, gốc, hữu cơ kim loại, oxy hoá, và khử để thêm các phần tử thế hoặc biến đổi các phần tử thế hiện có.

Không cần mô tả chi tiết hơn nữa, điều được tin là chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này khi tham khảo phần mô tả nêu trên có thể áp dụng sáng chế ở mức độ đầy đủ nhất. Do đó, các ví dụ tổng hợp các dưới đây chỉ được xem như là có tính chất minh hoạ, và không giới hạn phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Các bước trong các ví dụ tổng hợp sau đây minh hoạ quy trình thực hiện cho mỗi bước trong quá trình chuyển hoá tổng hợp chung, và nguyên liệu cho mỗi bước có thể không nhất được điều chế theo một trật tự điều chế nhất định quy trình này là được mô tả trong các ví dụ hoặc các bước khác. Giá trị phần trăm là theo khối lượng chỉ trừ có các hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc khi được chỉ ra theo cách khác. Các phần và phần trăm cho các hỗn hợp dung môi sắc ký là theo thể tích trừ khi có quy định

khác được chỉ ra cụ thể. Phổ ^{1}H NMR được ghi lại theo ppm so với chuẩn tetrametylsilan; "s" chỉ vạch đơn, "d" chỉ vạch đôi, "t" chỉ vạch ba, "q" chỉ vạch bốn, "m" chỉ vạch bội, "dd" chỉ hai vạch đôi, "dt" chỉ hai vạch ba, "br s" chỉ vạch đơn rộng. DMF viết tắt cho *N,N*-đimetylformamit. Sự đánh số của các hợp chất là theo các Bảng danh mục A-N.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ tổng hợp 1 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)

Điều chế *N*-[2-(metylthio)etyl]-2-(3-pyriđinyl)-7-benzothiazolcarboxamit (hợp chất 84)

Bước A: Điều chế etyl este của axit 3-[(aminothioxometyl)amino]benzoic

Etyl 3-aminobenzoat (35,25g, 213,6mmol) được hòa tan trong clorobenzen (250mL) và được làm lạnh xuống -10°C. Dung dịch axit sulphuric đặc (5,93mL) được bổ sung vào, tiếp đó là KSCN (21,76 g) và 18-crown-6 (600mg), và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt ở 100°C trong 14 giờ. Hexan được bổ sung vào hỗn hợp đã được làm lạnh này, và chất rắn đã kết tủa được tách bằng cách lọc. Chất rắn được tạo huyền phù trong hỗn hợp gồm nước và các hexan, và huyền phù đặc này được khuấy trong 1 giờ. Chất rắn được tách bằng cách lọc và được làm khô trong chân không qua đêm để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này là chất rắn màu xám (40,7g). ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 10,10 + 9,87 (hai s, 1H), 8,08 + 8,05 (hai s, 1H), 7,66-7,80 (m, 2H), 7,43-7,51 (m, 1H), 8,0-7,0 (br s, 2H), 4,28-4,35 (m, 2H), 1,29-1,35 (m, 3H).

Bước B: Điều chế etyl este của axit 2-amino-7-benzothiazolcarboxylic

Sản phẩm của Bước A được hấp thụ trong clorofom (300mL) và axit axetic (200mL) và brom (21mL) trong clorofom (100mL) được bổ sung từng giọt vào trong khoảng thời gian dài hơn 1,5 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt ở 70°C trong 4 giờ, được làm lạnh, được lọc, và chất rắn đã được này được rửa bằng 50mL hỗn hợp 1:1 axeton/clorofom. Chất rắn này được bổ sung vào

dung dịch của Na_2CO_3 (25g) trong nước (400mL) và được khuấy trong 20 phút. Huyền phù này được lọc, và chất rắn đã được tách này được rửa bằng nước, và được làm khô trong chân không qua đêm để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này (6,73 g) là chất rắn màu trắng. Phần dịch lọc hữu cơ được cô và tạo huyền phù lại trong 100mL hỗn hợp 1:1 clorofom/axeton, và được xử lý như được mô tả trên đây để tạo ra thêm 8,1g chất rắn màu trắng (độ tinh khiết 90%, 10% còn lại là chất đồng phân vùng benzothiazol). ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 7,66 (dd, J=7,7, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,57 (dd, 1H), 7,35 (t, J=7,8 Hz, 1H), 4,37 (q, J=7,1 Hz, 2H), 1,36 (t, J=7,1 Hz, 3H).

Bước C: Điều chế etyl este của axit 2-clo-7-benzothiazolcarboxylic

Sản phẩm của Bước B (7,97g, hỗn hợp 9:1 của các chất đồng phân vùng, 35,9mmol) được bổ sung từng phần một trong khoảng thời gian dài hơn 45 phút vào hỗn hợp gồm *tert*-butylnitrit (7,1mL) và $CuCl_2$ (5,31g) trong axetonitril (360mL) ở 65°C. Sau khi khuấy thêm trong 15 phút, hỗn hợp đã được làm lạnh này được chiết 6 lần bằng hexan. Các phần chiết đã kết hợp được cô để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này (5,85g) là chất rắn màu vàng. Lớp axetonitril được pha loãng bằng nước (200mL), được chiết bằng hexan, và phần hexan này được lọc qua đệm silicagel rửa giải bằng butyl clorua để tạo ra thêm 0,55g sản phẩm sau khi cô. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,14 (d, 2H), 7,58 (t, 1H), 4,49 (q, J=7,1 Hz, 2H), 1,47 (t, J=7,2 Hz, 3H).

Bước D: Điều chế axit 2-(3-pyriđinyl)-7-benzothiazolcarboxylic

Sản phẩm của Bước C (6,2g, hỗn hợp 9:1 của các chất đồng phân vùng) được kết hợp với axit 3-pyriđinylboronic (3,79g), PPh_3 (1,35g) và Na_2CO_3 (5,44g) trong toluen (100mL), nước (25mL) và etanol (15mL), và hỗn hợp phản ứng này được sục nitơ trong 5 phút. Pd_2dba_3 (588mg) được bổ sung vào, và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt với sự hồi lưu trong 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng đã được làm lạnh này được pha loãng bằng nước, được chiết hai lần bằng

điclorometan, và các phần chiết hữu cơ đã kết hợp được làm khô trên $MgSO_4$ và được cô. Phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 10% tới 50% etyl axetat trong các hexan) để tạo ra chất rắn màu da cam (6,7g). Việc tái kết tinh ra khỏi etanol (25mL) thu được etyl este của Hợp chất nêu ở đề mục này (5,65g) dưới dạng chất đồng phân vùng mong muốn duy nhất. ^1H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,38 (br s, 1H), 8,75 (br s, 1H), 8,44 (dt, J=8,0, 1,9 Hz, 1H), 8,30 (dd, J=8,2, 1,1 Hz, 1H), 8,19 (dd, J=7,6, 1,1 Hz, 1H), 7,62 (t, 1H), 7,47 (dd, J=8,4, 4,4 Hz, 1H), 4,53 (q, J=7,2 Hz, 2H), 1,50 (t, J=7,2 Hz, 3H).

Sản phẩm đã được tạo ra ở trên được hòa tan trong etanol (100mL) và được xử lý bằng dung dịch 1N NaOH (24,8mL). Hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt để hồi lưu trong 1,5 giờ trước khi được làm lạnh, trung hòa bằng HCl đặc (2,0mL), và được cô. Phần cặn được làm khô trong chân không để tạo ra hỗn hợp gồm Hợp chất nêu ở đề mục này và NaCl, nó được dùng luôn ở bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

Bước E: Điều chế *N*-[2-(metylthio)etyl]-2-(3-pyriđinyl)-7-benzothiazolcarboxamit

Thionyl clorua (40mL) được bổ sung vào sản phẩm của Bước D (0,55g), và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt để hồi lưu trong 3 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh và được cô. Phần cặn thu được được tạo huyền phù trong toluen và được cô để tạo ra clorua axit thô, nó được dùng luôn mà không cần tinh chế thêm.

Clorua axit thô (chứa 120% mol NaCl, 114mg, 0,3mmol) được xử lý bằng điclorometan (5mL), $MeSCH_2CH_2NH_2$ (33mL) và trietylamin (125mL), và hỗn hợp phản ứng này tiếp đó được khuấy ở nhiệt độ môi trường trong 14 giờ. Hỗn hợp phản ứng này được pha loãng bằng dung dịch $NaHCO_3$ bão hòa, được chiết hai lần bằng điclorometan, và được làm khô trên $MgSO_4$. Các lớp hữu cơ đã kết hợp được cô, và phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 30% etyl axetat trong hexan tới 100% etyl axetat) để tạo ra 65mg Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế. ^1H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,39

(d, J=1,7 Hz, 1H), 8,74 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,40-8,47 (dt, 1H), 8,26 (dd, J=8,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=7,6, 0,9 Hz, 1H), 7,58-7,64 (t, 1H), 7,47 (dd, J=7,2, 5,0 Hz, 1H), 6,94 (br t, 1H), 3,75-3,82 (q, 2H), 2,80-2,88 (t, 2H), 2,18 (s, 3H).

Ví dụ tổng hợp 2 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)

Điều chế 2-(5-flo-3-pyriđinyl)-*N*-(2,2,2-trifloroetyl)-6-benzothiazolcarboxamit (hợp chất 127)

Bước A: Điều chế axit 2-(5-flo-3-pyriđinyl)-6-benzothiazolcarboxylic

Metyl 4-amino-3-iođobenzoat (1,93g, 6,96mmol) được kết hợp với K_2CO_3 (1,92g), S_8 (668mg), $CuCl_2$-$2H_2O$ (119mg), 1.10-phenanthrolin (125mg) và 5-flo-3-pyriđincarboxalđehyt (957mg) trong H_2O (30mL), và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt để hồi lưu trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng đã được làm lạnh này được lọc, và phần dịch lọc được xử lý bằng NH_4Cl (1,49 g). Hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ môi trường trong 10 phút, được lọc, và chất rắn này được làm khô trong chân không để tạo ra chất rắn màu xám. Chất rắn này được tạo huyền phù trong đioxan, huyền phù này được gia nhiệt để hồi lưu, được làm lạnh, và được lọc để tách chất rắn. Chất rắn được rửa bằng etyl ete để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này (0,66 g). ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9,15 (s, 1H), 8,80 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,39 (dt, J=9,5, 2,2 Hz, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,05 (d, 1H), 8,0-6,5 (br s).

Bước B: Điều chế 2-(5-flo-3-pyriđinyl)-*N*-(2,2,2-trifloroetyl)-6-benzothiazolcarboxamit

Thionyl clorua (5mL) được bổ sung vào sản phẩm của Bước A (0,66 g), và hỗn hợp này được gia nhiệt để hồi lưu trong 16 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh và được cô. Phần cặn thu được được tạo huyền phù trong toluen và được cô để tạo ra clorua axit thô, nó được dùng luôn mà không cần tinh chế thêm.

Clorua axit thô (103mg, 0,31mmol) được xử lý bằng điclorometan (5mL), trietylamin (131mL) và $CF_3CH_2NH_2$ (29mL), và hỗn hợp phản ứng này được

khuấy ở nhiệt độ môi trường trong 3 ngày. Hỗn hợp phản ứng này được pha loãng bằng dung dịch bão hòa của $NaHCO_3$, được chiết hai lần bằng điclorometan, và được làm khô trên $MgSO_4$. Các lớp hữu cơ đã kết hợp được cô, và phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 20% tới 40% etyl axetat trong các hexan) để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế, là chất rắn màu trắng (52mg). ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,32 (br s, 1H), 8,77 (d, J=4,3 Hz, 1H), 8,48 (d, J=1,4 Hz, 1H), 8,40 (dt, J=7,9, 2,0 Hz, 1H), 8,16 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,90 (dd, J=8,5, 1,7 Hz, 1H), 7,48 (dd, J=7,8, 4,7 Hz, 1H), 6,48 (br t, 1H), 4,20 (qd, J=9,0 Hz, 1H).

Ví dụ tổng hợp 3

Điều chế *N*-(1-metyletyl)-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit (hợp chất 8)

Bước A: Điều chế *N*-[(2-brom-6-florophenyl)metylen]-3-pyriđinamin

Dung dịch gồm 2-brom-6-florobenzalđehyt (5g, 24,6mmol) và 3-aminopyriđin (2,7g, 29,5mmol) trong EtOH (4mL) được gia nhiệt để hồi lưu qua đêm. Hỗn hợp phản ứng này được cô và chất rắn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 0-40% etyl axetat trong các hexan) để cho Hợp chất nêu ở đề mục này (4,5g) là chất rắn màu da cam. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,66-8,70 (s, 1H), 8,48-8,53 (m, 2H), 7,52-7,58 (m, 1H), 7,41-7,48 (m, 1H), 7,31-7,37 (m, 1H), 6,95-7,06 (m, 2H).

Bước B: Điều chế 4-brom-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol

Dung dịch của sản phẩm của Bước A (4,5g, 16,1.mmol) và NaN_3 (1,2g, 19,3mmol) trong DMF (20mL) được gia nhiệt tới 90°C trong 24 giờ. Hỗn hợp đã được làm lạnh này được pha loãng bằng nước và được chiết 3 lần bằng điclorometan. Các lớp hữu cơ đã kết hợp được làm khô ($MgSO_4$), được lọc, được cô, và phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 0-30% etyl axetat trong các hexan) để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này (4,0g) là chất rắn màu vàng. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69

(dd, J=4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,46-8,49 (d, 1H), 8,28 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,73 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,50 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,21 (dd, J=8,7, 7,3 Hz, 1H).

Bước C: Điều chế *N*-(1-metyletyl)-2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-4-carboxamit

Sản phẩm của Bước B (200mg, 0,727mmol), isopropylamin (183µL, 2,18mmol), *trans*-bis(axetato)bis[o-(đi-o-tolylphosphino)benzyl]đipalađi(II) (17mg, 0,018mmol), tri-*tert*-butylphosphoni tetrafloroborat (10,5mg, 0,036mmol), molypđen hexacarbonyl (192mg, 0,727mmol, 1,8-điazabixyclounđec-7-en (473µL, 2,18mmol) và DMF (5mL) được đặt trong lọ chiếu vi sóng và được chiếu sáng ở 160°C trong 40 phút. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm mát tới nhiệt độ trong phòng và được lọc qua đệm Xelit®. Phần dịch lọc được pha loãng bằng dung dịch bão hòa của $NaHCO_3$ và được chiết bằng điclorometan. Lớp hữu cơ được làm khô ($MgSO_4$), được lọc, được cô, và phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng 0-10%Axeton trong clorofom). Việc nghiền thành bột chất rắn thu được cùng vói etyl ete đã tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế, là chất rắn màu trắng (45mg). ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,92 (dt, J=8,5, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,31-7,41 (m, 2H), 6,15 (s, 1H), 4,31-4,41 (m, 1H), 1,33 (d, J=6,6 Hz, 6H).

Ví dụ tổng hợp 4 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)

Điều chế 2-(3-pyriđinyl)-*N*-[1-(2,2,2-trifloroetyl)]imiđazo[1,2-*a*]pyriđin-6-carboxamit (hợp chất 457)

Bước A: Điều chế metyl este của axit 2-(3-pyriđinyl)imiđazo[1,2-*a*]pyriđin-6-carboxylic

Theo phương pháp được mô tả trong Công bố đơn patent Mỹ No. 20110189794, hỗn hợp gồm metyl 6-aminonicotinat (5,0g, 33mmol) trong etanol (140mL) ở 60°C được bổ sung natri bicacbonat rắn (5,52g, 65,7mmol), tiếp đó là

muối 3-(bromaxetyl)pyriđin hyđro bromua (10,16g, 36,2mmol). Hỗn hợp thu được được gia nhiệt để hồi lưu trong 9 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh, được cô, và dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa (50mL) và điclorometan (50mL) được bổ sung vào phần cặn thu được này. Pha nước được chiết bằng điclorometan (5 X 30mL). Các pha hữu cơ đã gộp lại được cô và được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng etyl axetat) để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này.

Bước B: Điều chế 2-(3-pyriđinyl)-*N*-[1-(2,2,2-trifloroetyl)]imiđazo[1,2-*a*]pyriđin-6-carboxamit

Hỗn hợp gồm este đã điều chế được ở Bước A (0,4g, 2,4mmol) và nước NaOH (1N, 7,1mL, 7,1mmol) được khuấy trong metanol (10mL) trong 2 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được cô dưới áp suất giảm để loại bỏ metanol, và dung dịch nước thu được được trung hòa bằng 1N HCl tới độ pH 5 để kết tủa axit carboxylic. Axit carboxylic rắn được tách bằng cách lọc, được làm khô, và được dùng luôn ở bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

Hỗn hợp gồm axit carboxylic đã được điều chế ở trên (0,31g, 1,30mmol), EDC-HCl (0,27g, 1,43mmol), HOBt-H_2O (0,22g, 1,43mmol), và trietylamin (0,72mL, 5,2mmol) trong DMF (10mL) được khuấy ở 40°C trong 30 phút. Một phần tư lượng hỗn hợp phản ứng này tiếp đó được loại bỏ, được xử lý bằng $CF_3CH_2NH_2$ (0,13g, 1,3mmol), và được khuấy ở 40°C qua đêm. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được cô trong chân không để loại bỏ DMF, và phần cặn được tinh chế bằng cách sắc ký trên cột (silicagel được rửa giải bằng etyl axetat:metanol:trietylamin, 8:1:1) để tạo ra 43,8mg Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế.

Ví dụ tổng hợp 5

Điều chế metyl 2-[[2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-yl]carbonyl]hyđrazincarboxylat (hợp chất 42)

Bước A: Điều chế metyl este của axit 4-nitro-[(3-pyriđinylimino)metyl]benzoic

Dung dịch gồm metyl 3-formyl-4-nitrobenzoat (5g, 25mmol) và 3-aminopyriđin (2,7g, 30mmol) trong etanol (4mL) được gia nhiệt để hồi lưu qua đêm. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh, được cô dưới áp suất giảm, và chất rắn thô thu được được tinh chế bằng cách sắc ký trên silicagel (rửa giải bằng 0-40% etyl axetat/các hexan) để cho 4,5g sản phẩm nêu ở đề mục này là chất rắn màu da cam.

Bước B: Điều chế metyl este của axit 2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-carboxylic

Dung dịch gồm sản phẩm của Bước A (4,5g, 16mmol) và natri azit (1,2g, 19mmol) trong DMF (20mL) được gia nhiệt tới 90°C trong 16 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm mát tới nhiệt độ trong phòng và được pha loãng bằng nước. Hai lớp thu được được tách, và lớp nước được chiết ba lần bằng điclorometan. Các lớp hữu cơ đã kết hợp được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thô thu được được tinh chế bằng cách sắc ký trên silicagel (0-30% etyl axetat/các hexan) để cho 4,0g sản phẩm nêu ở đề mục này là chất rắn màu vàng.

Bước C: Điều chế 2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-carbonyl clorua

Metyl este đã điều chế được ở Bước B (4,1g, 16mmol) được hoà tan trong trong metanol (150mL), dung dịch 50% hyđroxit natri trong nước (7,1mL) được bổ sung vào, và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt để hồi lưu trong 4 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm mát tới nhiệt độ trong phòng, và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được axit hóa bằng dung dịch nước 1N HCl, và chất kết tủa thu được được tách bằng cách lọc, được rửa bằng đietyl ete, và được làm khô dưới áp suất giảm ở 60°C qua đêm. Axit carboxylic thô này

tiếp đó được tái hòa tan trong thionyl clorua (60mL), và hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt tới 75°C. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm mát tới nhiệt độ trong phòng và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Carbonyl clorua thô này được dùng luôn ở bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

Bước D: Điều chế metyl 2-[[2-(3-pyriđinyl)-2*H*-inđazol-5-yl]carbonyl]hyđrazincarboxylat

Axyl clorua đã điều chế được ở Bước C (200mg, 0,836mmol) được kết hợp với metyl hyđrazinocarboxylat (82mg, 0,91mmol) trong điclorometan (5mL). Hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh xuống 0°C, và trietylamin (360µl, 2,51mmol) được bổ sung vào từng giọt. Phản ứng được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và để khuấy qua đêm. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được làm lạnh và được làm mát dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa. Hai lớp này được tách, và lớp nước được chiết ba lần bằng điclorometan. Các lớp hữu cơ đã kết hợp được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thô thu được được tinh chế bằng cách sắc ký trên silicagel (20-80% etyl axetat/các hexan) để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế, là chất rắn màu trắng.

Ví dụ tổng hợp 6 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)

Điều chế 2-(3-pyriđinyl)-*N*-[(tetrahyđro-2-furanyl)metyl]pyrazolo[1,5-*a*]pyriđin-5-carboxamit (hợp chất 467)

Bước A: Điều chế 3-(đimetoxymetyl)-5-(3-pyriđinyl)-1*H*-pyrazol

Lithi hexametylđisilan (55mL dung dịch 1,0M trong tetrahyđrofuran, 55mmol) được bổ sung vào dung dịch gồm 3-axetylpyriđin (5,5mL, 50mmol), metyl đimetoxy axetat (6,7mL, 55mmol) và tetrahyđrofuran khan (100mL) cùng với làm lạnh ở -45°C. Hỗn hợp phản ứng thu được được để ấm lên tới 25°C trong khoảng thời gian dài hơn 1 giờ, và được khuấy ở nhiệt độ này trong 3 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được cô dưới áp suất giảm, và phần cặn được tạo huyền phù trong metanol (50mL) và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn thu được được

tạo huyền phù trong metanol (150mL) và được xử lý bằng hyđrazin monohyđrat (2,62mL, 55mmol) và axit axetic băng (6,29mL, 110mmol), và hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt để hồi lưu trong 14 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được làm mát tới 25°C và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được phân bố trong hai lớp etyl axetat (200mL) và dung dịch nước 1N hyđroxit natri (100mL). Các lớp được tách, và lớp hữu cơ được rửa lần lượt bằng dung dịch nước 1N hyđroxit natri (50mL) và nước muối (50mL), được làm khô trên khan magie sulfat, và được cô dưới áp suất giảm để tạo ra 8,83g Hợp chất nêu ở đề mục này là chất rắn màu be.

^{1}H NMR ($CDCl_3$): δ 10,5 (br s, 1H) 9,03 (d, 1H), 8,57 (dd, 1H), 8,09 (dt, 1H), 7,34 (dd, 1H), 6,65 (s, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,39 (s, 6H).

Bước B: Điều chế 5-(3-pyriđinyl)-1*H*-pyrazol-3-carboxalđehyt

Dung dịch gồm sản phẩm của Bước A (715mg, 3,3mmol) và clorofom (5mL) được bổ sung dung dịch gồm axit trifloroaxetic (2,5mL) và nước (2,5mL); nhiệt độ hỗn hợp phản ứng này được duy trì dưới 5°C bằng bể đá-nước. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở 0-5 °C trong 2 giờ, được xử lý bằng trietylamin (5mL) ở 0°C, được khuấy trong 15 phút, được xử lý bằng nước (10mL), và được lọc để tách chất rắn màu nâu. Chất rắn này được rửa bằng clorofom (20mL) và nước (20mL), và không khí được làm khô để tạo ra 605mg Hợp chất nêu ở đề mục này là chất rắn màu be nhạt mà nó được dùng luôn ở bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

Bước C: Điều chế etyl este của axit 2-(3-pyriđinyl)pyrazolo[1,5-*a*]pyriđin-5-carboxylic

Hỗn hợp gồm sản phẩm của Bước B (596mg, 3,4mmol), etyl-4-bromocrotonat (75%, 0,95mL, 5,2mmol), kali cacbonat khan (1,42g, 10,3mmol) và khan *N*,*N*-đimetylformamit (17mL) được khuấy ở 25°C trong 14 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được phân bố trong hai lớp etyl axetat và dung dịch nước amoni clorua bão hòa, và lớp hữu cơ được tách ra, được rửa bằng nước (3X), nước muối, được làm khô trên khan magie sulfat, và được cô dưới áp suất giảm để tạo

ra sản phẩm thô. Sản phẩm thu được này được tinh chế bằng MPLC trên cột 24g silic oxit rửa giải bằng từ 0 tới 100% etyl axetat trong các hexan để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này là chất rắn màu be nhạt (105mg).

^{1}H NMR ($CDCl_3$): δ 9,20 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,27 (dt, 1H), 7,43-7,35 (m, 2H), 7,05 (s, 1H), 4,43 (q, 2H), 1,44 (t, 3H).

Bước D: Điều chế 2-(3-pyriđinyl)-*N*-[(tetrahyđro-2-furanyl)metyl]pyrazolo[1.5-*a*]pyriđin-5-carboxamit

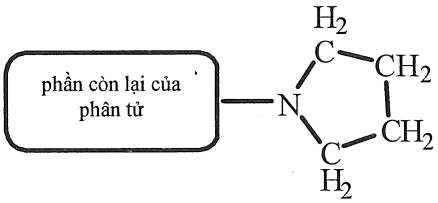
Dung dịch gồm sản phẩm của Bước C (31mg, 0,11mmol), tetrahyđrofurfurylamin (0,12mL, 1,2mmol), và khan toluen (2,3mL) được bổ sung trimetylalumini (0,6mL dung dịch 2,0M trong toluen, 1,2mmol). Dung dịch thu được được khuấy trong 2 giờ ở 25°C, trong 2 giờ ở 80°C, và sau đó được làm lạnh xuống 0°C và được xử lý một cách cẩn thận bằng nước (3mL). Hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở 25°C trong 15 phút, được xử lý bằng dung dịch bão hòa của natri-kali tartrat (2mL), được khuấy trong 30 phút, và sau đó được phân bố trong hai lớp điclorometan và nước. Lớp hữu cơ được tách ra, được làm khô trên khan magie sulfat, và được cô dưới áp suất giảm để tách phần cặn màu nâu mà nó được nghiền thành bột cùng với đietyl ete để tạo ra Hợp chất nêu ở đề mục này, là hợp chất theo sáng chế, là chất rắn màu be (15mg).

^{1}H NMR ($CDCl_3$): δ 9,19 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,26 (dt, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,60 (br s, 1H), 4,10 (qd, 1H), 3,93 (dt, 1H), 3,89-3,76 (m, 2H), 3,38-3,29 (m, 1H), 2,11-2,02 (m, 1H), 2,00-1,83 (m, 3H).

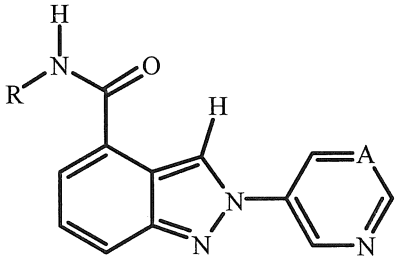
Bằng các phương pháp được mô tả trong bản mô tả cùng với các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này, các hợp chất nêu trong các Bảng 1 tới 24d có thể được điều chế. Các chữ viết tắt sau được dùng trong các bảng ở dưới: *t* chỉ bậc ba, *s* chỉ bậc hai, *i* chỉ iso, *c* chỉ xyclo, Me chỉ metyl, Et chỉ etyl, Pr chỉ propyl, Bu chỉ butyl, Ph chỉ phenyl, OMe chỉ metoxy, OEt chỉ etoxy, SMe chỉ

metylthio, SEt chỉ etylthio, -CN chỉ xyano, Ph chỉ phenyl, Py chỉ pyriđinyl, -NO_2 chỉ nitro, S(O)Me chỉ metylsulfinyl, và $S(O)_2Me$ chỉ metylsulfonyl.

Ký hiệu "-" ở đầu một đoạn công thức biểu thị cho điểm gắn của đoạn này vào phần còn lại của phân tử; ví dụ, "-CH_2CH_2OMe" biểu thị cho đoạn 2-metoxyetyl. Các đoạn vòng được thể hiện bởi việc sử dụng hai ký hiệu "-" nằm trong ngoặc; ví dụ, đoạn 1-pyroliđinyl được thể hiện bằng công thức "N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)", trong đó nguyên tử nitơ được liên kết với cả nguyên tử cacbon đầu cuối của mạch gồm bốn cacbon, như được minh họa ở dưới.



Bảng 1a



A là CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH_2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH_2Ph	-$CH_2CH{=}CH_2$
-$CH_2C{=}CH$	-$C(Me)_2C{=}CH$	-CH_2CH_2F
-CH_2CHF_2	-CH_2CF_3	-$CH(Me)CF_3$
-$CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CF_2CF_3$	-$CH_2CF_2CH_3$
-$CH_2CH_2CF_2CF_3$	-CH(i-Pr)CF_3	-CH_2CH_2OMe
-CH_2OEt	-CH_2CH_2O(i-Pr)	-CH_2CH_2OEt
-$CH_2CH_2CH_2OMe$	-$CH_2CH(Me)OMe$	-$CH(Et)CH_2OMe$
-$CH(Me)CH_2OMe$	-$CH_2CH_2S(O)Me$	-CH_2CH_2SMe

$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-difloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahydro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-difloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyridinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyridinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyridinyl)	-NH(3-pyridinyl)
-NH(4-pyridinyl)	-NH(2-pyrimidinyl)	-NH(4-pyrimidinyl)
-NH(5-pyrimidinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyridinyl)	-NH(4-metyl-2-pyridinyl)
-NH(3-metyl-2-pyridinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metyl-2-pyridinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2$(6-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyridinyl)
$-CH_2$(2-pyrimidinyl)	$-CH_2(3\text{-}(OCF_3)\text{phenyl})$	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyridinyl)	$-CH_2$(2-pyridinyl)
Ph	3-pyridinyl	$-CH_2$(3-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
4-pyridinyl	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyridinyl)

3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

A là CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH_2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH_2Ph	-$CH_2CH{=}CH_2$
-$CH_2C{=}CH$	-C(Me)$_2$C=CH	-CH_2CH_2F
-CH_2CHF_2	-CH_2CF_3	-CH(Me)CF_3
-$CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CF_2CF_3$	-$CH_2CF_2CH_3$
-$CH_2CH_2CF_2CF_3$	-CH(i-Pr)CF_3	-CH_2CH_2OMe
-CH_2OEt	-CH_2CH_2O(i-Pr)	-CH_2CH_2OEt
-$CH_2CH_2CH_2$OMe	-CH_2CH(Me)OMe	-CH(Et)CH_2OMe
-CH(Me)CH_2OMe	-CH_2CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2SMe
-CH_2CH_2SEt	-$CH_2CH_2SO_2$Me	-$CH_2CH_2SO_2$Et
-CH_2CH_2S(O)Et	-CH_2CH_2S(O)(t-Bu)	-CH_2CH_2S(t-Bu)
-CH(Me)CH_2SMe	-$CH_2CH_2SO_2$(t-Bu)	-CH(Me)CH_2SO_2Me
-CH(Me)CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3	-$CH_2CH_2SCH_2CF_3$
-$CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
-CH_2CH_2S(O)$CH_2CH_2CF_3$	-CH_2CN	-CH_2CH_2CN
-C(Me)$_2$CN	-CH_2CH_2N(i-Pr)$_2$	-CH_2CH_2N(Me)$_2$
-CH2CH(OMe)$_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH_2(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH_2(CH(-OC(Me)$_2$OCH_2-))	-CH_2(tetrahyđro-2-furanyl)
-CH_2(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	-CH_2(2-thienyl)
-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)	-CH_2CO_2Me	-CH_2(2,2-đifloroxyclopropyl)
-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me	-CH(Me)CO_2Et	-CH(i-Pr)CO_2Me
-CH_2C(O)NHMe	-CH_2C(O)NMe$_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH_2(c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe$_2$
-O$CH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO_2Me	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	-NH(CH_2CF_3)
-NHC(O)CF_3	-NHCO_2Et	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	-NH$CO_2CH_2CF_3$	-C(O)CO_2Me
-C(O)(2-pyriđinyl)	-NHC(O)NMe$_2$	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH_2CF_3	-NHC(O)$CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH_2CF_3	-NHSO_2CF_3	-NH$SO_2CH_2CF_3$
-NH$SO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)

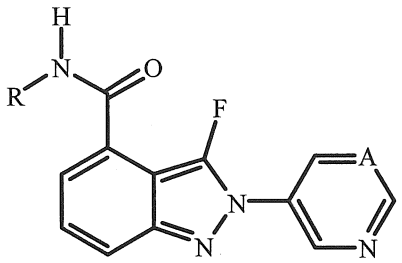
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	-NH(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-brom-2-pyriđinyl)
-CH_2(2-pyrimiđinyl)	-CH_2(3-(OCF_3)phenyl)	-CH_2(2-thiazolyl)
-CH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH_2(4-pyriđinyl)	-CH_2(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	-CH_2(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	-CH_2CH_2(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	-$CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

A là N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH_2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH_2Ph	-CH_2CH=CH_2
-CH_2C=CH	-C(Me)$_2$C=CH	-CH_2CH_2F
-CH_2CHF_2	-CH_2CF_3	-CH(Me)CF_3
-$CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CF_2CF_3$	-$CH_2CF_2CH_3$
-$CH_2CH_2CF_2CF_3$	-CH(i-Pr)CF_3	-CH_2CH_2OMe
-CH_2OEt	-CH_2CH_2O(i-Pr)	-CH_2CH_2OEt
-$CH_2CH_2CH_2$OMe	-CH_2CH(Me)OMe	-CH(Et)CH_2OMe
-CH(Me)CH_2OMe	-CH_2CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2SMe
-CH_2CH_2SEt	-$CH_2CH_2SO_2$Me	-$CH_2CH_2SO_2$Et
-CH_2CH_2S(O)Et	-CH_2CH_2S(O)(t-Bu)	-CH_2CH_2S(t-Bu)
-CH(Me)CH_2SMe	-$CH_2CH_2SO_2$(t-Bu)	-CH(Me)CH_2SO_2Me
-CH(Me)CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3	-$CH_2CH_2SCH_2CF_3$
-$CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
-CH_2CH_2S(O)$CH_2CH_2CF_3$	-CH_2CN	-CH_2CH_2CN
-C(Me)$_2$CN	-CH_2CH_2N(i-Pr)$_2$	-CH_2CH_2N(Me)$_2$
-CH2CH(OMe)$_2$	c-Pr	c-Bu

1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-difloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahydro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-difloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyridinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyridinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyridinyl)	-NH(3-pyridinyl)
-NH(4-pyridinyl)	-NH(2-pyrimidinyl)	-NH(4-pyrimidinyl)
-NH(5-pyrimidinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyridinyl)	-NH(4-metyl-2-pyridinyl)
-NH(3-metyl-2-pyridinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metyl-2-pyridinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2$(6-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyridinyl)
$-CH_2$(2-pyrimidinyl)	$-CH_2(3\text{-}(OCF_3)\text{phenyl})$	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyridinyl)	$-CH_2$(2-pyridinyl)
Ph	3-pyridinyl	$-CH_2$(3-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
4-pyridinyl	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
$3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$	$6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$
$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrazinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imidazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimidinyl)	pyridazinyl	$6\text{-}CF_3\text{-}3\text{-pyrazinyl}$

Bảng 1b



A là CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH=CH_2$
$-CH_2C=CH$	$-C(Me)_2C=CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH=CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$

-C(O)(2-pyriđinyl)	-NHC(O)NMe_2	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)$NHCH_2CF_3$	-NHC(O)$CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH_2CF_3	-$NHSO_2CF_3$	-$NHSO_2CH_2CF_3$
-$NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	-NH(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-brom-2-pyriđinyl)
-CH_2(2-pyrimiđinyl)	-CH_2(3-(OCF_3)phenyl)	-CH_2(2-thiazolyl)
-CH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH_2(4-pyriđinyl)	-CH_2(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	-CH_2(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	-CH_2CH_2(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	-$CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

A là CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH_2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH_2Ph	-$CH_2CH{=}CH_2$
-CH_2C=CH	-C(Me)$_2$C=CH	-CH_2CH_2F
-CH_2CHF_2	-CH_2CF_3	-CH(Me)CF_3
-$CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CF_2CF_3$	-$CH_2CF_2CH_3$
-$CH_2CH_2CF_2CF_3$	-CH(i-Pr)CF_3	-CH_2CH_2OMe
-CH_2OEt	-CH_2CH_2O(i-Pr)	-CH_2CH_2OEt
-$CH_2CH_2CH_2OMe$	-CH_2CH(Me)OMe	-CH(Et)CH_2OMe
-CH(Me)CH_2OMe	-CH_2CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2SMe
-CH_2CH_2SEt	-$CH_2CH_2SO_2Me$	-$CH_2CH_2SO_2Et$
-CH_2CH_2S(O)Et	-CH_2CH_2S(O)(t-Bu)	-CH_2CH_2S(t-Bu)
-CH(Me)CH_2SMe	-$CH_2CH_2SO_2$(t-Bu)	-CH(Me)CH_2SO_2Me
-CH(Me)CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3	-$CH_2CH_2SCH_2CF_3$

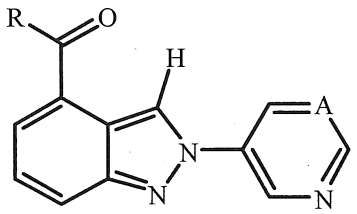
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-difloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahydro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-difloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyridinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyridinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyridinyl)	-NH(3-pyridinyl)
-NH(4-pyridinyl)	-NH(2-pyrimidinyl)	-NH(4-pyrimidinyl)
-NH(5-pyrimidinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyridinyl)	-NH(4-metyl-2-pyridinyl)
-NH(3-metyl-2-pyridinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metyl-2-pyridinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2$(6-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyridinyl)
$-CH_2$(2-pyrimidinyl)	$-CH_2(3\text{-}(OCF_3)\text{phenyl})$	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyridinyl)	$-CH_2$(2-pyridinyl)
Ph	3-pyridinyl	$-CH_2$(3-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
4-pyridinyl	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
$3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$	$6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$
$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrazinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imidazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimidinyl)	pyridazinyl	$6\text{-}CF_3\text{-}3\text{-pyrazinyl}$

A là N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH{=}CH_2$
$-CH_2C{=}CH$	$-C(Me)_2C{=}CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyriđinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimiđinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimiđinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)

-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-brom-2-pyriđinyl)
-CH_2(2-pyrimiđinyl)	-CH_2(3-(OCF_3)phenyl)	-CH_2(2-thiazolyl)
-CH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH_2(4-pyriđinyl)	-CH_2(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	-CH_2(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	-CH_2CH_2(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	-$CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

Bảng 1c



A là CH

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-CH_2CH(OMe)CH_2-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-CH_2CH_2N(C(O)(c-Pr))CH_2CH_2-)	N(-CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2-)
N(-CH_2C(Me)$_2$N=CH-)	N(-$CH_2CH_2CH_2$CH(CF_3)CH_2-)
N(CH_2C=CH)$_2$	N(Et)$_2$
N(Pr)CH_2(c-Pr)	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

A là CF

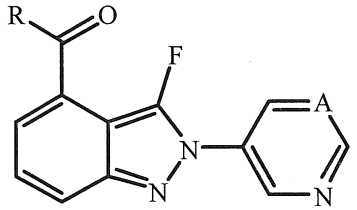
R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-CH_2CH(OMe)CH_2-)

N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

A là N

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

Bảng 1d



A là CH

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

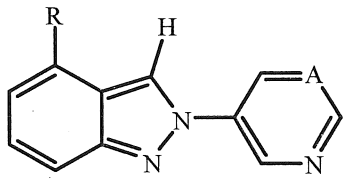
A là CF

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

A là N

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

Bảng 1e



A là CH

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl

4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là CF

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl

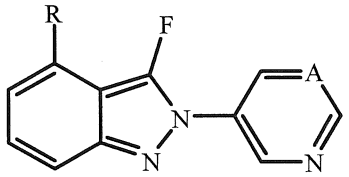
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là N

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl

4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

Bảng 1f



A là CH

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl

3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là CF

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl

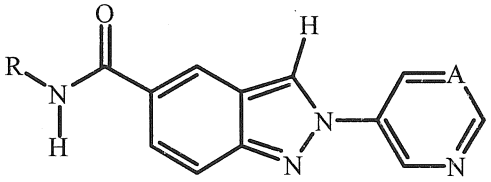
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là N

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl

3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(trifloromethyl)phenyl	3-(trifloromethyl)phenyl
4-(trifloromethyl)phenyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

Bảng 2a



A là CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH{=}CH_2$
$-CH_2C{=}CH$	$-C(Me)_2C{=}CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	$-CH(Me)C(O)NHMe$
$-CH(Me)C(O)NH(t\text{-}Bu)$	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyriđinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et

-NHC(O)CH_2CF_3	-$NHSO_2CF_3$	-$NHSO_2CH_2CF_3$
-$NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	-NH(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-brom-2-pyriđinyl)
-CH_2(2-pyrimiđinyl)	-CH_2(3-(OCF_3)phenyl)	-CH_2(2-thiazolyl)
-CH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH_2(4-pyriđinyl)	-CH_2(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	-CH_2(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	-CH_2CH_2(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	-$CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

A là CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH_2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH_2Ph	-$CH_2CH{=}CH_2$
-$CH_2C{=}CH$	-$C(Me)_2C{=}CH$	-CH_2CH_2F
-CH_2CHF_2	-CH_2CF_3	-CH(Me)CF_3
-$CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CF_2CF_3$	-$CH_2CF_2CH_3$
-$CH_2CH_2CF_2CF_3$	-CH(i-Pr)CF_3	-CH_2CH_2OMe
-CH_2OEt	-CH_2CH_2O(i-Pr)	-CH_2CH_2OEt
-$CH_2CH_2CH_2OMe$	-CH_2CH(Me)OMe	-CH(Et)CH_2OMe
-CH(Me)CH_2OMe	-CH_2CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2SMe
-CH_2CH_2SEt	-$CH_2CH_2SO_2Me$	-$CH_2CH_2SO_2Et$
-CH_2CH_2S(O)Et	-CH_2CH_2S(O)(t-Bu)	-CH_2CH_2S(t-Bu)
-CH(Me)CH_2SMe	-$CH_2CH_2SO_2$(t-Bu)	-CH(Me)CH_2SO_2Me
-CH(Me)CH_2S(O)Me	-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3	-$CH_2CH_2SCH_2CF_3$
-$CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	-$CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
-CH_2CH_2S(O)$CH_2CH_2CF_3$	-CH_2CN	-CH_2CH_2CN

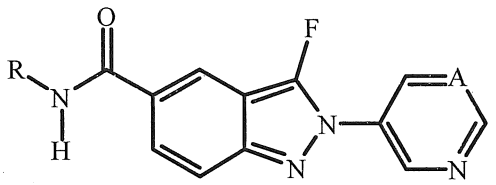
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-difloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahydro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-difloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyridinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyridinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyridinyl)	-NH(3-pyridinyl)
-NH(4-pyridinyl)	-NH(2-pyrimidinyl)	-NH(4-pyrimidinyl)
-NH(5-pyrimidinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyridinyl)	-NH(4-metyl-2-pyridinyl)
-NH(3-metyl-2-pyridinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metyl-2-pyridinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2$(6-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyridinyl)
$-CH_2$(2-pyrimidinyl)	$-CH_2(3\text{-}(OCF_3)\text{phenyl})$	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyridinyl)	$-CH_2$(2-pyridinyl)
Ph	3-pyridinyl	$-CH_2$(3-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
4-pyridinyl	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
$3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$	$6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$
$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrazinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imidazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimidinyl)	pyridazinyl	$6\text{-}CF_3\text{-}3\text{-pyrazinyl}$

A là N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH{=}CH_2$
$-CH_2C{=}CH$	$-C(Me)_2C{=}CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxycloprpyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyriđinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimiđinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyriđinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimiđinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)

-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-CF_3-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-CF_3-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-CF_3-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-CF_3-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-metyl-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(3-(OCF_3)phenyl)	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyriđinyl)	$-CH_2$(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	$-CH_2$(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

Bảng 2b



A là CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH=CH_2$
$-CH_2C=CH$	$-C(Me)_2C=CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$

$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-difloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahydro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-difloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH{=}CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyridinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyridinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyridinyl)	-NH(3-pyridinyl)
-NH(4-pyridinyl)	-NH(2-pyrimidinyl)	-NH(4-pyrimidinyl)
-NH(5-pyrimidinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	-NH(6-metyl-2-pyridinyl)	-NH(4-metyl-2-pyridinyl)
-NH(3-metyl-2-pyridinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metyl-2-pyridinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimidinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyridinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyridinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl})$
$-CH_2(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl})$	$-CH_2$(6-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyridinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyridinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimidinyl)	$-CH_2$(5-pyrimidinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyridinyl)
$-CH_2$(2-pyrimidinyl)	$-CH_2(3\text{-}(OCF_3)\text{phenyl})$	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyridinyl)	$-CH_2$(2-pyridinyl)
Ph	3-pyridinyl	$-CH_2$(3-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
4-pyridinyl	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyridinyl)
$3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$	$6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$
$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyridinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrazinyl}$	$5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-pyrimidinyl}$
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imidazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimidinyl)	pyridazinyl	$6\text{-}CF_3\text{-}3\text{-pyrazinyl}$

A là CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH=CH_2$
$-CH_2C=CH$	$-C(Me)_2C=CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)
$-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me$	$-CH(Me)CO_2Et$	$-CH(i\text{-}Pr)CO_2Me$
$-CH_2C(O)NHMe$	$-CH_2C(O)NMe_2$	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	$-OCH_2$(c-Pr)	$-CH(Me)C(O)NMe_2$
$-OCH_2CH=CH_2$	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
$-NHCO_2Me$	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	$-NH(CH_2CF_3)$
$-NHC(O)CF_3$	$-NHCO_2Et$	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	$-NHCO_2CH_2CF_3$	$-C(O)CO_2Me$
-C(O)(2-pyriđinyl)	$-NHC(O)NMe_2$	-NHC(O)NHMe
$-NHC(O)NHCH_2CF_3$	$-NHC(O)CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
$-NHC(O)CH_2CF_3$	$-NHSO_2CF_3$	$-NHSO_2CH_2CF_3$
$-NHSO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	$-NH(6\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyriđinyl)	$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyriđinyl)
$-NH(3\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyriđinyl)	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyrimiđinyl)	$-NH(5\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyriđinyl)
$-NH(4\text{-}CF_3\text{-}2\text{-}$pyrimiđinyl)	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)

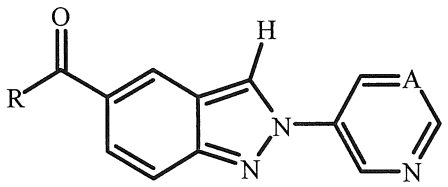
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-CF_3-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-CF_3-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-CF_3-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-CF_3-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-metyl-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-metyl-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-metyl-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-metyl-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-metoxy-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(4-metoxy-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(3-metoxy-2-pyriđinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-metoxy-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(5-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(6-brom-2-pyriđinyl)
$-CH_2$(2-pyrimiđinyl)	$-CH_2$(3-(OCF_3)phenyl)	$-CH_2$(2-thiazolyl)
$-CH_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	$-CH_2$(4-pyriđinyl)	$-CH_2$(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	$-CH_2$(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	$-CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	$-CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
$-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)$	$-CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	$-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)$
$-CH_2$(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

A là N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-CH_2$(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-CH_2Ph$	$-CH_2CH=CH_2$
$-CH_2C=CH$	$-C(Me)_2C=CH$	$-CH_2CH_2F$
$-CH_2CHF_2$	$-CH_2CF_3$	$-CH(Me)CF_3$
$-CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CF_2CF_3$	$-CH_2CF_2CH_3$
$-CH_2CH_2CF_2CF_3$	$-CH(i\text{-}Pr)CF_3$	$-CH_2CH_2OMe$
$-CH_2OEt$	$-CH_2CH_2O(i\text{-}Pr)$	$-CH_2CH_2OEt$
$-CH_2CH_2CH_2OMe$	$-CH_2CH(Me)OMe$	$-CH(Et)CH_2OMe$
$-CH(Me)CH_2OMe$	$-CH_2CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2SMe$
$-CH_2CH_2SEt$	$-CH_2CH_2SO_2Me$	$-CH_2CH_2SO_2Et$
$-CH_2CH_2S(O)Et$	$-CH_2CH_2S(O)(t\text{-}Bu)$	$-CH_2CH_2S(t\text{-}Bu)$
$-CH(Me)CH_2SMe$	$-CH_2CH_2SO_2(t\text{-}Bu)$	$-CH(Me)CH_2SO_2Me$
$-CH(Me)CH_2S(O)Me$	$-CH_2CH_2S(O)CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CF_3$
$-CH_2CH_2SO_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SO_2CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2CF_3$
$-CH_2CH_2S(O)CH_2CH_2CF_3$	$-CH_2CN$	$-CH_2CH_2CN$
$-C(Me)_2CN$	$-CH_2CH_2N(i\text{-}Pr)_2$	$-CH_2CH_2N(Me)_2$
$-CH2CH(OMe)_2$	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxyxyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3.3-đifloroxyclobutyl
3-oxetanyl	$-CH_2$(oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-đioxit
3-thietanyl-1-oxit	$-CH_2(CH(-OC(Me)_2OCH_2-))$	$-CH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)
$-CH_2$(2-furanyl)	tetrahyđro-2-furanyl	$-CH_2$(2-thienyl)
$-CH_2(CH(-OCH_2CH_2O-)$	$-CH_2CO_2Me$	$-CH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)

-C(-CH_2CH_2-)CO_2Me	-CH(Me)CO_2Et	-CH(i-Pr)CO_2Me
-CH_2C(O)NHMe	-CH_2C(O)NMe_2	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH_2(c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe_2
-OCH_2CH=CH_2	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO_2Me	-NHC(O)(3-pyriđinyl)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexyl)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-thienyl)	-NH(CH_2CF_3)
-NHC(O)CF_3	-NHCO_2Et	-NHC(O)(2-furanyl)
-C(O)C(O)Me	-NH$CO_2CH_2CF_3$	-C(O)CO_2Me
-C(O)(2-pyriđinyl)	-NHC(O)NMe_2	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH_2CF_3	-NHC(O)$CH_2CH_2CF_3$	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH_2CF_3	-NHSO_2CF_3	-NH$SO_2CH_2CF_3$
-NH$SO_2CH_2CH_2CF_3$	-NH(2-pyriđinyl)	-NH(3-pyriđinyl)
-NH(4-pyriđinyl)	-NH(2-pyrimiđinyl)	-NH(4-pyrimiđinyl)
-NH(5-pyrimiđinyl)	-NH(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-NH(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(4-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(3-metyl-2-pyriđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metyl-2-pyriđinyl)
-NH(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-NH(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-NH(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-NH(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-CF_3-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-CF_3-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-CF_3-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metyl-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metyl-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metyl-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(4-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(3-metoxy-2-pyriđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-metoxy-2-pyriđinyl)
-CH_2(4-metoxy-2-pyrimiđinyl)	-CH_2(5-pyrimiđinyl)	-CH_2(6-brom-2-pyriđinyl)
-CH_2(2-pyrimiđinyl)	-CH_2(3-(OCF_3)phenyl)	-CH_2(2-thiazolyl)
-CH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH_2(4-pyriđinyl)	-CH_2(2-pyriđinyl)
Ph	3-pyriđinyl	-CH_2(3-pyriđinyl)
2-pyriđinyl	2-pyrazinyl	-CH_2CH_2(2-pyriđinyl)
4-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyriđinyl	-$CH_2CH_2CH_2$(2-pyriđinyl)
3-CF_3-2-pyriđinyl	4-CF_3-2-pyrimiđinyl	6-CF_3-2-pyriđinyl
5-CF_3-2-pyriđinyl	5-CF_3-2-pyrazinyl	5-CF_3-2-pyrimiđinyl
-CH_2CH_2N(-C(O)CH_2CH_2C(O)-)	-$CH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	-CH(-C(O)OCH_2CH_2-)
-CH_2(4-pyrimiđinyl)	pyriđazinyl	6-CF_3-3-pyrazinyl

Bảng 2c



A là CH

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

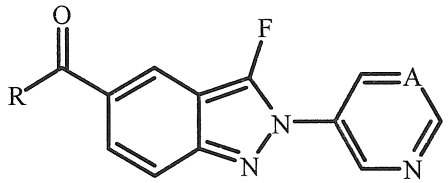
A là CF

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

A là N

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
$N(Pr)CH_2(c\text{-}Pr)$	N(Et)(c-hexyl)
N(-$CHC(O)SCH_2CH_2$-)	

Bảng 2d



A là CH

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
N(Pr)CH_2(c-Pr)	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

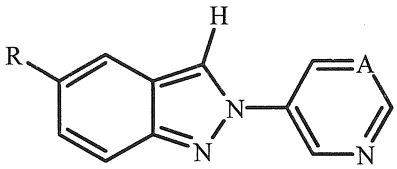
A là CF

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
N(Pr)CH_2(c-Pr)	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

A là N

R	R
N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH(OMe)CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CF_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CF_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2SCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2OCH_2CH_2$-)
N(-$CH_2CH_2N(C(O)(c\text{-}Pr))CH_2CH_2$-)	N(-$CH_2CH_2N(Me)CH_2CH_2$-)
N(-$CH_2C(Me)_2N{=}CH$-)	N(-$CH_2CH_2CH_2CH(CF_3)CH_2$-)
$N(CH_2C{=}CH)_2$	$N(Et)_2$
N(Pr)CH_2(c-Pr)	N(Et)(c-hexyl)
N(-CHC(O)SCH_2CH_2-)	

Bảng 2e



A là CH

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromety)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromety)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromety)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromety)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromety)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromety)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromety)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromety)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromety)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromety)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromety)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromety)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromety)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromety)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromety)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromety)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromety)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromety)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromety)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromety)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromety)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl

4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là CF

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl

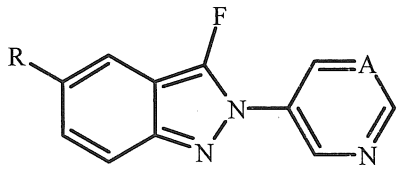
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là N

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl

1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

Bảng 2f



A là CH

R	R
3-metyl-2-pyrđinyl	3-metoxy-2-pyrđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrđinyl
4-metyl-2-pyrđinyl	4-metoxy-2-pyrđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrđinyl
5-metyl-2-pyrđinyl	5-metoxy-2-pyrđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrđinyl
6-metyl-2-pyrđinyl	6-metoxy-2-pyrđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrđinyl
2-metyl-3-pyrđinyl	2-metoxy-3-pyrđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyrđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyrđinyl
4-metyl-3-pyrđinyl	4-metoxy-3-pyrđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyrđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyrđinyl
5-metyl-3-pyrđinyl	5-metoxy-3-pyrđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyrđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyrđinyl
6-metyl-3-pyrđinyl	6-metoxy-3-pyrđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyrđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyrđinyl
2-metyl-4-pyrđinyl	2-metoxy-4-pyrđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrđinyl
3-metyl-4-pyrđinyl	3-metoxy-4-pyrđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyrđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyrđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl

4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là CF

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl

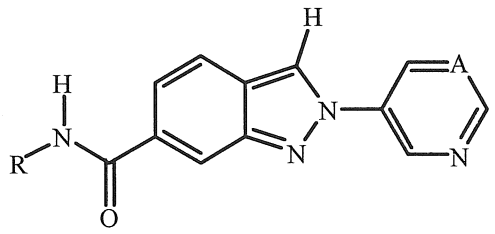
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

A là N

R	R
3-metyl-2-pyriđinyl	3-metoxy-2-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
4-metyl-2-pyriđinyl	4-metoxy-2-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
5-metyl-2-pyriđinyl	5-metoxy-2-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
6-metyl-2-pyriđinyl	6-metoxy-2-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyriđinyl
2-metyl-3-pyriđinyl	2-metoxy-3-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
4-metyl-3-pyriđinyl	4-metoxy-3-pyriđinyl
4-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
5-metyl-3-pyriđinyl	5-metoxy-3-pyriđinyl
5-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
6-metyl-3-pyriđinyl	6-metoxy-3-pyriđinyl
6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyriđinyl
2-metyl-4-pyriđinyl	2-metoxy-4-pyriđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-4-pyriđinyl	3-metoxy-4-pyriđinyl
3-(trifloromethyl)-4-pyriđinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyriđinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxy-2-pyrazinyl
3-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxy-2-pyrazinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxy-2-pyrazinyl
6-(trifloromethyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimiđinyl	4-metoxy-2-pyrimiđinyl
4-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
5-metyl-2-pyrimiđinyl	5-metoxy-2-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-2-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimiđinyl
2-metyl-4-pyrimiđinyl	2-metoxy-4-pyrimiđinyl
2-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
5-metyl-4-pyrimiđinyl	5-metoxy-4-pyrimiđinyl
5-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
6-metyl-4-pyrimiđinyl	6-metoxy-4-pyrimiđinyl
6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimiđinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxy-1-pyrazolyl
3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxy-1-pyrazolyl
4-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxy-1-pyrazolyl
5-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxy-1,2,3-triazin-2-yl

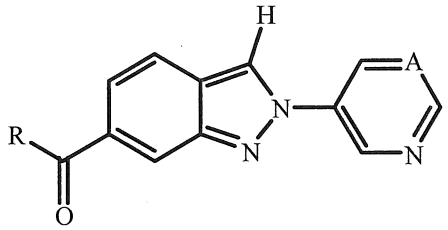
4-(trifloromethyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimiđinyl)-2-pyriđinyl	2-(2-pyriđinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimiđinyl)etynyl
1,3,4-oxađiazol-2-yl	tetrahyđro-3-furanyl
tetrahyđro-2-furanyl	4,5-đihyđro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	6-(trifloromethyl)-3-pyrazinyl

Bảng 3a



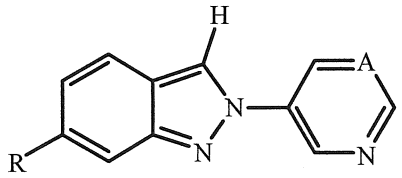
Bảng 3a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 3c



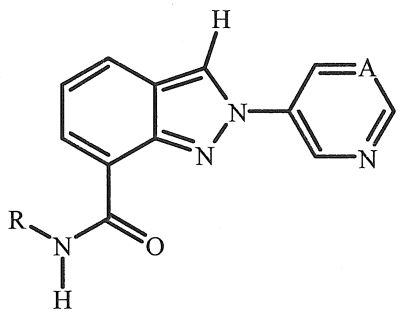
Bảng 3c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 3e



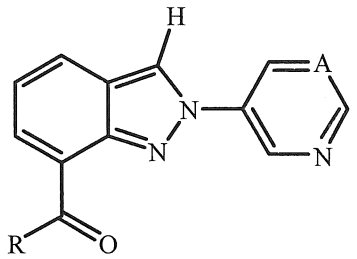
Bảng 3e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 4a



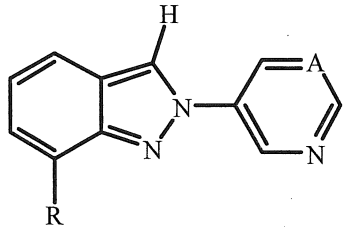
Bảng 4a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 4c



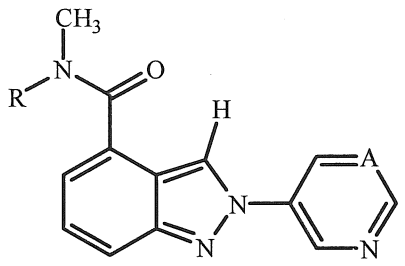
Bảng 4c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 4e



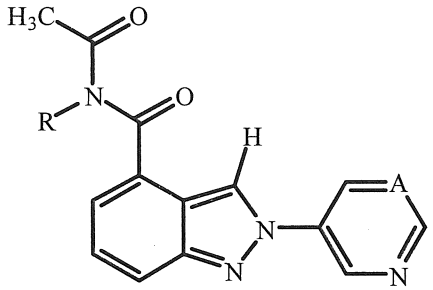
Bảng 4e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5a



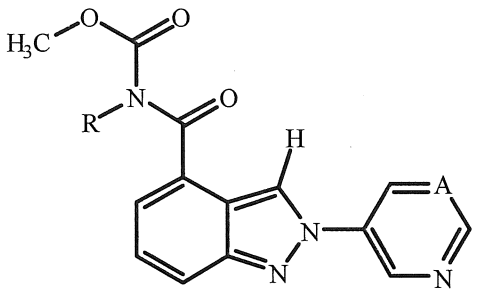
Bảng 5a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5b



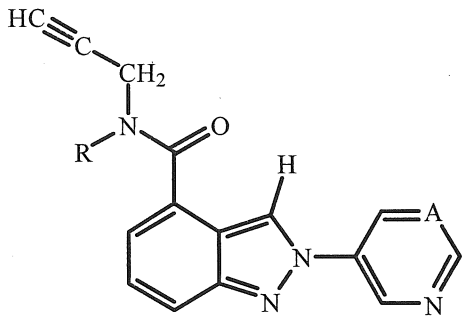
Bảng 5b là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5c



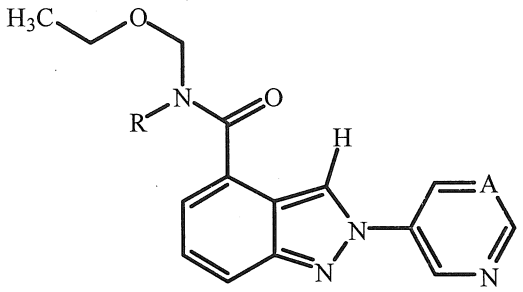
Bảng 5c là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5d



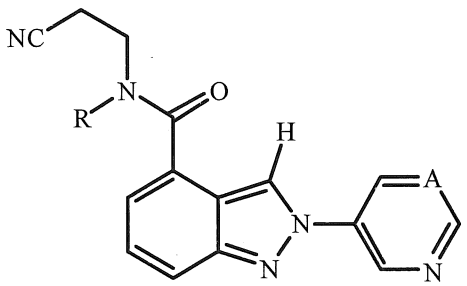
Bảng 5d là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5e



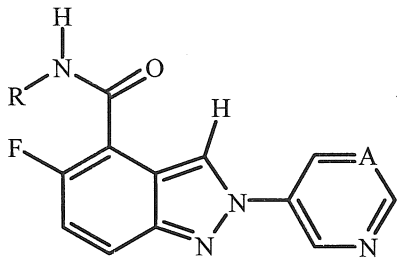
Bảng 5e là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 5f



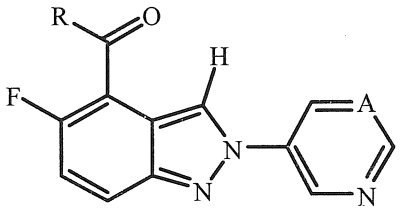
Bảng 5f là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 6a



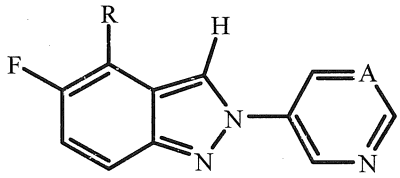
Bảng 6a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 6c



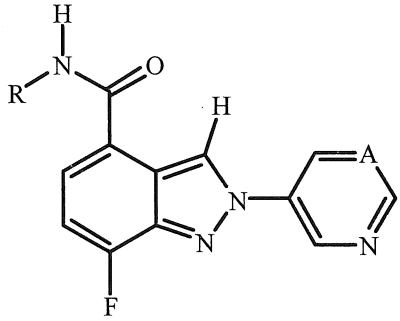
Bảng 6c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 6e



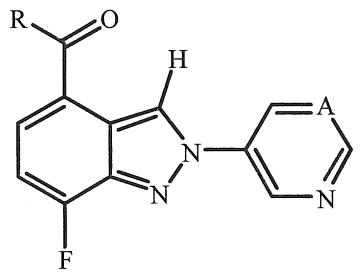
Bảng 6e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 7a



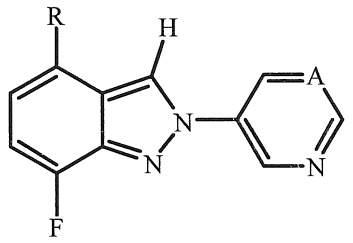
Bảng 7a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 7c



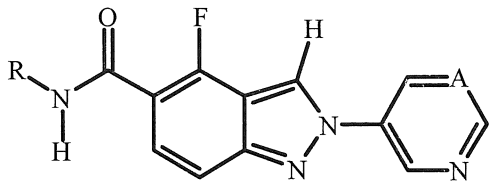
Bảng 7c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 7e



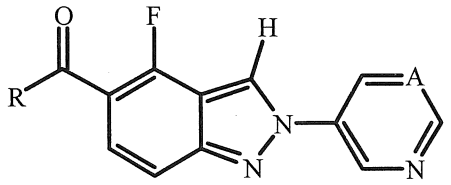
Bảng 7e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 8a



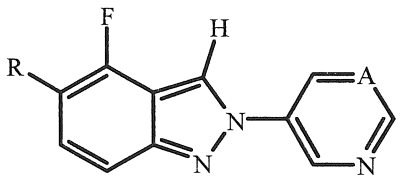
Bảng 8a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 8c



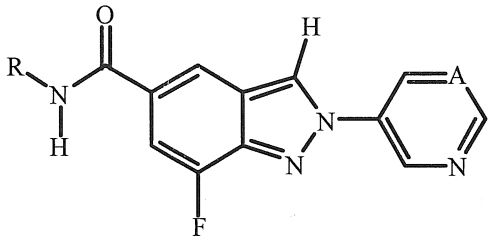
Bảng 8c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 8e



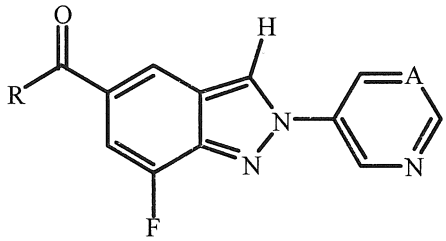
Bảng 8e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 9a



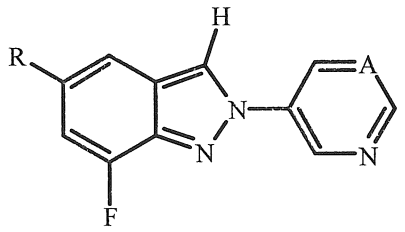
Bảng 9a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 9c



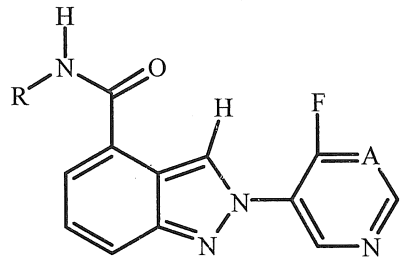
Bảng 9c là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 9e



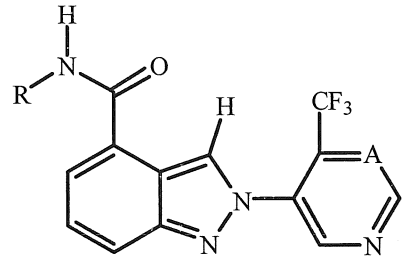
Bảng 9e là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 10a



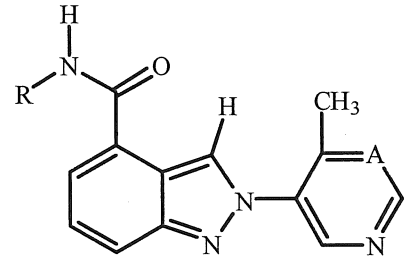
Bảng 10a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 10b



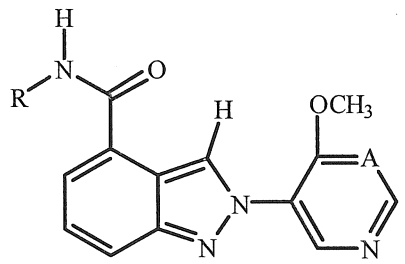
Bảng 10b là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 10c



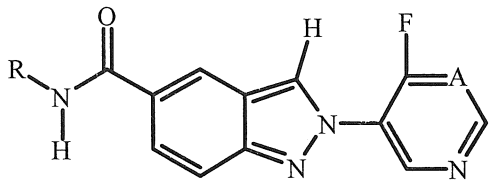
Bảng 10c là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 10d



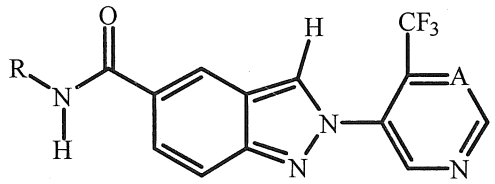
Bảng 10d là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 11a



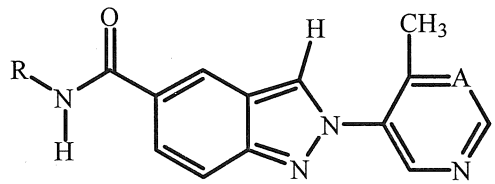
Bảng 11a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 11b



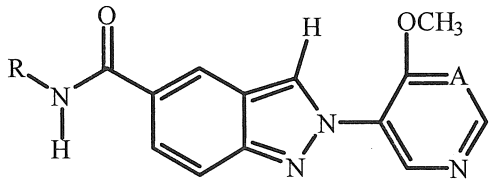
Bảng 11b là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 11c



Bảng 11c là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 11d



Bảng 11d là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 20a

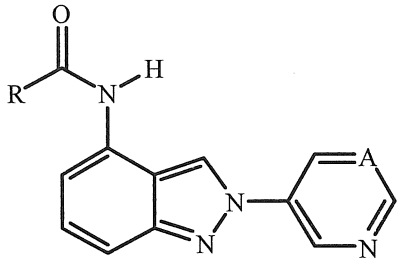


Table 20a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 20b

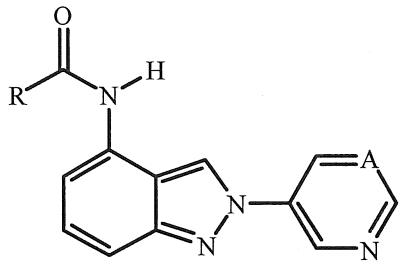


Table 20b là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 21a

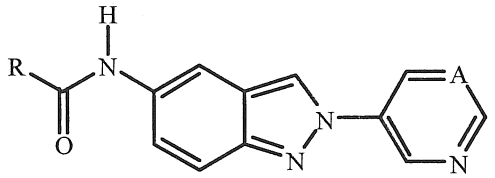


Table 21a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 21b

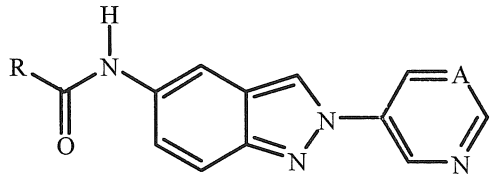
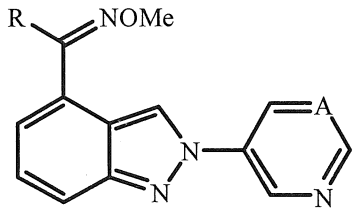


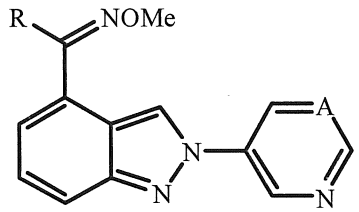
Table 21b là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 22a



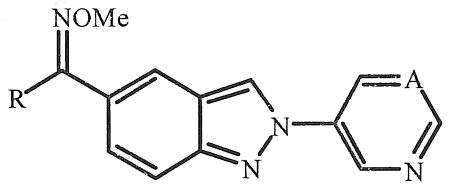
Bảng 22a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 22b



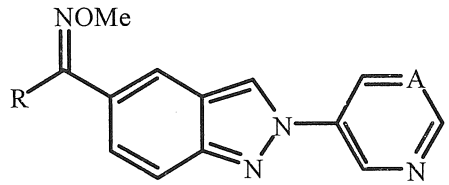
Bảng 22b là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 23a



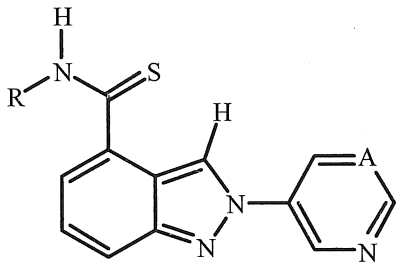
Bảng 23a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 23b



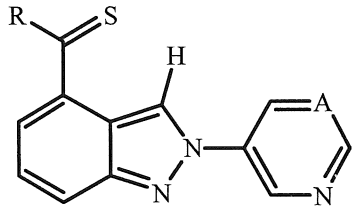
Bảng 23b là giống hệt Bảng 1e, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1e" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 24a



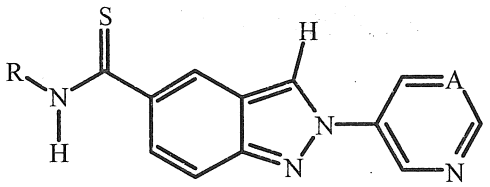
Bảng 24a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 24b



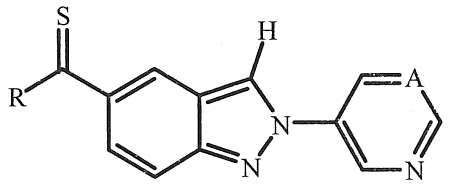
Bảng 24b là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 25a



Bảng 25a là giống hệt Bảng 1a, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1a" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Bảng 25b



Bảng 25b là giống hệt Bảng 1c, chỉ khác là cấu trúc được thể hiện dưới tiêu đề "Bảng 1c" được thay thế bằng cấu trúc nêu trên.

Nói chung, các hợp chất theo sáng chế sẽ được dùng làm hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống ở dạng hỗn hợp, tức là chế phẩm, cùng với ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, dùng làm chất mang. Các thành phần của chế phẩm hoặc hỗn hợp được chọn được chọn phù hợp với các tính chất lý học của hoạt chất, kiểu dùng và các yếu tố môi trường như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Các chế phẩm hữu ích bao gồm cả các hỗn hợp lỏng và rắn. Các hỗn hợp lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương nhũ tương dầu trong nước, phần cô có thể chảy được và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tuỳ ý có thể được làm đặc thành các gel. Loại hỗn hợp lỏng chứa nước nói chung là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, phần cô có thể chảy được và nhũ tương-huyền phù. Loại hỗn hợp lỏng

không chứa nước nói chung là dạng cô đặc có thể nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

Loại hỗn hợp rắn nói chung là dạng bột mịn để rắc khô, bột, hạt, viên tròn, viên tròn, viên hình thoi, viên nén, dạng màng bao (bao gồm các lớp phủ hạt) và các dạng tương tự, có thể là dễ phân tán trong nước ("thấm ướt") hoặc tan trong nước. Các lớp màng và các lớp phủ được tạo ra từ các dung dịch tạo màng hoặc huyền phù dễ chảy đặc biệt hữu ích dùng để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao (vi) nang và còn được tạo thành hỗn dịch hoặc chế phẩm rắn; theo cách khác, toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc "được bao"). Việc bao nang có thể phòng trừ hoặc làm chậm quá trình giải phóng hoạt chất. Hạt có thể nhũ hóa kết hợp được các ưu điểm của cả chế phẩm dạng cô đặc có thể nhũ hóa và chế phẩm dạng hạt khô. Các hỗn hợp đậm đặc được dùng chủ yếu làm chất trung gian dùng để pha chế tiếp.

Các chế phẩm phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Các chế phẩm lỏng và rắn như vậy được bào chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước nhưng đôi khi là mô trường thích hợp khác như hyđrocacbon parafin hoặc thơm hoặc dầu thực vật. Các thể tích phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thông thường hơn, nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Các chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Các chế phẩm lỏng và khô có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được đưa lên thực vật hạt làm chất xử lý hạt trước khi gieo trồng để bảo vệ rễ đang phát triển và các bộ phận khác dưới mặt đất của thực vật và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thụ nội hấp.

Các chế phẩm sẽ thường chứa lượng hữu hiệu hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong khoảng gần đúng sau đây để tổng lượng là 100 phần trăm khối lượng.

	Phần trăm khối lượng		
	Hoạt chất	Chất pha loãng	Chất hoạt động bề mặt
Hạt, viên nén và bột phân tán trong nước và tan trong nước	0,001-90	0-99,999	0-15
Huyền phù, nhũ tương, dung dịch dầu (kể cả chất cô đặc có thể nhũ hoá)	1-50	40-99	0-50
Bột mịn	1-25	70-99	0-5
Hạt và viên tròn	0,001-99	5-99,999	0-15
Hỗn hợp đậm đặc	90-99	0-10	0-2

Chất pha loãng rắn bao gồm, ví dụ, đất sét như bentonit, montmorillonit, attapulgit và kaolanh, thạch cao, xenluloza, titan đioxit, kẽm oxit, tinh bột, đextrin, đường (ví dụ lactoza, sucroza), silic oxit, bột bột talc, mica, đất tảo silic, ure, canxi cacbonat, natri cacbonat và bicarbonat, và natri sulfat. Chất pha loãng rắn thông thường được mô tả trong ấn phẩm: Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents và Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Chất pha loãng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-đimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-đimetylformamit), limonen, đimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyroliđon (ví dụ, *N*-metylpyroliđinon), alkyl phosphat (ví dụ, trietylphosphat), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, đipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen cacbonat, butylen cacbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, các hyđrocacbon thơm, các chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, các keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hyđroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, triđexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như các este lactat alkylat hóa, các este đibazơ alkyl và aryl benzoat, và γ-butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc

không bão hoà, như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-etylhexanol, *n*-octanol, đecanol, rượu isođexylic, isooctađecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu triđexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahyđrofurfurylic, rượu điaxeton, crezol và rượu benzyl. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là C_6–C_{22}), như các dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ, dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), các chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ, mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các axit béo alkylat hóa (ví dụ, được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng chưng cất. Chất pha loãng lỏng thông thường được mô tả trong ấn phẩm: Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Các hỗn hợp rắn và lỏng theo sáng chế thường bao gồm một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt (còn được gọi là crtác nhân có hoạt tính bề mặt) thường biến đổi, thường làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Tuỳ thuộc vào bản chất của các nhóm ưa nước và ưa chất béo trong phân tử chất hoạt động bề mặt, có thể sử dụng chất hoạt động bề mặt làm các chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hoá hoặc các chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại dưới dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu ích đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: alkoxylat rượu như alkoxylat rượu trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit etoxylat hóa; triglyxerit alkoxylat hóa như đậu tương etoxylat hóa, các dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, đinonyl phenol etoxylat và đođexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các polyme khối được

điều chế từ etylen oxit hoặc propylen oxit và các polyme khối ngược, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen oxit; các axit béo etoxylat hóa; các este béo và các dầu etoxylat hóa; các metyl este etoxylat hóa; tristyrylphenol etoxylat hóa (bao gồm các loại được điều chế từ etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất trên cơ sở lanolin, các este polyetoxylat như các este sorbitan axit béo polyetoxy hoá, các este sorbitol axit béo polyetoxy hoá và các este glyxerol axit béo polyetoxy hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyt (polyetylen glycol), các polyme ghéo hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở silicon; và dẫn xuất của đường như các este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysacarit.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và các muối của chúng; rượu carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất điphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc sucxinic hoặc các anhyđrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của alkoxylat rượu, các este phosphat của alkylphenol alkoxylat và các este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở protein; các dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N*,*N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và đođexyl và triđexylbenzen; các sulfonat của naphtalen được ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cất phân đoạn; sulfosucxinamat; và sulfosucxinat và các dẫn xuất của chúng như các muối đialkyl sulfosucxinat.

Các chất hoạt động bề mặt cation hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các amit và các amit đã etoxyl hóa; các amin như các *N*-alkyl propanđiamin, các tripropylentriamin và các đipropylentetramin, và các amin đã

etoxyl hóa, các điamin đã etoxyl hóa và các amin đã propoxyl (được điều chế từ các amin và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các muối amin như các amin axetat và các muối điamin; các muối amoni bậc bốn như muối bậc bốn, các muối bậc bốn đã etoxyl hóa và các muối bậc bốn hai lần; và các amin oxit như các alkylđimetylamin oxit và các bis-(2-hyđroxyetyl)-alkylamin oxit.

Cũng hữu ích đối với các chế phẩm theo sáng chế là các hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyên dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm các ấn phẩm: *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions được công bố bởi McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; và A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa các chất bổ trợ và các chất phụ gia cho cho chế phẩm, đã biết đối với các chuyên gia trong lĩnh vực làm chất trợ bào chế (một số trong số chúng có thể được xem là có chức năng làm các chất pha loãng rắn, các chất pha loãng lỏng hoặc các chất hoạt động bề mặt). Các chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (các chất đệm), sự tạo bọt trong quá trình xử lý (các chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), sự lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong dụng cụ chứa (các chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (các chất chống đông), màu sắc (các chất phân tán tạo màu/thuốc nhuộm), sự rửa trôi (các chất tạo màng hoặc các chất dính), sự bay hơi (các chất làm chậm bay hơi), và các chế phẩm khác tương tự. Các chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrolidon-vinyl axetat, các rượu polyvinylic, copolyme rượu polyvinylic và các sáp. Ví dụ về chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm bao

gồm các chất được liệt kê trong ấn phẩm: *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và bắc Mỹ do McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. công bố; và công bố đơn PCT WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được kết hợp trong các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc có thể nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2000μm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới đây 3μm. Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để tạo ra hạt phân tán trong nước. Các chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10μm. Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên các chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem ấn phẩm: Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, các trang 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8-57 và các trang tiếp theo, và WO 91/13546. Các viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Các hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin liên quan tới việc bào chế, xem ấn phẩm: T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" trong *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, trang 120-133. Cũng có thể thấy trong: U.S. 3,235,361, Cột 6, dòng 16 đến Cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10-41; U.S. 3,309,192, Cột 5, dòng 43 đến Cột 7, dòng 62 và các Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 và 169-182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến Cột 5, dòng 17 và các Ví dụ 1-4; ấn phẩm: Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley và Sons, Inc., New York, 1961, trang 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và ấn phẩm: *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

Trong các ví dụ dưới đây, tất cả các chế phẩm đều được điều chế theo cách thông thường. Các số hợp chất được đánh số theo số chỉ trong các Bảng danh mục A-N. Không cần mô tả kỹ hơn, các tác giả sáng chế cho rằng chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng phần mô tả trên của sáng chế với phạm vi rộng nhất. Do đó, các ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh hoạ sáng chế và không hạn chế phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Phần trăm được tính theo khối lượng trừ khi có quy định khác được chỉ ra cụ thể.

Ví dụ A

Dạng cô đặc đậm đặc

Hợp chất 8	98,5%
silic oxit dạng gel khí	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%

Ví dụ B

Bột thấm ướt

Hợp chất 14	65,0%
đođexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
montmorillonit (đã được nung)	23,0%

Ví dụ C

Hạt

Hợp chất 16	10,0%
hạt attapulgit (chất có độ bay hơi thấp, 0,71/0,30mm; rây Mỹ No. 25-50)	90,0%

Ví dụ D

Viên ép đùn

Hợp chất 19	25,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ E

Chất cô đặc nhũ hóa được

Hợp chất 41	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
metyl este của axit béo C_6-C_{10}	70,0%

Ví dụ F

Vi nhũ tương

Hợp chất 42	5,0%
copolyme polyvinylpyroliđon-vinyl axetat	30,0%
alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
nước	20,0%

Ví dụ G

Xử lý hạt

Hợp chất 51 (không yêu cầu bảo hộ)	20,00%
copolyme polyvinylpyroliđon-vinyl axetat	5,00%
sáp axit montan	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%
copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
rượu stearylic (POE 20)	2,00%
polyorganosilan	0,20%
thuốc nhuộm màu đỏ	0.05%
nước	65,75%

Ví dụ H

Phân bón

Hợp chất 54	2,50%
copolyme pyroliđon-styren	4,80%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,30%
bột talc	0,80%
tinh bột ngô	5,00%
phân bón giải phóng chậm	36,00%
caolanh	38,00%
nước	10,60%

Ví dụ I

Dạng cô đặc hỗn dịch

Hợp chất 55	35%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
nước	53,7%

Ví dụ J

Nhũ tương trong nước

Hợp chất 76	10,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hyđrocacbon trên cơ sở dầu mỏ thơm	20,0
nước	58,7%

Ví dụ K

Thể phân tán trong dầu

Hợp chất 19	25%
polyoxyetylen sorbitol hexaoleat	15%
sét bentonit đã cải biến bằng chất hữu cơ	2,5%
metyl este của axit béo	57,5%

Ví dụ L

Nhũ huyền phù

Hợp chất 42	10,0%
imidacloprid	5,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hyđrocacbon trên cơ sở dầu mỏ thơm	20,0%
nước	53,7%

Các hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đối với phổ rộng của loài gây hại không xương sống. Các loài gây hại này bao gồm các loài không xương sống sống trong nhiều môi trường như, ví dụ, cây lá, rễ, đất, cây thu hoạch hoặc các loại thực phẩm khác, các công trình xây dựng hoặc da động vật. Các loài gây hại này bao gồm, ví dụ, loài không xương sống ăn lá (bao gồm lá, thân, hoa và quả), hạt, gỗ, sợi dệt hoặc máu hoặc mô động vật và nhờ đó gây ra tổn thương hoặc hư hại cho, ví dụ, đang phát triển hoặc bảo quản cây nông nghiệp, cây lâm nghiệp, cây trong nhà kính, cây cảnh, cây trong vườn ươm, bảo quản các loại thực phẩm hoặc các sản phẩm sợi hoặc các công trình xây dựng và các công trình khác hoặc các bộ phận của chúng hoặc gây hại cho sức khoẻ động vật hoặc sức khoẻ cộng đồng. Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ đánh giá được rằng không phải tất cả hợp chất là hữu hiệu như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả loài gây hại.

Vì vậy, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể sử dụng trong nông nghiệp để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật và cũng trong lĩnh vực phi trong nông nghiệp để bảo vệ cây trong vườn và cây khác

khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Tính hữu ích này bao gồm bảo vệ cây trồng và các cây khác (có nghĩa là cả trong lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp) chứa nguyên liệu di truyền được đưa vào bằng kỹ thuật di truyền (tức là chuyển gen) hoặc được cải biến bằng cách gây đột biến để thu được các tính trạng có lợi. Ví dụ về các tính trạng này gồm tính chống chịu với thuốc diệt cỏ, tính đề kháng với loài gây hại ăn thực vật (ví dụ, các côn trùng, ve bét, các loài rệp cây, nhện, giun tròn, ốc sên, nấm gây bệnh thực vật, vi khuẩn và virut), cải biến sự phát triển thực vật, tăng tính chống chịu với các điều kiện sinh trưởng bất lợi như các nhiệt độ cao hoặc thấp, độ ẩm của đất cao hoặc thấp, và độ muối cao, tăng đơm hoa hoặc kết quả, tăng hiệu suất thu hoạch, tăng thời gian chín, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, và cải thiện các đặc tính bảo quản hoặc chế biến sản phẩm thu hoạch. Thực vật chuyển gen có thể được cải biến để biểu hiện nhiều tính trạng. Ví dụ về thực vật có các tính trạng được tạo ra bằng kỹ thuật di truyền hoặc gây đột biến gồm các giống ngô, bông, đậu tương và khoai tây biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* trừ sâu như YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® và NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™, và các giống ngô, bông, đậu tương và cải dầu chống chịu thuốc diệt cỏ như ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® và CLEARFIELD®, cũng như cây trồng biểu hiện N-axetyltransferaza (GAT) có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ glyphosate, hoặc cây trồng chứa gen HRA có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ ức chế axetylactat syntaza (ALS). Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với tính trạng được tạo ra bởi kỹ thuật di truyền hoặc được biến đổi bằng cách đột biến, vì vậy làm tăng sự biểu hiện kiểu hình hoặc một cách hữu hiệu của tính trạng hoặc làm tăng tác dụng phòng trừ loài gây hại không xương sống một cách hữu hiệu của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế. Cụ thể là, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với sự biểu hiện kiểu hình của các protein hoặc các sản phẩm tự nhiên khác gây độc cho loài gây hại không xương sống để tạo ra tác dụng phòng trừ lớn hơn bổ trợ của loài gây hại này.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể tuỳ ý chứa các chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ, phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi, magie, sắt, đồng, bo, mangan, kẽm và molypđen. Được lưu ý là, chế phẩm bao gồm ít nhất một phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi và magie. Chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật có thể ở dạng chất lỏng hoặc chất rắn. Được lưu ý là, chế phẩm rắn ở dạng hạt, dạng thỏi nhỏ hoặc dạng viên nén. Chế phẩm rắn bao gồm phân bón có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất hoặc hỗn hợp theo sáng chế với phân bón cùng với các hợp phần điều chế và sau đó điều chế chế phẩm bằng các phương pháp như tạo hạt hoặc ép đùn. Theo cách khác, chế phẩm rắn có thể được điều chế bằng cách phun dung dịch hoặc huyền phù chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trong dung môi dễ bay hơi lên phân bón đã điều chế trước ở dạng hỗn hợp ổn định về kích thước, ví dụ, dạng hạt, dạng thỏi nhỏ hoặc dạng viên nén, và sau đó làm bay hơi dung môi.

Ứng dụng phi nông nghiệp dùng để chỉ việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong phạm vi không phải cây trồng. Việc ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong bảo quản hạt, hột và các loại thực phẩm khác và trong hàng dệt như quần áo và thảm. ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong cây trang trí, cây lâm nghiệp, trong hàng rào, dọc lề đường và đường xe lửa và khu vực có cỏ như bãi cỏ, sân gôn và đồng cỏ. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong nhà ở và công trình kiến trúc khác thể là được sử dụng bởi người, trang trại, gia súc, vườn thú hoặc các động vật khác. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại như mối có thể làm hư hại gỗ hoặc các vật liệu kết cấu khác được sử dụng trong công trình này.

Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm bảo vệ người và sức khoẻ động vật bằng cách phòng trừ loài gây hại không xương sống sống ký sinh hoặc truyền bệnh truyền nhiễm. Việc phòng trừ động vật ký sinh bao gồm phòng trừ loài ký sinh bên ngoài là loài ký sinh trên bề mặt cơ thể của vật chủ (ví dụ, vai, nách, bụng, phần bên trong của đùi) và loài ký sinh bên trong ký sinh bên trong cơ thể của vật chủ (ví dụ,, dạ dày, ruột, phổi, tĩnh mạch, dưới da, mô bạch huyết). Loài gây hại ký sinh bên ngoài hoặc truyền bệnh bao gồm, ví dụ, bọ chét chig-ger, ve, chấy, muỗi, ruồi, bét và bọ chét. Loài ký sinh bên trong bao gồm heartgiun, giun móc và giun sán. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để phòng trừ sự quấy phá hoặc nhiễm toàn thân hoặc không toàn thân bởi loài ký sinh trên các động vật. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là đặc biệt thích hợp để chống lại loài gây hại ký sinh bên ngoài hoặc truyền bệnh. Các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để chống lại loài ký sinh quấy phá hoạt động nông nghiệp của các động vật, như gia súc, cừu, dê, ngựa, lợn, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, gà, gà tây, vịt, ngỗng và ong; động vật cảnh và thu nuôi như chó, mèo, chim cảnh và cá cảnh; cũng như các động vật thử nghiệm, như chuột đồng, chuột lang, chuột và chuột nhắt. Bằng cách chống lại các loài ký sinh này, sự rủi ro và thực hiện được làm giảm (đặc biệt với thịt, sữa, len, da, trứng, mật ong, v.v..) được làm giảm, vì vậy có thể áp dụng chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế kinh tế hơn và làm đơn giản việc nuôi các động vật.

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp hoặc phi nông nghiệp bao gồm: trứng, ấu trùng và con trưởng thành thuộc bộ Cánh vảy như sâu cắn gié, sâu cắn rễ, sâu đo và sâu hại bông thuộc họ Bướm đêm (ví dụ, sâu đục thân màu hồng (*Sesamia inferens* Walker), sâu đục thân ngô (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), sâu cắn gié phương nam (*Spodoptera eridania* Cramer), sâu cắn gié lá (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), sâu cắn gié củ cải đường (*Spodoptera exigua* Hübner), sâu cắn lá bông (Spodoptera littoralis Boisduval), sâu cắn gié sọc vàng(Spodoptera ornithogalli Guenée), sâu cắn rễ đen (Agrotis ipsilon Hufnagel), sâu bướm đậu nhung (Anticarsia gemmatalis Hübner), sâu đục quả xanh (Lithophane antennata Walker), sâu cắn gié cải bắp (Barathra

brassicae Linnaeus), sâu đo đậu tương (Pseudoplusia includens Walker), sâu đo cải bắp (Trichoplusia ni Hübner), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Huber), sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens* Fabricius)); sâu đục thân, sâu kén, sâu kéo màng, sâu ốc chóp, sâu cải bắp và sâu gặm thịt lá thuộc họ sâu đục thân (ví dụ, sâu đục ngô châu Âu (*Ostrinia Nubilalis* Hübner), sâu cam rốn (*Amyelois transitella* Walker), sâu kéo màng rễ ngô (*Crambus caliginosellus* Clemens), sâu kéo màng cỏ (Pyralidae: *Crambinae*) cũng như sâu kéo màng cỏ (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); sâu đục thân mía (*Chilo infuscatellus* Snellen), đục thân cà chua nhỏ (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), sâu cuốn lá màu xanh (*Cnaphalocrocis medinalis*), sâu cuốn lá nho (*Desmia funeralis* Hübner), sâu dưa (*Diaphania nitidalis* Stoll), ấu trùng cải bắp (*Helluala hydralis* Guenée), sâu đục thân màu vàng (*Scirpophaga incertulas* Walker), sâu đục thân rễ (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), sâu đục thân trắng (*Scirpophaga innotata* Walker), sâu đục thân rễ (*Scirpophaga nivella* Fabricius), sâu đục thân lúa đầu đen (*Chilo polychrysus* Meyrick), sâu đục thân lúa sọc (*Chilo suppressalis* Walker), sâu bướm cụm cải bắp (*Crocidolomia binotalis* English)); sâu cuốn lá, sâu đục chồi, sâu hạt, và sâu trái cây thuộc họ Tortricidae (ví dụ,, bướm cá tuyết (*Cydia pomonella Linnaeus*), bướm hại nho (*Endopiza viteana* Clemens), bướm trái cây phương đông (*Grapholita molta* Busck)); ngài rơi chanh cam (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), sâu đục thân chanh cam (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), sâu cuốn lá băng đỏ (*Argyrotaenia velutinana* Walker), sâu cuốn lá dải chéo (*Choristoneura rosaceana* Harris), sâu táo màu nâu nhạt (*Epiphyas postvittana* Walker), ngài nho châu Âu (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), ngài búp táo (*Pandemis pyrusana* Kearfott), sâu cuốn lá ăn tạp (*Platynota stultana* Walsingham), sâu ăn phấn hoa sọc vằn (*Pandemis cerasana* Hübner), sâu ăn phấn hoa táo màu nâu (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); và nhiều loài thuộc bộ Cánh vảy có ảnh hưởng về mặt kinh tế khác (ví dụ, bướm lưng kim cương (*Plutella xylostella Linnaeus*), sâu hồng hại bông (*Pectinophora gossypiella* Saunders), bướm gipsy (*Lymkiénria dispar Linnaeus*)); đục thân quả đào (*Carposina niponensis* Walsingham), sâu đục thân cành con đào (*Anarsia*

lineatella Zeller), sâu củ khoai tây (*Phthorimaea operculella* Zeller), đục lá chấm (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), sâu đục lá táo châu á (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), sâu cuốn lá lúa (*Lerodea eufala* Edwards), sâu đục lá táo (*Leucoptera scitella* Zeller)); trứng, nhộng và sâu trưởng thành thuộc bộ Cánh gián bao gồm gián thuộc các họ Blattellidae và Blattidae (ví dụ, gián phương Đông (*Blatta orientalis* Linnaeus), gián châu á (*Blatella asahinai* Mizukubo), gián Đức (*Blattella germanica* Linnaeus), gián sọc nâu (*Supella longipalpa* Fabricius), gián Mỹ (*Periplaneta americana* Linnaeus), gián nâu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gián Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), gián nâu khói (*Periplaneta fuliginosa* Service), gián Australia (*Periplaneta australasiae* Fabr.), gián tôm hùm (*Nauphoeta cinerea* Olivier) và gián trơn (*Symploce pallens* Stephens)); trứng, ấu trùng và dạng trưởng thành ăn lá, ăn quả, ăn rễ, ăn hạt và ăn mô bọt thuộc bộ Cánh cứng bao gồm mọt ngũ cốc thuộc họ Anthribidae, Bruchidae, và Curculionidae (ví dụ, bọ vòi voi hại bông (*Anthonomus grandis* Boheman), bọ vòi voi hại lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), mọt ngũ cốc thóc (*Sitophilus granarius* Linnaeus), mọt ngũ cốc gạo (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), mọt ngũ cốc cỏ poa thường niên (*Listronotus maculicollis* Dietz), mọt vòi dài cỏ poa (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), mọt vòi dài săn mồi (*Sphenophorus venatus vestitus*), mọt vòi dài Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); bọ nhảy, bọ cánh cứng dưa chuột, sâu ăn rễ, bọ cánh cứng lá cây, bọ cánh cứng khoai tây, và sâu đục lá thuộc họ Chrysomelidae (ví dụ, bọ cánh cứng khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), sâu ăn rễ ngô phương Đông (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); bọ da và các loài bọ cánh cứng khác thuộc họ Scaribaeidae (ví dụ,, bọ cánh cứng Nhật Bản (*Popillia japonica* Newman), bọ cánh cứng phương Đông (*Anomala orientalis* Waterhouse), *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), bọ da mặt nạ phương Bắc (*Cyclocephala borealis* Arrow), bọ da mặt nạ phương Nam (*Cyclocephala immaculata* Olivier hoặc *C. lurida* Bland), bọ phân và giòi trắng (Aphodius spp.), bọ cỏ đen (*Ataenius spretulus* Haldeman), bọ cánh cứng xanh June (*Cotinis nitida* Linnaeus), bọ cánh cứng vườn Châu á (*Maladera castanea* Arrow), bọ cánh cứng

May/June (*Phyllophaga* spp.) và bọ da châu Âu *Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); bọ cánh cứng thảm thuộc họ Dermestidae; sâu ăn lá thuộc họ Elateridae; bọ cánh cứng vỏ cây thuộc họ Scolytidae và bọ cánh cứng bột mỳ thuộc họ Tenebrionidae.

Ngoài ra, các loài gây hại nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm: trứng, dạng trưởng thành và ấu trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm sâu tai thuộc họ Forficulidae (ví dụ, sâu tai châu Âu (*Forficula auricularia* Linnaeus), sâu tai đen (*Chelisoches mono* Fabricius)); trứng, dạng chưa thành thục, dạng trưởng thành và nhộng thuộc các bộ Cánh nửa cứng và Cánh giống như rệp cây thuộc họ Miridae, ve sầu thuộc họ Cicadidae, rầy xanh đuôi đen (ví dụ, *Empoasca* spp.) thuộc họ Cicadellidae, rệp (ví dụ,, *Cimex lectularius* Linnaeus) thuộc họ Cimicidae, rầy thuộc các họ Fulgoroidae và Delphacidae, ve sầu nhảy cây thuộc họ Membracidae, rệp lá thuộc họ Psyllidae, ruồi trắng thuộc họ Aleyrodidae, rệp thuộc họ Aphididae, rệp sáp thuộc họ Phylloxeridae, rệp sáp thuộc họ Pseudococcidae, rệp cây thuộc họ Coccidae, Diaspididae và Margarodidae, rệp vằn thuộc họ Tingidae, rệp hôi thuộc họ Pentatomidae, rệp (ví dụ,, rệp lông (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) và rệp phương Nam (*Blissus insularis* Barber)) và rệp hại hạt khác thuộc họ Lygaeidae, rệp dãi thuộc họ Cercopidae, rệp hại bí thuộc họ Coreidae, và rệp đỏ và nhuộm màu bông thuộc họ Pyrrhocoridae.

Các loài gây hại nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm cũng bao gồm: trứng, ấu trùng, nhộng và dạng trưởng thành thuộc bộ Ve bét (ve) như bọ ve nhện và bọ ve đỏ thuộc họ Tetranychidae (ví dụ, bọ ve đỏ Châu Âu (*Panonychus ulmi* Koch), bọ ve nhện hai chấm (*Tetranychus urticae* Koch), bọ ve McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), bọ ve dẹt thuộc họ Tenuipalpidae (ví dụ, bọ ve dẹt hại chanh (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), bọ ve ăn chồi và gỉ sắt thuộc họ Eriophyidae và các loại bọ ve ăn lá và ve bét ảnh hưởng đến sức khoẻ của người và động vật, tức là ve bét phấn hoa thuộc họ Epidermoptidae, ve bét quả đại thuộc họ Demodicidae, ve bét hạt cứng thuộc họ Glycyphagidae, ve thuộc họ Ixodidae, thường được gọi là ve cứng (ví dụ, ve nhỏ (*Ixodes scapularis* Say), ve gây liệt úc (*Ixodes holocyclus* Neumann), ve chó Mỹ (*Dermacentor variabilis* Say), tíc sao

(*Amblyomma americanum* Linnaeus)) và ve thuộc họ Argasidae, thường được gọi là ve mềm (ví dụ, ve tái phát (*Ornithodoros turicata*), ve gà nói chung (*Argas Radiatus*)); ve bét gây nấm vảy và ngứa thuộc các họ Psoroptidae, Pyemotidae, và Sarcoptidae; trứng, dạng trưởng thành và dạng chưa thành thục thuộc bộ Cánh thẳng bao gồm châu chấu và dế (ví dụ, châu chấu di cư (ví dụ, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), châu chấu Mỹ (ví dụ, *Schistocerca americana* Drury), châu chấu sa mạc (*Schistocerca Gregaria* Forskal), châu chấu di cư (*Locusta migratoria* Linnaeus), châu chấu bụi rậm (*Zonocerus* spp.), dế nhà (*Acheta domesticus* Linnaeus), dế ruồi (ví dụ, dế ruồi hung (*Scapteriscus vicinus* Scudder) và dế ruồi phương Nam (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); các dạng trưởng thành và dạng chưa thành thục thuộc bộ côn trùng Hai cánh bao gồm sâu đục lá, ruồi nhuế, ruồi quả (Tephritidae), ruồi frít (ví dụ, *Oscinella frit* Linnaeus), giòi đất, ruồi nhà (ví dụ,, *Musca domestica* Linnaeus), ruồi nhà nhỏ (ví dụ, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), ruồi chó (ví dụ, *Stomoxy calcitrans* Linnaeus), ruồi mặt, ruồi anten, ruồi nhặng (ví dụ, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), và các loài ruồi rêu khác, ruồi trâu (ví dụ, *Tabanus* spp.), ruồi giòi (ví dụ, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), bọ gia súc (ví dụ, *Hypoderma* spp.), ruồi hươu (ví dụ, *Chrysops* spp.), con mòng (ví dụ, *Melophagus ovinus* Linnaeus) và các loài Râu ngắn khác, muỗi (ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), ruồi đen (ví dụ, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), ruồi nhuế đốt, ruồi cát, sciarids, và các loài Giun tròn khác; trứng, dạng chưa thành thục và dạng trưởng thành thuộc bộ Cánh tơ bao gồm bọ trĩ hành (*Bọ trĩ tabaci* Lindeman), bọ trĩ hại hoa (*Frankliniella* spp.), và các loài bọ trĩ ăn lá khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm kiến thuộc họ Formicidae bao gồm kiến đục gỗ Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), (ví dụ, kiến đục gỗ màu đỏ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), kiến đục gỗ màu đen (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), kiến chân trắng (*Technomyrmex albipes* French. Smith), kiến đầu to (*Pheidole* sp.), kiến ma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); kiến Pharaoh (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), kiến lửa con (*Wasmannia auropunctata* Roger), kiến lửa (*Solenopsis geminata* Fabricius), kiến lửa đỏ

(*Solenopsis invicta* Buren), kiến Achentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), kiến dại (*Paratrechina longicomis* Latreille), kiến mặt đường (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), kiến đậu đũa Trung Quốc (*Lasius alienus* Förster), kiến nhà có mùi (*Tapinoma sessile* Say). Các loại Cánh màng khác bao gồm ong (bao gồm ong đục gỗ), ong sừng, ong bắp cày vàng và đen, ong bắp cày, và ong cắn lá (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh đều bao gồm mối thuộc họ Termitidae (ví dụ, *Macrotermes* sản phẩm. *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (ví dụ, *Cryptotermes* sp.), và họ Rhinotermitidae (ví dụ, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), mối đất phương Đông (*Reticulitermes flavipes* Kollar), mối đất phương Tây (*Reticulitermes hesperus* Banks), mối đất Formosan (*Coptotermes formosanus* Shiraki), mối gỗ Tây ấn Độ (*Incisitermes immigrans* Snyder), mối chuyển bột (*Cryptotermes brevis* Walker), mối gỗ (*Incisitermes snyderi* Light), mối đất Đông Nam (*Reticulitermes virginicus* Banks), mối gỗ phương Đông (*Incisitermes minor* Hagen), mối cây như *Nasutitermes* sp. và các loài mối khác có ảnh hưởng về mặt kinh tế; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Thysanura như silverfish (*Lepisma saccharina* Linnaeus) và firebrat (*Theimobia domestica* Packard); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ ăn lông và gồm chấy đầu (*Pediculus Humanus capitis* De Geer), rận người (*Pediculus Humanus* Linnaeus), rận gà (*Menacanthus stramineus* Nitszch), rận chó (*Trichodectes canis* De Geer), rận chim (*Goniocotes gallinae* De Geer), rận cừu (*Bovicola ovis* Schrank), rận gia súc mũi ngắn (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), rận gia súc mũi dài (*Linognathus vituli* Linnaeus) và rận ký sinh hút và cắn người và động vật khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Siphonoptera bao gồm rầy chuột phương Đông (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), rầy mèo (*Ctenocephalidess felis* Bouche), rầy chó (*Ctenocephalidess canis* Curtis), rầy gà mái (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), rầy dính (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), rầy người (*Pulex irritans* Linnaeus) và các loài rầy khác gây đau động vật có vú và chim. Các loài loài chân khớp gây hại khác còn bao gồm: nhện thuộc bộ Nhện như nhện nâu ẩn dật (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) và nhện độc

đen Mỹ (*Latrodectus mactans* Fabricius), và rết thuộc bộ có Vảy như rết nhà (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống mọt hại kho gồm mọt đục hạt lớn (*Prostephanus truncatus*), mọt đục hạt nhỏ (*Rhyzopertha dominica*), mọt gạo (*Stiophilus oryzae*), mọt bắp (*Stiophilus zeamais*), mọt đậu (*Callosobruchus maculatus*), mọt bột đỏ (*Tribolium castaneum*), sâu gạo (*Stiophilus granarius*), ngài ấn độ (*Plodia interpunctella*), bọ bột Địa trung hải (*Ephestia kuhniella*) và bọ hạt hồng hoặc phẳng (*Cryptolestis ferrugineus*).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc lớp giun tròn, sán dây, sán lá và giun đầu móc bao gồm các loài có ảnh hưởng về mặt kinh tế thuộc bộ Strongylida, bộ Giun đũa, Giun kim, Rhabditida, Spirurida và Enoplida như, nhưng không chỉ giới hạn ở, các loài gây hại nông nghiệp có ảnh hưởng về mặt kinh tế (tức là giun tròn nốt sần thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus*, v.v.) và các loài gây hại cho sức khoẻ của người và động vật (tức là tất cả các loài sán lá, sán xơ mít, và giun tròn có ảnh hưởng về mặt kinh tế như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara cards* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis Leidy* ở chó, *Anoplocephala perfoliata* ở ngựa, *Fasciola hepatica Linnaeus* ở động vật nhai lại, v.v.).

Các hợp chất theo sáng chế có thể có hoạt tính kháng các loài gây hại thuộc bộ Cánh vảy (ví dụ, Alabama argillacea Hulbner (sâu lá bông), Archips argyrospila Walker (sâu cuốn lá cây ăn quả), A. rosana Linnaeus (sâu cuốn lá châu âu) và các loài sâu cuốn lá lạc đầu đen khác, Chilo suppressalis Walker (sâu đục rễ lúa), Cnaphalocrosis medinalis Guenee (sâu cuốn lá lúa), Crambus caliginosellus Clemens (sâu kéo màng rễ ngô), Crambus teterrellus Zincken (sâu kéo màng cỏ poa), Cydia pomonella Linnaeus (codling bướm đêm), Earias insulana Boisduval (sâu xanh có gai), Earias vittella Fabricius (sâu xanh có đốm), Helicoverpa armigera Hübner (sâu xanh Mỹ), Helicoverpa zea Boddie (sâu xanh ngô), Heliothis virescens Fabricius (sâu đục chồi thuốc lá), Herpetogramma licarsisalis Walker (sâu kéo màng cỏ), Lobesia botrana Denis & Schiffermüller (bướm đêm

quả nho), Pectinophora gossypiella Saunders (sâu xanh cẩm chướng), Phyllocnistis citrella Stainton (sâu đục lá cam quýt), Pieris brassicae Linnaeus (bướm lợn trắng lớn Anh), Pieris rapae Linnaeus (bướm lợn trắng nhỏ Anh), Plutella xylostella Linnaeus (sâu tơ), Spodoptera exigua Hübner (sâu cắn gié củ cải đường), Spodoptera litura Fabricius (sâu cắn rễ thuốc lá, sâu róm), Spodoptera frugiperda J. E. Smith (sâu cắn gié lá), Trichoplusia ni Hübner (sâu đo cải bắp) và Tuta absoluta Meyrick (sâu đục lá cà chua).

Các hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đáng kể với các loài thuộc bộ côn trùng Cánh giống bao gồm: Acyrthisiphon pisum Harris (rệp vừng đậu Hà lan), Aphis craccivora Koch (rệp vừng đậu đũa), Aphis fabae Scopoli (rệp vừng gỗ cứng), Aphis gossypii Glover (rệp vừng bông, rệp vừng dưa), Aphis pomi De Geer (rệp vừng táo), Aphis spiraecola Patch (rệp vừng cây mơ trân châu), Aulacorthum solani Kaltenbach (rệp vừng cây mao địa hoàng), Chaetosiphon fragaefolii Cockerell (rệp vừng dâu tây), Diuraphis noxia Kurdjumov/Mordvilko (rệp vừng lúa mỳ Nga), Dysaphis plkiếnaginea Paaserini (rệp vừng táo đỏ), Eriosoma lanigerum Hausmann (rệp vừng táo lông tơ), Hyalopterus pruni Geoffroy (rệp vừng mận hột), Lipaphis erysimi Kaltenbach (rệp vừng củ cải), Metopolophium dirrhodum Walker (rệp vừng ngũ cốc), Macrosipum euphorbiae Thomas (rệp vừng khoai tây), Myzus persicae Sulzer (rệp vừng khoai tây-đào, rệp vừng đào xanh), Nasonovia ribisnigri Mosley (rệp vừng rau diếp), Pemphigut spp. (các loài rệp rễ và các loài rệp vú lá), Rhopalosiphum maidis Fitch (rệp vừng lá ngô), Rhopalosiphum padi Linnaeus (rệp vừng anh đào), Schizaphis graminum Rondani (greenbug), Sitobion avenae Fabricius (rệp vừng hại hạt Anh), Therioaphis maculata Buckton (rệp vừng cỏ linh lăng có đốm), Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (rệp vừng cam quýt đen), và Toxoptera citricida Kirkaldy (rệp vừng cam quýt nâu); Adelges spp. (adelgids); Phylloxera devastatrix Pergande (rệp hại hồ đào pêcan); Bemisia tabaci Gennadius (ruồi trắng thuốc lá, ruồi trắng khoai lang), Bemisia argentifolii Bellows & Perring (ruồi trắng cây dương lá rụng), Dialeurodes citri Ashmead (ruồi trắng cam quýt) và Trialeurodes vaporariorum Westgõ (ruồi trắng nhà kính); Empoasca fabae Harris (bọ nhảy hại lá khoai tây),

Laodelphax striatellus Fallen (rầy nâu nhỏ), Macrolestes quadrilineatus Forbes (rầy xanh đuôi đen cúc tây), Nephotettix cinticeps Uhler (rầy xanh đuôi đen), Nephotettix nigropictus Stal (rầy xanh đuôi đen hại lúa), Nilaparvata lugens Stål (rầy nâu), Peregrinus maidis Ashmead (bọ nhảy hại cây ngô), Sogatella furcifera Horvath (rầy lưng trắng), Sogatodes orizicola Muir (rầy lúa), Typhlocyba pomaria McAtee rầy xanh đuôi đen táo trắng, Erythroneoura spp. (rầy xanh đuôi đen nho); Magicidada septendecim Linnaeus (ve sầu); Icerya purchasi Maskell (rệp đệm bông), Quadraspidiotus perniciosus Comstock (rệp San Jose); Planococcus citri Risso (sâu ăn bột cam quýt); Pseudococcus spp. (các loài sâu ăn bột khác); Cacopsylla pyricola Foerster (rệp lá lê), Trioza diospyri Ashmead (rệp lá cây hồng vàng).

Các hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc bộ Cánh nửa cứng bao gồm: Acrostemum hilare Say (rệp hôi xanh), Anasa tristis De Geer (rệp bí), Blissus leucopterus leucopterus Say (rệp), *Cimex lectularius* Linnaeus (rệp) Corythuca gossypii Fabricius (rệp bông), Cyrtopeltis modesta Distkiến (rệp cà chua), Dysdercus suturellus Herrich-Schaffer (bọ xít bông), Euchistus servus Say (rệp hôi nâu), Euchistus variolarius Palisot de Beauvois (rệp hôi một đốm), Graptosthetus spp. (các loài rệp hại hạt), *Halymorpha halys* Stal (bọ xít nâu), Leptoglossus corculus Say (rệp hạt thông nhảy lá), Lygus lineolaris Palisot de Beauvois (rệp cây), Nezara viridula Linnaeus (rệp hôi xanh phương Nam), Oebalus pugnax Fabricius (rệp hôi gạo), Oncopeltus fasciatus Dallas (rệp cây cho dịch nhựa mủ lớn), Pseudatomoscelis seriatus Reuter (bọ nhảy bông). Các bộ côn trùng khác được phòng trừ bởi các hợp chất theo sáng chế gồm bộ Cánh tơ (ví dụ, Frankliniella occidentalis Pergande (bọ trĩ hại hoa phương Tây), Scirthothrips citri Moulton (bọ trĩ cam quýt), Sericothrips variabilis Beach (bọ trĩ đậu tương), và Thrips tabaci Lindeman (bọ trĩ hành); và bộ Cánh cứng (ví dụ, Leptinotarsa decemlineata Say (bọ cánh cứng khoai tây Colorado), Epilachna varivestis Mulskiến (bọ cánh cứng đậu Mexicô) và bọ bổ củi thuộc giống Agriotes, Athous hoặc Limonius).

Cũng cần lưu ý một số hệ phân loại đương thời đối với bộ Cánh giống dưới dạng bộ phụ trong chủng Cánh nửa.

Đáng lưu ý việc dùng các hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ trĩ hoa phía tây (*Frankliniella occidentalis*). Đáng lưu ý việc dùng các hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rầy khoai tây (*Empoasca fabae*). Đáng lưu ý việc dùng các hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp mướp bông (*Aphis gossypii*). Đáng lưu ý việc dùng các hợp chất theo sáng chế để phòng rệp đào xanh lá cây (*Myzus persicae*). Đáng lưu ý việc dùng các hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ phấn khoai lang (*Bemisia tabaci*).

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể hữu ích để tăng sức sống của cây trồng. Phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc cây trồng (ví dụ, tán lá, hoa, quả hoặc rễ) hoặc hạt giống để trồng cây trồng này với hợp chất có công thức 1 với lượng đủ để đạt được hiệu quả tạo sức sống của thực vật mong muốn (tức là, lượng hữu hiệu sinh học). Thông thường, hợp chất có công thức 1 được áp dụng trong một chế phẩm đã được bào chế. Mặc dù hợp chất có công thức 1 thường được áp dụng trực tiếp cho cây trồng hoặc hạt giống của nó, song nó cũng có thể được áp dụng cho vùng cây trồng, tức là môi trường sống của cây trồng, đặc biệt là khu vực môi trường sát cạnh đủ để cho phép hợp chất có công thức 1 di trú vào cây trồng. Khu vực liên quan đến phương pháp này đặc biệt là môi trường sinh trưởng (tức là, môi trường cung cấp các dinh dưỡng cho thực vật), thông thường là đất mà ở đó thực vật sinh trưởng. Việc xử lý của cây trồng để làm tăng sức sống của cây trồng do vậy bao gồm việc cho tiếp xúc cây trồng, hạt giống để trồng cây trồng này hoặc khu vực cây trồng với một lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1.

Việc làm tăng sức sống của cây trồng có thể dẫn đến một hoặc nhiều tác động có thể thấy được sau: (a) thiết lập cây trồng tối ưu như được minh chứng bởi sự nảy mầm hạt giống, sự nhú cây non và sự mọc cây trồng mỹ mãn; (b) thúc đẩy sự tăng trưởng cây trồng như được minh chứng bởi sự phát triển nhanh chóng và mạnh mẽ của lá (ví dụ, đo được bằng chỉ số diện tích lá), chiều cao thực vật, số chồi (ví dụ, đối với lúa), sinh khối rễ và tổng khối lượng khô khối thực vật của cây

trồng; (c) cải thiện năng suất cây trồng, như được minh chứng bởi thời điểm ra hoa, thời gian ra hoa, số hoa, tổng tích lũy sinh khối (tức là, năng suất) và/hoặc khả năng tiêu thụ quả và hạt của sản phẩm (tức là, chất lượng); (d) tăng cường khả năng chống chịu của cây trồng hoặc ngăn ngừa nhiễm bệnh thực vật và các dịch hai động vật chân đốt, giun tròn hoặc ký sinh trùng động vật thân mềm; và (e) tăng cường khả năng chống chịu tác động môi trường của cây trồng như việc tiếp xúc với tác động nhiệt, độ ẩm dưới mức cho phép hoặc hóa chất độc tính.

Các hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của thực vật đã được xử lý so với thực vật không được xử lý bởi việc tiêu diệt hoặc ngăn chặn sự tiêu thụ thực vật của các loài gây hại không xương sống trong môi trường sống của thực vật. Trong trường hợp không phòng trừ các loài gây hại không xương sống đối với thực vật như vậy, thì các loài này gây hại sẽ làm giảm sực sống của thực vật bởi việc tiêu thụ các mô hoặc nhựa thực vật, hoặc truyền các tác nhân gây bệnh như các virut. Ngay cả khi không mặt các loài gây hại không xương sống đối với thực vật, thì các hợp chất theo sáng chế vẫn có thể làm tăng sức sống của thực vật bởi việc làm thay đổi sự trao đổi chất của thực vật. Nói chung, sức sống của cây trồng sẽ được nâng cao một cách đáng kể nhất nhờ việc xử lý thực vật bằng hợp chất theo sáng chế nếu như thực vật này sinh trưởng trong một môi trường không phải là lý tưởng, tức là môi trường bao gồm một hoặc nhiều khía cạnh bất lợi cho thực vật có được tiềm năng di truyền đầy đủ giống như trong môi trường lý tưởng.

Đáng lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường bao gồm các loài gây hại không xương sống tiêu thụ thưc vật. Cũng được lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường không bao gồm các loài gây hại không xương sống tiêu thụ thưc vật. Cũng được lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường có lượng ẩm dưới mức lý tưởng để hỗ trợ cho sự sinh trưởng của cây trồng. Đáng lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó cây trồng là lúa. Cũng được lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó

cây trồng là ngô (bắp). Cũng được lưu ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng trong đó cây trồng là đậu tương.

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc một số chất hoặc hoạt chất sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc tiệt dục, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất hấp dẫn côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virut hoặc nấm để tạo thành thuốc trừ sâu nhiều thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm bao gồm lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có có công thức 1, ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, các chất pha loãng rắn và các chất pha loãng lỏng, và ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế cùng với hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có công thức 1, để tạo thành hỗn hợp sơ chế, hoặc các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có công thức 1, và hai chế phẩm được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Các ví dụ về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể bào chế cùng với hợp chất theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acrinathrin, afidopyropen ([(3*S*,4*R*,4a*R*,6*S*,6a*S*,12*R*,12a*S*,12b*S*)-3-[(xyclopropylcarbonyl)oxy]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahydro-6,12-đihydroxy-4,6a,12b-trimetyl-11-oxo-9-(3-pyriđinyl)-2*H*,11*H*-naphto[2,1-*b*]pyrano[3,4-*e*]pyran-4-yl]metyl xyclopropancarboxylat), amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, , buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, xyantraniliprol (3-

brom-1-(3-clo-2-pyriđinyl)-*N*-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xyclaniliprol (3-brom-*N*-[2-brom-4-chloro-6-[[(1-xyclopropylethyl)amino]carbonyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyriđinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), cycloprothrin, cycloxaprid ((5*S*,8*R*)-1-[(6-chloro-3-pyriđinyl)metyl]-2,3,5,6,7,8-hexahyđro-9-nitro-5,8-Epoxy-1*H*-imiđazo[1,2-*a*]azepin) xyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenbutatin oxide, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flometoquin (2-etyl-3,7-đimetyl-6-[4-(trifloromethoxy)phenoxy]-4-quinolinyl metyl carbonat), flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron, flufenoxystrobin (metyl (α*E*)-2-[[2-clo-4-(trifloromethyl)phenoxy]metyl]-α-(metoxymetylen)benzenaxetat), fluensulfon (5-clo-2-[(3,4,4-trifloro-3-buten-1-yl)sulfonyl]thiazol), fluhexafon, fluopyram, flupiprol (1-[2,6-đicloro-4-(trifloromethyl)phenyl]-5-[(2-methyl-2-propen-1-yl)amino]-4-[(trifloromethyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-carbonitril), flupyrađifuron (4-[[(6-clo-3-pyriđinyl)metyl](2,2-difloroetyl)amino]-2(5*H*)-furanon), fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, heptafluthrin ([2,3,5,6-tetrafloro-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2-đimetyl-3-[(1*Z*)-3,3,3-trifloro-1-propen-1-yl]xyclopropancarboxylat), hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin ([2,3,5,6-tetrafloro-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl (1*R*,3*S*)-3-(2,2-đicloroetenyl)-2,2-đimetylxyclopropancarboxylat), metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methoprene, methoxychlor, metofluthrin, methoxyfenozide, metofluthrin, monocrotophos, monoflorothrin ([2,3,5,6-tetrafloro-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 3-(2-xyano-1-propen-1-yl)-2,2-đimetylxyclopropancarboxylat), nicotin, nitenpyram, nithiazine, novaluron,

noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumit (1,3,5-trimetyl-*N*-(2-metyl-1-oxopropyl)-*N*-[3-(2-metylpropyl)-4-[2,2,2-trifloro-1-metoxy-1-(trifloromethyl)etyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-4-carboxamit), pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin (methyl (α*E*)-2-[[[2-[(2,4-điclorophenyl)amino]-6-(trifloromethyl)-4-pyrimiđinyl]oxy]metyl]-α-(metoxymetylen)benzenaxetat), pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor (*N*-[metyloxiđo[1-[6-(trifloromethyl)-3-pyriđinyl]etyl]-λ^4-sulfanyliđen]xyanamit), tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylflutrin ([2,3,5,6-tetrafloro-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2,3,3-tetrametylxyclopropancarboxylat), tetraniliprole, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tioxazafen (3-phenyl-5-(2-thienyl)-1,2,4-oxađiazol), tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumezopyrim (muối nội 2,4-đioxo-1-(5-pyrimiđinylmetyl)-3-[3-(trifloromethyl)phenyl]-2*H*-pyriđo[1,2-*a*]pyrimiđini), triflumuron, các nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*, các vi khuẩn gây chết côn trùng, các virut gây chết côn trùng và nấm gây chết côn trùng.

Đáng lưu ý là các thuốc trừ sâu như abamectin, acetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, cycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamide, flufenoxuron, flufenoxystrobin, fluensulfone, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, heptafluthrin,

hexaflumuron, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methoprene, methoxyfenozide, metofluthrin, monofluorothrin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, tetramethylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, triazamate, triflumezopyrim, triflumuron, các nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*, toàn bộ chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng virut nucleo polyhedrosis.

Một phương án của chất sinh học để trộn với hợp chất theo sáng chế bao gồm vi khuẩn gây chết cho côn trùng như *Bacillus thuringiensis* và nội độc tố đelta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* như MVP® và MVPII® thuốc trừ sâu sinh học được điều chế bằng cách quy trình CellCap® (CellCap®, MVP® và MVPII® là nhãn hiệu hàng hoá của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); nấm gây chết cho côn trùng như nấm nho xạ xanh; và virut gây chết cho côn trùng (cả hai trong tự nhiên và biến đổi gen) như virut hình que, virut đa diện nhân (nucleopolyhedro virus - NPV) như HzNPV (*Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus), AfNPV (*Anagrapha falcifera* nucleopolyhedrovirus); và virut dạng hạt (granulosis virus-GV) như CpGV (*Cydia pomonella* granulosis virus).

Đặc biệt lưu ý là sự kết như vậy khi hoạt chất phòng trừ loài không xương sống thuộc một nhóm hóa học khác hoặc có vị trí tác động khác với hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, chế phẩm với ít nhất một phòng trừ hoạt chất loài gây hại không xương sống khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ được ưu tiên đặc biệt. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác nhau. Hợp chất hoặc chất có

hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các chất ức chế axetylcholinsteraza (AChE) như carbamates methomyl, oxamyl, thiodicarb, triazamate, và các phosphat hữu cơ như chlorpyrifos; các chất đối kháng kênh clorua cổng GABA như các xyclođien dieldrin và endosulfan, và các phenylpyrazol ethiprol và fipronil; các chất điều biến kênh natri như các pyrethroit bifenthrin, cyfluthrin, *beta*-cyfluthrin, cyhalothrin, *lambda*-cyhalothrin, cypermethrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerate, metofluthrin và profluthrin; các chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR) như các neonicotinoit acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiacloprid, và thiamethoxam, và sulfoxaflor; các chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR) như các spinosyn spinetoram và spinosad; các chất hoạt hóa kênh clorua như các avermectin abamectin và emamectin; các chất giả hocmon sinh trưởng như diofenolan, methoprene, fenoxycarb và pyriproxyfen; các chất phong bế chích hút của rầy mềm có chọn lọc như pymetrozine và flonicamid; các chất ức chế sinh trưởng bét ve như etoxazole; các chất ức chế mitochondrial ATP synthaza như propargite; chất kìm hãm quá trình phosphoryl oxy hóa thông qua việc làm gián đoạn građien proton như chlorfenapyr; các chất phong bế kênh thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR) như các chất tương tự nereistoxin cartap; các chất ức chế sinh tổng hợp chitin như các benzoylure flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron, và buprofezin; các chất làm gián đoạn lột xác côn trùng hai cánh như cyromazine; các chất đối kháng thụ thể hocmon kích thích trưởng thành và lột xác như các điaxylhyđrazin metoxyfenozit và tebufenozit; các chất đối kháng thụ thể octopamine như amitraz; các chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất III của ti thể như hydramethylnon; các chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất I của ti thể như pyridaben; các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế như indoxacarb; các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza như các axit tetronic và tetramic spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat; các chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất II của ti thể như các β-ketonitril cyenopyrafen và cyflumetofen; các chất điều biến thụ thể ryanidine như các antranilic điamit chlorantraniliprole,

cyantraniliprole và cyantraniliprole, các điamit như flubendiamide, và các phối tử thụ thể ryanodine như ryanodine; các hợp chất trong đó vị trí đích đáp ứng hoạt tính sinh học là chưa biết hoặc chưa được đặc tả như azadirachtin, bifenazate, pyridalyl, pyrifluquinazon and triflumezopyrim; các phá vỡ vi sinh các màng ruột côn trùng như *Bacillus thuringensis* và các chất tạo ra nội độc tố đelta và *Bacillus sphaericus*; và các tác nhân sinh học bao gồm các virut đa diện nhân (NPV) và các virut có khả năng trừ sâu khác trong tự nhiên hoặc biến đổi gen.

Ví dụ khác về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể bào chế được cùng với hợp chất theo sáng chế là: các thuốc diệt nấm như acibenzolar-S-methyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl (bao gồm benalaxyl-M), benodanil, benomyl, benthiavalicarb (bao gồm benthiavalicarb-isopropyl), benzovindiflupyr, bethoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, boscalid, bromuconazole, bupirimate, buthiobate, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, chlozolinate, copper hydroxide, copper oxychloride, copper sulfate, coumoxystrobin, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, diflumetorim, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole (bao gồm diniconazole-M), dinocap, dithianon, dithiolanes, dodemorph, dodine, econazole, etaconazole, edifenphos, enoxastrobin (còn được gọi là enestroburin), epoxiconazole, ethaboxam, ethirimol, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamide, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamine, fentin acetate, fentin hydroxide, ferbam, ferimzone, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxystrobin, flumorph, fluopicolide, fluopyram, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fthalide (còn được gọi là phthalide), fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, hexaconazole, hymexazole, guazatine, imazalil, imibenconazole, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, iodicarb, ipconazole, isofetamid, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil,

kasugamycin, kresoxim-methyl, mancozeb, mandipropamid, mandestrobin, maneb, mapanipyrin, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl (bao gồm metalaxyl-M/mefenoxam), metconazole, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenone, myclobutanil, naftitine, neo-asozin (ferric methanearsonate), nuarimol, octhilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, oxathiapiprolin, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, oxytetracycline, penconazole, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, perfurazoate, phosphorous acid (bao gồm các muối của nó, ví dụ, fosetyl-aluminm), picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propiconazole, propineb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributacarb, pyrifenox, pyriofenone, perisoxazole, pyrimethanil, pyrifenox, pyrrolnitrin, pyroquilon, quinconazole, quinmethionate, quinoxyfen, quintozene, silthiofam, sedaxane, simeconazole, spiroxamine, streptomycin, sulfur, tebuconazole, tebufloquin, teclofthalam, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, tolclofos-methyl, tolprocarb, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxide, tribasic copper sulfate, triclopyricarb, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizole, trimoprhamide tricyclazole, trifloxystrobin, triforine, triticonazole, uniconazole, validamycin, valifenalate (còn được gọi là valifenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamide and 1-[4-[4-[5-(2,6-điflorophenyl)-4,5-đihyđro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperiđinyl]-2-[5-metyl-3-(trifloromethyl)-1*H*-pyrazol-1-yl]etanon; các thuốc diệt giun tròn như fluopyram, spirotetramat, thiodicarb, fosthiazate, abamectin, iprodione, fluensulfone, dimethyl disulfide, tioxazafen, 1,3-dichloropropene (1,3-D), metam (natri và kali), dazomet, chloropicrin, fenamiphos, ethoprophos, cadusaphos, terbufos, imicyafos, oxamyl, carbofuran, tioxazafen, *Bacillus firmus* and *Pasteuria nishizawae*; các thuốc diệt khuẩn như streptomycin; các thuốc diệt bo ve amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben và tebufenpyrad.

Trong một số trường hợp, tổ hợp chứa hợp chất theo sáng chế với các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học (đặc biệt là phòng trừ loài gây hại không xương sống) có thể tạo ra hiệu quả lớn hơn cộng hợp (tức là hiệp đồng). Luôn mong muốn giảm bớt lượng chất hoá học được giải phóng ra môi trường trong khi vẫn đảm bảo việc phòng trừ động vật gây hại hữu hiệu. Khi tác dụng hiệp đồng của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được phát hiện ở tỷ lệ dùng mang lại mức phòng trừ động vật gây hại thoả đáng trong lĩnh vực nông nghiệp, các hỗn hợp này có thể làm giảm chi phí thu hoạch và ô nhiễm môi trường.

Các hợp chất theo sáng chế và chế phẩm chứa chúng có thể được phun cho cây chuyển gen để biểu hiện sự gây độc protein cho loài gây hại không xương sống (như nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*). Việc sử dụng này có thể tạo ra phổ bảo vệ cây rộng hơn và được ưu tiên về tính kháng. Tác dụng của việc áp dụng ngoại sinh hợp chất phòng trừ loài gây hại không xương sống theo sáng chế có thể hiệp đồng với được biểu hiện gây độc protein.

Các tài liệu tham khảo chung về các chất bảo vệ trong nông nghiệp này (tức là các thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ và tác nhân sinh học) gồm *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003 và *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001.

Đối với các phương án, trong đó một hoặc nhiều các thành phần trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ trọng lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) với hợp chất có công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Đáng lưu ý là tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm một cách đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Điều hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất có công thức 1.

Bảng A nêu các tổ hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác để minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế. Cột đầu tiên của Bảng A nêu chất phòng trừ loài gây hại không xương sống cụ thể (ví dụ,, "Abamectin" ở dòng đầu tiên). Cột thứ hai của Bảng A nêu kiểu tác động (nếu đã biết) của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống. Cột thứ ba của Bảng A nêu phương án/ các phương án thực hiện về các khoảng tỷ lệ khối lượng mà chất phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể được dùng so với tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống (ví dụ, "50:1 đến 1:50" abamectin so với hợp chất có công thức 1 theo khối lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng A nêu cụ thể tổ hợp của hợp chất có công thức 1 với abamectin có thể được dùng nằm trong khoảng tỷ lệ khối lượng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của Bảng A được cấu trúc tương tự. Bảng A còn nêu các hỗn hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế và gồm các phương án thực hiện bổ sung có khoảng tỷ lệ khối lượng với tỷ lệ dùng.

Bảng A

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng phổ biến
Abamectin	chất hoạt hóa kênh	50:1 tới 1:50
Acetamiprid	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	150:1 tới 1:200
Amitraz	chất đối kháng thụ thể octopamin	200:1 tới 1:100
Avermectin	lacton vòng lớn	50:1 tới 1:50
Azadirachtin	vị trí tác động chưa biết	100:1 tới 1:120
Beta-cyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Bifenthrin	chất điều biến kênh natri	100:1 tới 1:10
Buprofezin	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	500:1 tới 1:50
Cartap	chất phong bế kênh thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	100:1 tới 1:200
Chlorantraniliprole	chất điều biến thụ thể ryanođin	100:1 tới 1:120
Chlorfenapyr	chất kìm hãm quá trình phosphoryl hóa oxy hóa	300:1 tới 1:200

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng phổ biến
Chlorpyrifos	chất ức chế axetylcholinsteraza	500:1 tới 1:200
Clothianidin	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	100:1 tới 1:400
Cyantraniliprole	chất điều biến thụ thể Ryanođin	100:1 tới 1:120
Cyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Cyhalothrin	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Cypermethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Cyromazine	chất ức chế lột xác	400:1 tới 1:50
Deltamethrin	chất điều biến kênh natri	50:1 tới 1:400
Dieldrin	chất đối kháng kênh clorua cổng GABA	200:1 tới 1:100
Dinotefuran	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	150:1 tới 1:200
Diofenolan	chất giả hocmon sinh trưởng	150:1 tới 1:200
Emamectin	chất hoạt hóa kênh	50:1 tới 1:10
Endosulfan	chất đối kháng kênh clorua cổng GABA	200:1 tới 1:100
Esfenvalerate	chất điều biến kênh natri	100:1 tới 1:400
Ethiprole	chất đối kháng kênh clorua điều hòa cổng GABA	200:1 tới 1:100
Fenothiocarb		150:1 tới 1:200
Fenoxycarb	chất giả hocmon sinh trưởng	500:1 tới 1:100
Fenvalerate	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Fipronil	chất đối kháng kênh clorua điều hòa cổng GABA	150:1 tới 1:100
Flonicamid	chất phong bế tiêu thụ homopteran có chọn lọc	200:1 tới 1:100
Flubendiamide	chất điều biến thụ thể ryanođin	100:1 tới 1:120
Flufenoxuron	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	200:1 tới 1:100
Hexaflumuron	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	300:1 tới 1:50
Hydramethylnon	chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất III của ti thể	150:1 tới 1:250
Imidacloprid	thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR) agonist	1000:1 tới 1:1000
Indoxacarb	chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế	200:1 tới 1:50
Lambda-cyhalothrin	chất điều biến kênh natri	50:1 tới 1:250
Lufenuron	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	500:1 tới 1:250
Metaflumizone	chất phong bế kênh natri phụ thuộc	200:1 tới 1:200

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng phổ biến
	điện thế	
Methomyl	chất ức chế axetylcholinsteraza	500:1 tới 1:100
Methoprene	chất giả hocmon sinh trưởng	500:1 tới 1:100
Methoxyfenozide	chất đối kháng thụ thể ecđyson	50:1 tới 1:50
Nitenpyram	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	150:1 tới 1:200
Nithiazine	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	150:1 tới 1:200
Novaluron	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	500:1 tới 1:150
Oxamyl	chất ức chế axetylcholinsteraza	200:1 tới 1:200
Pymetrozine	chất phong bế trích hút của rầy mềm có chọn lọc	200:1 tới 1:100
Pyrethrin	chất điều biến kênh natri	100:1 tới 1:10
Pyridaben	chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất I của ti thể	200:1 tới 1:100
Pyridalyl	vị trí tác động chưa biết	200:1 tới 1:100
Pyriproxyfen	chất giả hocmon sinh trưởng	500:1 tới 1:100
Ryanodine	phối tử thụ thể ryanođin	100:1 tới 1:120
Spinetoram	chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	150:1 tới 1:100
Spinosad	chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	500:1 tới 1:10
Spirodiclofen	chất ức chế axetyl CoA carboxylaza	200:1 tới 1:200
Spiromesifen	chất ức chế axetyl CoA carboxylaza	200:1 tới 1:200
Tebufenozide	chất đối kháng thụ thể ecđyson	500:1 tới 1:250
Thiacloprid	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	100:1 tới 1:200
Thiamethoxam	chất đối kháng thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR)	1250:1 tới 1:1000
Thiodicarb	chất ức chế axetylcholinsteraza	500:1 tới 1:400
Thiosultap-sodium	Thụ thể nicotin axetylcholin (nAChR) chất phong bế kênh	150:1 tới 1:100
Tralomethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 tới 1:200
Triazamate	chất ức chế axetyl cholinsteraza	250:1 tới 1:100
Triflumezopyrim		
Triflumuron	chất ức chế sinh tổng hợp chitin	200:1 tới 1:100
Bacillus thuringiensis	tác nhân sinh học	50:1 tới 1:10
Bacillus thuringiensis	tác nhân sinh học	50:1 tới 1:10

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng phổ biến
delta-endotoxin		
NPV (ví dụ, Gemstar)	tác nhân sinh học	50:1 tới 1:10

Đáng lưu ý là chế phẩm theo sáng chế, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được nêu trong Bảng A trên.

Tỷ lệ khối lượng giữa một hợp chất, bao gồm hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung thường nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000, với một phương án nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, phương án khác nằm trong khoảng từ 250:1 đến 1:200 và phương án khác nữa nằm trong khoảng từ 100:1 và 1:50.

Sự liệt kê dưới đây trong các Bảng từ B1 tới B10 là các phương án của các chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (hợp chất được đánh số theo các hợp chất nêu trong các Bảng danh mục A-N) và và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung.

Bảng B1

Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Chất phòng trừ loài gây hại		Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Chất phòng trừ loài gây hại
B1-1	8	và	Abamectin		B1-38	8	và	Indoxacarb
B1-2	8	và	Acetamiprid		B1-39	8	và	Lambda-cyhalothrin
B1-3	8	và	Amitraz		B1-40	8	và	Lufenuron
B1-4	8	và	Avermectin		B1-41	8	và	Metaflumizone
B1-5	8	và	Azadirachtin		B1-42	8	và	Methomyl
B1-6	8	và	Bensultap		B1-43	8	và	Methoprene
B1-7	8	và	Beta-cyfluthrin		B1-44	8	và	Methoxyfenozide
B1-8	8	và	Bifenthrin		B1-45	8	và	Nitenpyram
B1-9	8	và	Buprofezin		B1-46	8	và	Nithiazine
B1-10	8	và	Cartap		B1-47	8	và	Novaluron
B1-11	8	và	Chlorantraniliprole		B1-48	8	và	Oxamyl
B1-12	8	và	Chlorfenapyr		B1-49	8	và	Phosmet
B1-13	8	và	Chlorpyrifos		B1-50	8	và	Pymetrozine
B1-14	8	và	Clothianidin		B1-51	8	và	Pyrethrin
B1-15	8	và	Cyantraniliprole		B1-52	8	và	Pyridaben
B1-16	8	và	Cyfluthrin		B1-53	8	và	Pyridalyl
B1-17	8	và	Cyhalothrin		B1-54	8	và	Pyriproxyfen

Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Chất phòng trừ loài gây hại		Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Chất phòng trừ loài gây hại
B1-18	8	và	Cypermethrin		B1-55	8	và	Ryanodine
B1-19	8	và	Cyromazine		B1-56	8	và	Spinetoram
B1-20	8	và	Deltamethrin		B1-57	8	và	Spinosad
B1-21	8	và	Dieldrin		B1-58	8	và	Spirodiclofen
B1-22	8	và	Dinotefuran		B1-59	8	và	Spiromesifen
B1-23	8	và	Diofenolan		B1-60	8	và	Spirotetramat
B1-24	8	và	Emamectin		B1-61	8	và	Sulfoxaflor
B1-25	8	và	Endosulfan		B1-62	8	và	Tebufenozide
B1-26	8	và	Esfenvalerate		B1-63	8	và	Tefluthrin
B1-27	8	và	Ethiprole		B1-64	8	và	Thiacloprid
B1-28	8	và	Fenothiocarb		B1-65	8	và	Thiamethoxam
B1-29	8	và	Fenoxycarb		B1-66	8	và	Thiodicarb
B1-30	8	và	Fenvalerate		B1-67	8	và	Thiosultap-sodium
B1-31	8	và	Fipronil		B1-68	8	và	Tolfenpyrad
B1-32	8	và	Flonicamid		B1-69	8	và	Tralomethrin
B1-33	8	và	Flubendiamide		B1-70	8	và	Triazamate
B1-34	8	và	Flufenoxuron		B1-71	8	và	Triflumezopyrim
B1-35	8	và	Hexaflumuron		B1-72	8	và	Triflumuron
B1-36	8	và	Hydramethylnon		B1-73	8	và	*Bacillus thuringiensis*
B1-37	8	và	Imidacloprid		B1-74	8	và	*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin
					B1-75	8	và	NPV (e.g., Gemstar)

Bảng B2

Bảng B2 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 14. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B2 được ký hiệu là B2-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 14 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B3

Bảng B3 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 16. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B3 được ký hiệu là B3-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 16 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B4

Bảng B4 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 19. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B4 được ký hiệu là B4-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 19 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B5

Bảng B5 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 41. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B5 được ký hiệu là B5-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 41 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B6

Bảng B6 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 42. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B6 được ký hiệu là B6-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 42 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B8

Bảng B8 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B8 được ký hiệu là B8-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 54 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B9

Bảng B9 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 55. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B9 được ký hiệu là B9-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 55 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B10

Bảng B10 là giống hệt Bảng B1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 76. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong Bảng B10

được ký hiệu là B10-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 76 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Các hỗn hợp cụ thể được liệt kê trong các Bảng từ B1 tới B10 là sự kết hợp thông thường giữa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác theo tỷ lệ đã nêu trong Bảng A.

Sự liệt kê dưới đây trong các Bảng từ C1 tới C10 là các hỗn hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (hợp chất được đánh số theo các hợp chất nêu trong các Bảng danh mục A-N) và và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung. Các Bảng C1 tới C10 cũng liệt kê các tỷ lệ khối lượng cụ thể phổ biến cho các hỗn hợp nêu trong các Bảng C1 tới C10. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C1 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 8 nêu trong Bảng danh mục A cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C1

Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Chất phòng trừ loài gây hại	Tỷ lệ hỗn hợp tiêu biểu (theo khối lượng)								
C1-1	8	và	Abamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-2	8	và	Acetamiprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-3	8	và	Amitraz	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-4	8	và	Avermectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-5	8	và	Azadirachtin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-6	8	và	Bensultap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-7	8	và	Beta-cyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-8	8	và	Bifenthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-9	8	và	Buprofezin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-10	8	và	Cartap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-11	8	và	Chlorantraniliprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-12	8	và	Chlorfenapyr	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-13	8	và	Chlorpyrifos	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-14	8	và	Clothianidin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-15	8	và	Cyantraniliprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-16	8	và	Cyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-17	8	và	Cyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-18	8	và	Cypermethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-19	8	và	Cyromazine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-20	8	và	Deltamethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	8	và	Dieldrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	8	và	Dinotefuran	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	8	và	Diofenolan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	8	và	Emamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	8	và	Endosulfan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	8	và	Esfenvalerate	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	8	và	Ethiprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	8	và	Fenothiocarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	8	và	Fenoxycarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	8	và	Fenvalerate	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	8	và	Fipronil	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	8	và	Flonicamid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	8	và	Flubendiamide	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	8	và	Flufenoxuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	8	và	Hexaflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	8	và	Hydramethylnon	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	8	và	Imidacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	8	và	Indoxacarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	8	và	Lambda-cyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	8	và	Lufenuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	8	và	Metaflumizone	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	8	và	Methomyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	8	và	Methoprene	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	8	và	Methoxyfenozide	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	8	và	Nitenpyram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	8	và	Nithiazine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	8	và	Novaluron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	8	và	Oxamyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	8	và	Phosmet	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	8	và	Pymetrozine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	8	và	Pyrethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	8	và	Pyridaben	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	8	và	Pyridalyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	8	và	Pyriproxyfen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	8	và	Ryanodine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	8	và	Spinetoram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	8	và	Spinosad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	8	và	Spirodiclofen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	8	và	Spiromesifen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	8	và	Spirotetramat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	8	và	Sulfoxaflor	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	8	và	Tebufenozide	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	8	và	Tefluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	8	và	Thiacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-65	8	và	Thiamethoxam	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	8	và	Thiodicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	8	và	Thiosultap-sodium	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	8	và	Tolfenpyrad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	8	và	Tralomethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	8	và	Triazamate	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	8	và	Triflumezopyrim	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	8	và	Triflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	8	và	*Bacillus thuringiensis*	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	8	và	*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-75	8	và	NPV (e.g., Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Bảng C2

Bảng C2 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 14. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C2 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 14 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C3

Bảng C3 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 16. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C3 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 16 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C4

Bảng C4 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 19. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C4 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 19 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C5

Bảng C5 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 41. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ

nhất của Bảng C5 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 41 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C6

Bảng C6 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 42. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C6 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 42 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C8

Bảng C8 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 54. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C8 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 54 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C9

Bảng C9 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 55. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C9 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 55 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C10

Bảng C10 là giống hệt Bảng C1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 76. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên ở dòng thứ nhất của Bảng C10 mô tả cho hỗn hợp cụ thể gồm Hợp chất 76 cùng với abamectin được áp dụng theo tỷ lệ khối lượng là 100 phần Hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Được liệt kê ở dưới trong các Bảng D1 tới D10 là các phương án về các chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (sự đánh số các hợp chất là như nêu trong các Bảng danh mục A-N) và thuốc diệt nấm bổ sung.

Bảng D1

Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Thuốc diệt nấm		Hỗn hợp No.	Hợp chất No.	và	Thuốc diệt nấm
D1-1	8	và	Probenazole		D1-17	8	và	Difenoconazole
D1-2	8	và	Tiadinil		D1-18	8	và	Cyproconazole
D1-3	8	và	Isotianil		D1-19	8	và	Propiconazole
D1-4	8	và	Pyroquilon		D1-20	8	và	Fenoxanil
D1-5	8	và	Metominostrobin		D1-21	8	và	Ferimzone
D1-6	8	và	Flutolanil		D1-22	8	và	Fthalide
D1-7	8	và	Validamycin		D1-23	8	và	Kasugamycin
D1-8	8	và	Furametpyr		D1-24	8	và	Picoxystrobin
D1-9	8	và	Pencycuron		D1-25	8	và	Penthiopyrad
D1-10	8	và	Simeconazole		D1-26	8	và	Famoxadone
D1-11	8	và	Orysastrobin		D1-27	8	và	Cymoxanil
D1-12	8	và	Trifloxystrobin		D1-28	8	và	Proquinazid
D1-13	8	và	Isoprothiolane		D1-29	8	và	Flusilazole
D1-14	8	và	Azoxystrobin		D1-30	8	và	Mancozeb
D1-15	8	và	Tricyclazole		D1-31	8	và	Copper hydroxide
D1-16	8	và	Hexaconazole		D1-32	8	và	(a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-điflorophenyl)-4,5-đihyđro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperiđinyl]-2-[5-metyl-3-(trifloromety)-1*H*-pyrazol-1-yl]etanon

Bảng D2

Bảng D2 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 14. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D2 được ký hiệu là D2-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 14 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D3

Bảng D3 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 16. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D3 được ký hiệu là D3-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 16 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D4

Bảng D4 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 19. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D4 được ký hiệu là D4-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 19 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D5

Bảng D5 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 41. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D5 được ký hiệu là D5-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 41 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D6

Bảng D6 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 42. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D6 được ký hiệu là D6-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 42 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D8

Bảng D8 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D8 được ký hiệu là D8-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 54 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D9

Bảng D9 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 55. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D9 được ký hiệu là D9-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 55 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D10

Bảng D10 là giống hệt Bảng D1, ngoại trừ hợp chất 8 trong cột "Hợp chất No." được thay thế bằng hợp chất 76. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D10 được ký hiệu là D10-1 và là hỗn hợp gồm hợp chất 76 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Các loài gây hại không xương sống được phòng trừ trong các lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp bằng cách đưa một hoặc nhiều hoạt chất theo sáng chế, thường dưới dạng chế phẩm, với lượng hữu hiệu sinh học, vào môi trường sống

của các loài gây hại, bao gồm các khu vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp bị phá hại, khu vực cần được bảo vệ, hoặc đưa trực tiếp lên các loài gây hại cần được phòng trừ.

Vì vậy, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp, bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế hoặc với chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này và lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Ví dụ về chế phẩm thích hợp chứa hợp chất theo sáng chế và lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung bao gồm chế phẩm dạng hạt, trong đó hoạt chất bổ sung có mặt trong cùng hạt chứa hợp chất theo sáng chế hoặc trong hạt tách biệt với hợp chất theo sáng chế.

Để đạt được việc tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống, hợp chất hoặc chế phẩm thường được áp dụng cho hạt của cây trước khi trồng, cho lá (ví dụ, lá, thân, hoa, quả) của cây trồng hoặc cho đất hoặc môi trường phát triển khác trước khi hoặc sau khi cây được trồng.

Theo một phương án của phương pháp tiếp xúc là bằng cách phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng hạt chứa hợp chất theo sáng chế có thể được phun lên tán lá hoặc vào đất. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được vận chuyển một cách hiệu quả thông qua sự hấp thụ của cây bằng cách cho cây tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế được phun vào đất ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất, chế phẩm dạng hạt, xử lý vườn ươm hoặc ngâm mảnh cấy ghép. Đáng lưu ý là chế phẩm theo sáng chế ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Cũng đáng lưu ý là phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với hợp chất theo sáng chế với lượng hữu hiệu sinh học. Tốt hơn nữa, nếu phương pháp, trong đó môi trường là đất và hỗn hợp được đưa vào đất dưới dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Cũng đáng lưu ý là hợp chất theo sáng chế cũng hiệu quả bằng cách phun khu trú

vào vị trí bị phá hại. Các phương pháp tiếp xúc khác bao gồm phun hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trực tiếp và phun tồn lưu, phun khí, gel, phủ hạt, tạo vi nang, hấp thu có hệ thống, mồi, vòng đeo tai, viên thức ăn, dạng sương mù, thuốc hun, dạng sol khí, dạng bụi và một số dạng khác. Một phương án thực hiện về phương pháp tiếp xúc là dạng hạt phân bón ổn định về kích thước, dạng thỏi hoặc dạng viên nén chứa hỗn hợp hoặc chế phẩm theo sáng chế. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể kết hợp với vật liệu để tạo ra dụng cụ phòng trừ động vật không xương sống (ví dụ, lưới bẫy côn trùng).

Các hợp chất của sáng chế hữu ích cho việc xử lý toàn bộ thực vật, bộ phận thực vật và hạt giống. Các giống thực vật và hạt giống có thể được tạo ra bằng cách phương pháp nhân giống thông thường hoặc bởi phương pháp kỹ thuật di truyền. Hạt giống hoặc thực vật được biến đổi di truyền (hạt giống hoặc thực vật biến đổi gen) là các loại thực vật trong đó một gen dị (gen chuyển) đã được tích hợp ổn định vào hệ gen của thực vật hoặc hạt giống. Một gen chuyển được xác định bởi vị trí cụ thể của nó trong hệ gen được gọi là sự biến đổi hoặc sự kiện biến đổi gen.

Các thực vật và hạt giống cây trồng được biến đổi di truyền có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm các loại có tính kháng với một hoặc nhiều tác động sinh học (loài gây hại như giun tròn, các côn trùng, ve bét, nấm, v.v.) hoặc tác động phi sinh học (khô hạn, nhiệt độ lạnh giá, đất nhiễm mặn, v.v.), hoặc các đặc tính có thể được mong muốn khác. Thực vật và hạt giống có thể được biến đổi di truyền để biểu hiện các tính trạng, ví dụ, khả năng chịu thuốc diệt cỏ, tính kháng côn trùng, profin dầu được cải biến hoặc khả năng chịu khô hạn. Thực vật và hạt giống đã được biến đổi di truyền hữu dụng mang các sự kiện biến đổi gen đơn hoặc tổ hợp của các sự kiện biến đổi được nêu trong Bảng Z. Các thông tin bổ sung về các cải biến di truyền được liệt kê trong Bảng Z có thể tìm được từ các nguồn dữ liệu sau:

http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx

http://www.aphis.usda.go

http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu

Các chữ viết tắt sau được dùng trong Bảng Z: SU là chữ viết tắt cho sulfonylure, ALS là chữ viết tắt cho axetolactat syntaza, HPPD là chữ viết tắt cho 4-hyđroxyphenylpyruvat đioxyza.

Bảng Z

Cây trồng	Tên sự kiện	Mã sự kiện	Đặc điểm	Gen
Linh thảo	J101	MON-00101-8	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Linh thảo	J163	MON-ii163-7	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cải ngọt*	23-18-17 (Event 18)	CGN-89465-2	Dầu axit lauric cao	te
Cải ngọt*	23-198 (Event 23)	CGN-89465-2	Dầu axit lauric cao	te
Cải ngọt*	61061	DP-i61i61-7	Chịu dung nạp glyphosat	gat4621
Cải ngọt*	73496	DP-i73496-4	Chịu dung nạp glyphosat	gat4621
Cải ngọt*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải ngọt*	GT73 (RT73)	MON-iii73-7	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải ngọt*	HCN10 (Topas 19/2)	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	HCN28 (T45)	ACS-BNii8-2	Chịu dung nạp glufosinat	pat (syn)
Cải ngọt*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNii7-1	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	MON88302	MON-883i2-9	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cải ngọt*	MPS961	Không xác định	Phân hủy phytat	phyA
Cải ngọt*	MPS962	Không xác định	Phân hủy phytat	phyA
Cải ngọt*	MPS963	Không xác định	Phân hủy phytat	phyA
Cải ngọt*	MPS964	Không xác định	Phân hủy phytat	phyA
Cải ngọt*	MPS965	Không xác định	Phân hủy phytat	phyA
Cải ngọt*	MS1 (B91-4)	ACS-BNii4-7	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	MS8	ACS-BNii5-8	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	OXY-235	ACS-BNi11-5	Chịu dung nạp oxynil	bxn
Cải ngọt*	PHY14	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	PHY23	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	PHY35	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	PHY36	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	RF1 (B93-101)	ACS-BNii1-4	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	RF2 (B94-2)	ACS-BNii2-5	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Cải ngọt*	RF3	ACS-BNii3-6	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Đậu hạt	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	Kháng bệnh	ac1 (sense and antisense)
Cà tím (Eggplant)	EE-1		Kháng côn trùng	cry1Ac
Hoa cẩm chướng	11 (7442)	FLO-07442-4	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)

Hoa cẩm chướng	11363 (1363A)	FLO-11363-1	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	1226A (11226)	FLO-11226-8	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	123.2.2 (40619)	FLO-4i619-7	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	123.2.38 (40644)	FLO-4i644-4	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	123.8.12	FLO-4i689-6	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	123.8.8 (40685)	FLO-4i685-1	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	1351A (11351)	FLO-11351-7	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	1400A (11400)	FLO-114ii-2	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	15	FLO-iii15-2	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	16	FLO-iii16-3	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	4	FLO-iiii4-9	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	66	FLO-iii66-8	Chịu dung nạp SU; lão hóa chậm	surB; acc
Hoa cẩm chướng	959A (11959)	FLO-11959-3	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	988A (11988)	FLO-11988-7	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	26407	IFD-26497-2	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Hoa cẩm chướng	25958	IFD-25958-3	Chịu dung nạp SU; màu hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Rau diếp xoăn	RM3-3	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-4	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-6	Không xác định	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Bông	19-51a	DD-i1951A-7	Chịu dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	S4-HrA
Bông	281-24-236	DAS-24236-5	Chịu dung nạp glufosinat; kháng côn trùng	pat (syn); cry1F
Bông	3006-210-23	DAS-21i23-5	Chịu dung nạp glufosinat; kháng côn trùng	pat (syn); cry1Ac
Bông	31707	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil; kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31803	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil; kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31807	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil; kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31808	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil; kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	42317	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil; kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	BNLA-601	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	BXN10211	BXN10211-9	Chịu dung nạp oxynil	bxn; cry1Ac

Bông	BXN10215	BXN10215-4	Chịu dung nạp oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	BXN10222	BXN10222-2	Chịu dung nạp oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	BXN10224	BXN10224-4	Chịu dung nạp oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	COT102	SYN-IR102-7	Kháng côn trùng	vip3A(a)
Bông	COT67B	SYN-IR67B-1	Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	COT202		Kháng côn trùng	vip3A
Bông	Event 1	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Kháng côn trùng	cry1Ab-Ac
Bông	GHB119	BCS-GH005-8	Kháng côn trùng	cry2Ae
Bông	GHB614	BCS-GH002-5	Chịu dung nạp glyphosat	2mepsps
Bông	GK12	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ab-Ac
Bông	LLBông25	ACS-GH001-3	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Bông	MLS 9124	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1C
Bông	MON1076	MON-89924-2	Kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON1445	MON-01445-2	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	MON15985	MON-15985-7	Kháng côn trùng	cry1Ac; cry2Ab2
Bông	MON1698	MON-89383-1	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	MON531	MON-00531-6	Kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON757	MON-00757-7	Kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON88913	MON-88913-8	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	Nqwe Chi 6 Bt	Không xác định	Kháng côn trùng	NA?
Bông	SKG321	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1A; CpTI
Bông	T303-3	BCS-GH003-6	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Bông	T304-40	BCS-GH004-7	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Bông	CE43-67B		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	CE46-02A		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	CE44-69D		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	1143-14A		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	1143-51B		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	T342-142		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	PV-GHGT07 (1445)		Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	EE-GH3		Chịu dung nạp glyphosat	mepsps
Bông	EE-GH5		Kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	MON88701	MON-88701-3	Chịu dung nạp đicamba & glufosinat	Modified dmo; bar
Bông	OsCr11		Chống dị ứng	Modified Cry j
Cỏ Bentgrass	ASR368	SMG-368ii-2	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bạch đàn	20-C		Chịu dung nạp muối	codA

Bạch đàn	12-5C		Chịu dung nạp muối	codA
Bạch đàn	12-5B		Chịu dung nạp muối	codA
Bạch đàn	107-1		Chịu dung nạp muối	codA
Bạch đàn	1/9/2001		Chịu dung nạp muối	codA
Bạch đàn	2/1/2001		Chịu dung nạp muối	codA
Bạch đàn			Chịu dung nạp lạnh	des9
Gai	FP967	CDC-FL001-2	Chịu dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	als
Đậu Lentil	RH44		Chịu dung nạp Imiđazolinon	als
Bắp	3272	SYN-E3272-5	Anpha-amylaza đã cải biến	amy797E
Bắp	5307	SYN-05307-1	Kháng côn trùng	ecry3.1Ab
Bắp	59122	DAS-59122-7	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	676	PH-000676-7	Chịu dung nạp glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	678	PH-000678-9	Chịu dung nạp glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	680	PH-000680-2	Chịu dung nạp glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	98140	DP-098140-6	Chịu dung nạp glyphosat; Chịu dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	gat4621; zm-hra
Bắp	Bt10	Không xác định	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Ab; pat
Bắp	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Bắp	BVLA430101	NA	Phân hủy phytat	phyA2
Bắp	CBH-351	ACS-ZM004-3	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry9C; bar
Bắp	DAS40278-9	DAS40278-9	Chịu dung nạp 2,4-D	aad-1
Bắp	DBT418	DKB-89614-9	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Ac; pinII; bar
Bắp	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Bắp	GA21	MON-00021-9	Chịu dung nạp glyphosat	mepsps
Bắp	GG25		Chịu dung nạp glyphosat	mepsps
Bắp	GJ11		Chịu dung nạp glyphosat	mepsps
Bắp	Fl117		Chịu dung nạp glyphosat	mepsps
Bắp	GAT-ZM1		Chịu dung nạp glufosinat	pat
Bắp	LY038	REN-00038-3	Tăng lysin	cordapA
Bắp	MIR162	SYN-IR162-4	Kháng côn trùng	vip3Aa20
Bắp	MIR604	SYN-IR604-5	Kháng côn trùng	mcry3A
Bắp	MON801 (MON80100)	MON801	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON802	MON-80200-7	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON809	PH-MON-809-2	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON810	MON-00810-6	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247

Bắp	MON832	NA	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON863	MON-00863-5	Kháng côn trùng	cry3Bb1
Bắp	MON87427	MON-87427-7	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	MON87460	MON-87460-4	Chịu hạn hán	cspB
Bắp	MON88017	MON-88017-3	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glyphosat	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	MON89034	MON-89034-3	Kháng côn trùng	cry2Ab2; cry1A.105
Bắp	MS3	ACS-ZM001-9	Chịu dung nạp glufosinat; kiểm soát thụ phấn	bar; barnase
Bắp	MS6	ACS-ZM005-4	Chịu dung nạp glufosinat; kiểm soát thụ phấn	bar; barnase
Bắp	NK603	MON-00603-6	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	T14	ACS-ZM002-1	Chịu dung nạp glufosinat	pat (syn)
Bắp	T25	ACS-ZM003-2	Chịu dung nạp glufosinat	pat (syn)
Bắp	TC1507	DAS-01507-1	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1Fa2; pat
Bắp	TC6275	DAS-06275-8	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	mocry1F; bar
Bắp	VIP1034		Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	vip3A; pat
Bắp	43A47	DP-043A47-3	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	40416	DP-040416-8	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	32316	DP-032316-8	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	4114	DP-004114-3	Kháng côn trùng; chịu dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Dưa gang	Melon A	Không xác định	Làm chậm chín/lão hóa	sam-k
Dưa gang	Melon B	Không xác định	Làm chậm chín/lão hóa	sam-k
Đu đủ	55-1	CUH-CP551-8	Kháng bệnh	prsv cp
Đu đủ	63-1	CUH-CP631-7	Kháng bệnh	prsv cp
Đu đủ	Huanong No. 1	Không xác định	Kháng bệnh	prsv rep
Đu đủ	X17-2	UFL-X17CP-6	Kháng bệnh	prsv cp
Dạ yên thảo	Petunia-CHS	Không xác định	Biến đổi chất lượng sản phẩm	CHS suppres.sion
Mận	C-5	ARS-PLMC5-6	Kháng bệnh	ppv cp
Cải ngọt**	ZSR500	Không xác định	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải ngọt**	ZSR502	Không xác định	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải ngọt**	ZSR503	Không xác định	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bạch dương	Bt poplar	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ac; API
Bạch dương	Hybrid poplar clone 741	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ac; API
Bạch dương	trg300-1		Xenluloza cao	AaXEG2
Bạch	trg300-2		Xenluloza cao	AaXEG2

dương				
Khoai tây	1210 amk	Không xác định	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	2904/1 kgs	Không xác định	Kháng côn trùng	cry3A
Cải ngọt**	ZSR500	Không xác định	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải ngọt**	ZSR502	Không xác định	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Khoai tây	ATBT04-27	NMK-89367-8	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-30	NMK-89613-2	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-31	NMK-89170-9	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-36	NMK-89279-1	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-6	NMK-89761-6	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT06	NMK-89812-3	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT10	NMK-89175-5	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT12	NMK-89601-8	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT16	NMK-89167-6	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT17	NMK-89593-9	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT18	NMK-89906-7	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT23	NMK-89675-1	Kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	EH92-527-1	BPS-25271-9	Biến đổi tinh bột/carbohyđra	gbss (antisense)
Khoai tây	HLMT15-15	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-3	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-46	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT15-101	NMK-89653-6	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT21-129	NMK-89684-1	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-152	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-350	NMK-89185-6	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT22-082	NMK-89896-6	Kháng côn trùng/bệnh; Chịu dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-186	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh; Chịu dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-238	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh; Chịu dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-262	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh; Chịu dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	SEMT15-02	NMK-89935-9	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-07	Không xác định	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-15	NMK-89930-4	Kháng côn trùng/bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SPBT02-5	NMK-89576-1	Kháng côn trùng	cry3A

Khoai tây	SPBT02-7	NMK-89724-5	Kháng côn trùng	cry3A
Lúa	7Crp#242-95-7		Chống dị ứng	7crp
Lúa	7Crp#10	Không xác định	Chống dị ứng	7crp
Lúa	GM Shanyou 63	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ab; cry1Ac
Lúa	Huahui-1/TT51-1	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ab; cry1Ac
Lúa	LLRICE06	ACS-OS001-4	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Lúa	LLRICE601	BCS-OS003-7	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Lúa	LLRICE62	ACS-OS002-5	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Lúa	Tarom molaii + cry1Ab	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ab (truncated)
Lúa	GAT-OS2		Chịu dung nạp glufosinat	bar
Lúa	GAT-OS3		Chịu dung nạp glufosinat	bar
Lúa	PE-7		Kháng côn trùng	Cry1Ac
Lúa	7Crp#10	Không xác định	Chống dị ứng	7crp
Lúa	KPD627-8		Tryptophan cao	OASA1D
Lúa	KPD722-4		Tryptophan cao	OASA1D
Lúa	KA317		Tryptophan cao	OASA1D
Lúa	HW5		Tryptophan cao	OASA1D
Lúa	HW1		Tryptophan cao	OASA1D
Lúa	B-4-1-18		Dựng lá xoắn	Ä OsBRI1
Lúa	G-3-3-22		Xoắn lá	OSGA2ox1
Lúa	AD77		Kháng bệnh	DEF
Lúa	AD51		Kháng bệnh	DEF
Lúa	AD48		Kháng bệnh	DEF
Lúa	AD41		Kháng bệnh	DEF
Lúa	13pNasNaatAprt1		Kém chịu dung nạp sắt	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
Lúa	13pAprt1		Kém chịu dung nạp sắt	APRT
Lúa	gHvNAS1-gHvNAAT-1		Kém chịu dung nạp sắt	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
Lúa	gHvIDS3-1		Kém chịu dung nạp sắt	HvIDS3
Lúa	gHvNAAT1		Kém chịu dung nạp sắt	HvNAAT-A; HvNAAT-B
Lúa	gHvNAS1-1		Kém chịu dung nạp sắt	HvNAS1
Lúa	NIA-OS006-4		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS005-3		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS004-2		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS003-1		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS002-9		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS001-8		Kháng bệnh	WRKY45
Lúa	OsCr11		Chống dị ứng	Modified Cry j
Lúa	17053		Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

Lúa	17314		Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Hoa hồng	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	Màu hoa biến đổi	5AT; bp40 (f3'5'h)
Hoa hồng	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	Màu hoa biến đổi	5AT; bp40 (f3'5'h)
Đỗ tương	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	Không xác định	Biến đổi dầu/axit béo	gm-fad2-1 (silencing locus)
Đỗ tương	A2704-12	ACS-GM005-3	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	A2704-21	ACS-GM004-2	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	A5547-127	ACS-GM006-4	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	A5547-35	ACS-GM008-6	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	CV127	BPS-CV127-9	Chịu dung nạp Imiđazolinon	csr1-2
Đỗ tương	DAS68416-4	DAS68416-4	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	DP305423	DP-305423-1	Biến đổi dầu/axit béo; Chịu dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	gm-fad2-1 (silencing locus); gm-hra
Đỗ tương	DP356043	DP-356043-5	Biến đổi dầu/axit béo; chịu dung nạp glyphosat	gm-fad2-1 (silencing locus); gat4601
Đỗ tương	FG72	MST-FG072-3	Chịu dung nạp glyphosat & HPPD	2mepsps; hppdPF W336
Đỗ tương	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Đỗ tương	GU262	ACS-GM003-1	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Đỗ tương	MON87701	MON-87701-2	Kháng côn trùng	cry1Ac
Đỗ tương	MON87705	MON-87705-6	Biến đổi dầu/axit béo; chịu dung nạp glyphosat	fatb1-A (sense & antisense); fad2-1A (sense & antisense); cp4 epsps (aroA:CP4)
Đỗ tương	MON87708	MON-87708-9	Chịu dung nạp đicamba & glyphosat	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đỗ tương	MON87769	MON-87769-7	Biến đổi dầu/axit béo; chịu dung nạp glyphosat	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đỗ tương	MON89788	MON-89788-1	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Đỗ tương	W62	ACS-GM002-9	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Đỗ tương	W98	ACS-GM001-8	Chịu dung nạp glufosinat	bar
Đỗ tương	MON87754	MON-87754-1	Dầu cao	dgat2A
Đỗ tương	DAS21606	DAS-21606	Chịu dung nạp aryloxyalkanoat & glufosinat	Modified aad-12; pat
Đỗ tương	DAS44406	DAS-44406-6	Chịu dung nạp aryloxyalkanoat, glyphosat & glufosinat	Modified aad-12; 2mepsps; pat
Đỗ tương	SYHT04R	SYN-0004R-8	Chịu dung nạp mesotrion	Modified avhppd
Đỗ tương	9582.814.19.1		Kháng côn trùng & chịu dung nạp glufosinat	cry1Ac, cry1F, PAT
Bí đao	CZW3	SEM-iCZW3-2	Kháng bệnh	cmv cp, zymv cp, wmv cp
Bí đao	ZW20	SEM-0ZW20-7	Kháng bệnh	zymv cp, wmv cp
Củ cải đường	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Củ cải đường	H7-1	KM-000H71-4	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

Củ cải đường	T120-7	ACS-BV001-3	Chịu dung nạp glufosinat	pat
Củ cải đường	T227-1		Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Mía	NXI-1T		Chịu hạn hán	EcbetA
Hoa hướng dương	X81359		Chịu dung nạp Imiđazolinon	als
Ớt ngọt	PK-SP01	Không xác định	Kháng bệnh	cmv cp
Thuốc lá	C/F/93/08-02	Không xác định	Chịu dung nạp oxynil	bxn
Thuốc lá	Vector 21-41	Không xác định	Giảm nicotin	NtQPT1 (antisense)
Cà chua	1345-4	Không xác định	Làm chậm chín/lão hóa	acc (truncated)
Cà chua	35-1-N	Không xác định	Làm chậm chín/lão hóa	sam-k
Cà chua	5345	Không xác định	Kháng côn trùng	cry1Ac
Cà chua	8338	CGN-89322-3	Làm chậm chín/lão hóa	accd
Cà chua	B	SYN-0000B-6	Làm chậm chín/lão hóa	pg (sense or antisense)
Cà chua	Da	SYN-0000DA-9	Làm chậm chín/lão hóa	pg (sense or antisense)
Hoa hướng dương	X81359		Chịu dung nạp Imiđazolinon	als
Cà chua	Da Dong No 9	Không xác định	Biến đổi sản phẩm	NA
Cà chua	F (1401F, h38F, 11013F,7913F)	SYN-0000F-1	Làm chậm chín/lão hóa	pg (sense or antisense)
Cà chua	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Làm chậm chín/lão hóa	pg (sense or antisense)
Cà chua	Huafan No 1	Không xác định	Làm chậm chín/lão hóa	anti-efe
Cà chua	PK-TM8805R (8805R)	Không xác định	Kháng bệnh	cmv cp
Lúa mì	MON71800	MON-718ii-3	Chịu dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

* Achentina, ** Ba lan, # Anh

Việc xử lý các hạt giống và thực vật đã được biến đổi di truyền bằng các hợp chất theo sáng chế có thể thu được các tác dụng bổ trợ tuyệt vời hoặc tác dụng hiệp đồng. Ví dụ, việc giảm mức liều dùng, nới rộng phổ hoạt tính, tăng khả năng chịu tác động sinh học/phi sinh học hoặc độ bền cất giữ có thể cao hơn so với các tác dụng bổ trợ đơn thuần được mong đợi với các hạt giống và thực vật đã được biến đổi di truyền.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể hữu ích để xử lý hạt để bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống. Trong bản mô tả này, việc xử lý hạt có nghĩa là cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo sáng chế, mà nó

thường được bào chế dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Việc xử lý hạt này bảo vệ hạt khỏi loài loài gây hại không xương sống trong đất và thường còn có thể bảo vệ rễ và các phần khác của cây khi tiếp xúc với đất của hạt phát triển từ hạt nảy mầm. Việc xử lý hạt có thể cũng có tác dụng bảo vệ lá bằng cách hoán chuyển hợp chất theo sáng chế hoặc hoạt chất thứ hai trong quá trình phát triển của cây. Phương pháp xử lý hạt có thể được dùng với tất cả các loại hạt, bao gồm hạt của thực vật được biến đổi gen để biểu hiện các tính trạng đặc biệt sẽ nảy mầm. Các ví dụ về các hạt này bao gồm các hạt biểu hiện độc tố protein đối với các loài gây hại không xương sống, như độc tố *Bacillus thuringiensis* hoặc các hạt biểu hiện tính chống chịu thuốc diệt cỏ như glyphosat axetyltransferaza, mà nó tạo ra khả năng kháng glyphosat. Việc xử lý hạt bằng các hợp chất theo sáng chế cũng có thể làm tăng sức sống của thực vật được trồng từ hạt giống này.

Một phương pháp xử lý hạt là phun hoặc rắc bụi lên hạt bằng hợp chất theo sáng chế (có nghĩa là dưới dạng hỗn hợp được bào chế) trước khi gieo hạt. Chế phẩm được bào chế để xử lý hạt thường chứa chất tạo màng hoặc chất bám dính. Do đó, thông thường chế phẩm bao hạt theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và và chất tạo màng hoặc chất bám dính. Hạt có thể được bao bằng cách phun chất cô đặc huyền phù dễ chảy trực tiếp vào trống quay chứa hạt và sau đó sấy khô hạt. Theo cách khác, các loại chế phẩm khác như bột thấm ướt được, dung dịch, nhũ tương hỗn dịch, chất cô đặc nhũ hoá được và nhũ tương trong nước có thể được phun lên hạt. Quy trình này là đặc biệt hữu ích để tạo màng phủ lên hạt. Các máy bao phủ khác nhau và các quy trình có thể được chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này kiếm được dễ dàng. Các quy trình thích hợp bao gồm các quy trình được nêu trong ấn phẩm P. Kosters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph số 57 và các tài liệu tham khảo được nêu trong đó.

Các hợp chất có công thức 1 và các chế phẩm của chúng, một mình hoặc ở dạng kết hợp với các thuốc trừ sâu khác, thuốc diệt giun tròn, và thuốc diệt nấm, là đặc biệt hữu ích cho việc xử lý hạt giống cho các cây trồng bao gồm, nhưng không

chỉ giới hạn ở, bắp hoặc ngô, đậu tương, bông, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và lúa), khoai tây, thực vật và cây cải dầu.

Các thuốc trừ sâu khác có thể được bào chế cùng với các hợp chất có công thức 1 để tạo ra các hỗn hợp hữu ích cho việc xử lý hạt giống bao gồm abamectin, acetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flufenoxuron, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, hexaflumuron, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiocarb, methomyl, methoprene, methoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, triazamate, triflumuron, nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*, toàn bộ chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng virut đa diện nhân.

Các thuốc diệt nấm có thể được bào chế cùng với các hợp chất có công thức 1 để tạo ra các hỗn hợp hữu ích cho việc xử lý hạt giống bao gồm amisulbrom, azoxystrobin, boscalid, carbendazim, carboxin, cymoxanil, cyproconazole, difenoconazole, dimethomorph, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazole, fluopicolide, fluoxastrobin, flutriafol, fluxapyroxad, ipconazole, iprodione, metalaxyl, mefenoxam, metconazole, myclobutanil, paclobutrazole, penflufen, picoxystrobin, prothioconazole, pyraclostrobin, sedaxane, silthiofam, tebuconazole, thiabendazole, thiophanate-methyl, thiram, trifloxystrobin và triticonazole.

Các chế phẩm chứa các hợp chất có công thức 1 hữu ích cho việc xử lý hạt cũng có thể còn chứa vi khuẩn hoặc nấm có khả năng tạo ra sự bảo vệ khỏi các tác dụng có hại của các nấm hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật và/hoặc các động vật sống trong đất như giun tròn. Các vi khuẩn biểu hiện các thuộc tính diệt giun tròn bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn, ở *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillius subtiliis* and *Pasteuria penetrans*. Một chủng *Bacillus firmus* thích hợp là chủng CNCM I-1582 (GB-126) có bán dưới dạng thương phẩm BioNem^{TM}. Một chủng *Bacillus cereus* thích hợp là chủng NCMM I-1592. Cả hai chủng *Bacillus* đều đã được đề cập đến trong patent US 6,406,690. Other suitable bacteria exhibiting nematicidal activity are *B. amyloliquefaciens* IN937a and *B. subtilis* strain GB03. Các vi khuẩn biểu hiện các thuộc tính diệt nấm bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn, ở chủng *B. pumilus* GB34. Các loài nấm biểu hiện các thuộc tính diệt giun tròn bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn, ở *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* và *Purpureocillium lilacinum*.

Việc xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều chất diệt giun tròn có nguồn gốc tự nhiên như chất cảm ứng protein còn được gọi là harpin được phân lập từ các tác nhân gây bệnh vi khuẩn nhất định như *Erwinia amylovora*. Một ví dụ về kỹ thuật xử lý hạt giống Harpin-N-Tek có sẵn như N-Hibit^{TM} Gold CST.

Việc xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều loài vi khuẩn tạo nốt trên rễ họ đậu như vi khuẩn cố định nitơ vi cộng sinh *Bradyrhizobium japonicum*. Các chất chủng này có thể tùy ý bao gồm một hoặc nhiều lipo-chitooligosacarit (LCO), chúng là các yếu tố tạo nốt (Nod) được tạo ra bởi vi khuẩn rhizobia trong quá trình hình thành nốt trên rễ của cây họ đậu. Ví dụ, kỹ thuật xử lý hạt giống mang thương hiệu Optimize® kết hợp với một chất chủng.

Việc xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều isoflavon có khả năng làm tăng mức tạo khuẩn lại trên rễ bởi nấm rễ mycorrhiza. Nấm rễ mycorrhiza cải thiện sự sinh trưởng thực vật bởi việc nâm cao mức độ hấp thu của rễ đối với các dinh dưỡng như nước, sulfat, nitrat, phosphat và kim loại. Các ví dụ về về isoflavon bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, genistein, biochanin A, formononetin, daidzein, glycitein, hesperetin, naringenin và pratensein.

Formononetin là có sẵn trong các sản phẩm chủng in mycorrhiza như PHC Colonize® AG.

Việc xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều tác nhân kích hoạt thực vật gây ra tính kháng hệ thống trên các thực vật sau khi tiếp xúc với tác nhân gây bệnh. Ví dụ về tác nhân kích hoạt thực vật gây ra các cơ chế bảo vệ như vậy là acibenzolar-*S*-metyl.

Hạt đã xử lý thường chứa hợp chất theo sáng chế với lượng nằm trong khoảng từ 0,1g đến 1kg cho 100kg hạt (có nghĩa là nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% trọng lượng của hạt trước khi xử lý). Huyền phù dễ rót được bào chế để xử lý hạt thường chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 70%, chất bám dính tạo màng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 30%, chất phân tán nằm trong khoảng từ 0,5 đến 20%, chất cô đặc nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, bột màu và/hoặc thuốc nhuộm nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, chất chống tạo bọt nằm trong khoảng từ 0 đến 2%, chất bảo quản nằm trong khoảng từ 0 đến 1% và chất pha loãng lỏng dễ bay hơi nằm trong khoảng từ 0 đến 75%.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được kết hợp vào chế phẩm làm mồi để các loài gây hại không xương sống ăn hoặc được sử dụng trong các dụng cụ như bẫy, mồi, và các dụng cụ tương tự. Chế phẩm làm mồi như vậy có thể là dạng hạt bao gồm (a) hoạt chất, cụ thể là lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó; (b) một hoặc một số nguyên liệu thức ăn; tùy ý (c) chất hấp dẫn, và tuỳ ý (d) một hoặc một số chất giữ ẩm. Đáng lưu ý là hạt hoặc chế phẩm làm mồi chứa từ 0,001% đến 5% hoạt chất, từ 40% đến 99% nguyên liệu thức ăn và/hoặc chất hấp dẫn; và tuỳ ý từ 0,05% đến 10% chất giữ ẩm, là hữu hiệu để phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong đất ở các tỷ lệ dùng rất thấp, cụ thể là ở các liều lượng hoạt chất gây chết bằng cách ăn chứ không phải bằng cách tiếp xúc trực tiếp. Một số nguyên liệu thức ăn có thể làm đóng vai trò làm nguồn thức ăn và chất hấp dẫn. Nguyên liệu thức ăn bao gồm carbohyđrat, protein và lipit. Ví dụ về nguyên liệu thức ăn là bột mỳ thực vật, đường, tinh bột, mỡ động vật, dầu thực vật, dịch chiết nấm và chất rắn sữa. Ví dụ về chất hấp dẫn là chất thơm và chất tạo hương, như dịch chiết quả hoặc thực vật, hương thơm,

hoặc các thành phần động vật hoặc thực vật khác, pheromon hoặc các chất khác đã biết để hấp dẫn các loài gây hại không xương sống. Ví dụ về chất giữ ẩm, tức là chất giữ độ ẩm, là glycol và các polyol khác, glyxerin và sorbitol. Đáng lưu ý là chế phẩm làm mồi (và phương pháp sử dụng chế phẩm làm mồi này) được sử dụng để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm kiến, mối và gián. Dụng cụ để phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể bao gồm chế phẩm làm mồi theo sáng chế và hộp phù hợp để chứa chế phẩm làm mồi, trong đó hộp này có ít nhất một lỗ hổng có độ lớn nhất định để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua sao cho loài gây hại không xương sống có thể lấy được chế phẩm làm mồi từ địa điểm bên ngoài hộp, và hộp này còn phù hợp để được đặt trong hoặc gần vị trí vùng hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Theo một phương án, sáng chế đề cập đến phương pháp phòng trừ các loài gây hại không xương sống, bao gồm bước pha loãng chế phẩm phòng trừ loài gây hại theo sáng chế (hợp chất có công thức 1 được bào chế cùng với các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng hoặc hỗn hợp đã được bào chế của hợp chất có công thức 1 và ít nhất một thuốc trừ dịch hại khác) bằng nước, và tùy ý bổ sung chất phù trợ để tạo ra chế phẩm loãng, và cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó với lượng hữu hiệu của chế phẩm loãng này.

Mặc dù chế phẩm phun được tạo ra bởi việc pha loãng bằng nước phần cô có nồng độ thỏa đáng của chế phẩm phòng trừ dịch hại theo sáng chế có thể tạo ra hiệu quả thỏa đáng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống, song các sản phẩm chất phù trợ đã được bào chế riêng cũng có thể được bổ sung vào các hỗn hợp trộn thùng để phun. Các chất phù trợ bổ sung này thường đã biết là "chất phù trợ để phun" hoặc "chất phù trợ trộn thùng", và bao gồm chất bất kỳ được trộn trong thùng để cải thiện tính năng của thuốc trừ dịch hại hoặc làm thay đổi đặc tính vật lý của hỗn hợp phun. Chất phù trợ có thể là các chất hoạt động bề mặt, chất nhũ hóa, dầu cây trồng gốc dầu mỏ, dầu hạt cây trồng, tác nhân axit hóa, chất đệm, chất làm đặc hoặc chất tạo bọt. Chất phù trợ được dùng để nâng cao hiệu quả

(ví dụ, sinh khả dụng, sự bám dính, sự thẩm thấu, tính phủ đều và tính bảo vệ bền lâu), hoặc giảm thiểu hoặc loại trừ các vấn đề khi phun liên quan tới sự không tương hợp, tạo bọt, rửa trôi, bốc hơi, dễ bay hơi và thoái biến. Để tạo ra tính năng tối ưu, chất phù trợ được chọn trên cơ sở các đặc tính của hoạt chất, chế phẩm và đích (ví dụ, cây trồng, côn trùng gây hại).

Nằm trong số các chất phù trợ để phun, các dầu bao gồm các dầu cây trồng, tinh dầu cây trồng, tinh dầu thực vật và tinh dầu hạt đã được metyl hóa được dùng phổ biến nhất để cải thiện hiệu quả của các thuốc trừ dịch hại, có thể là nhờ phương tiện thúc đẩy hơn nữa và làm lắng đọng chế phẩm phun đồng đều. Trong các trường hợp khả năng độc tố có thể sinh ra do các dầu hoặc các chất lỏng không tan trong nước nước khác được lưu ý, thì chế phẩm phun được bào chế từ chế phẩm theo sáng chế nói chung sẽ không chứa chất phù trợ có gốc dầu để phun. Tuy nhiên, trong các trường hợp các trường hợp khả năng độc tố có thể sinh ra do chất phù trợ để phun có gốc dầu là không đáng kể khi áp dụng thương mại, thì các chế phẩm phun được bào chế từ chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa chất phù trợ để phun có gốc dầu, nó có thể tăng cường hơn nữa sự phòng trừ các loài gây hại không xương sống, cũng như tính bền rửa trôi.

Các sản phẩm được nhận diện là "dầu cây trồng" thường gồm 95 tới 98% parafin hoặc dầu mỏ trên cơ sở naphta và 1 tới 2% của một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt có chức năng làm chất nhũ hoá. Các sản phẩm được nhận diện là "tinh dầu cây trồng" thường gồm 80 tới 85% dầu gốc dầu mỏ có thể nhữ hóa được và 15 tới 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Các sản phẩm được nhận diện cụ thể là "tinh dầu thực vật" thường gồm 80 tới 85% dầu thực vật (tức là dầu hạt hoặc quả, đặc biệt nhất là các dầu bông, gai, đậu tương hoặc hoa hướng dương) và 15 tới 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Tính năng chất phù trợ có thể được cải thiện bằng cách thế các dầu thực vật dầu bằng các metyl este của các axit béo thường có nguồn gốc từ dầu thực vật. Các ví dụ tinh dầu hạt đã được metyl hóa bao gồm tinh dầu MSO® (UAP-Loveland Producs, Inc.) và dầu để phun đã được metyl hóa Premium MSO (Helena Chemical Company).

Lượng chất phù trợ được bổ sung vào hỗn hợp phun nói chung sẽ không nhiều hơn khoảng 2,5% thể tích, và phổ biến hơn là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 1% thể tích. Mức áp dụng chất phù trợ để bổ sung vào hỗn hợp phun thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5L trên một hecta. Các ví dụ tiêu biểu về chất phù trợ để phun bao gồm: dầu hạt cải đã được metyl hóa 47% trong hyđrocacbon lỏng Adigor® (Syngenta), heptametyltrisiloxan đã cải biến bằng polyalkylenoxit Silwet® (Helena Chemical Company) và hỗn hợp chất hoạt động bề mặt 17% trong 83% dầu khoáng gốc parafin Assist® (BASF).

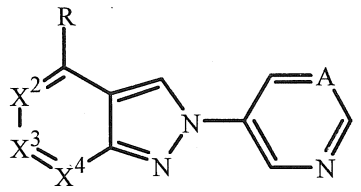
Các hợp chất theo sáng chế có thể được dùng mà không cần các chất bổ trợ khác, nhưng phần lớn các trường hợp là dùng chế phẩm chứa một hoặc một số hoạt chất với chất mang, chất pha loãng, và chất hoạt động bề mặt thích hợp và có thể kết hợp với thức ăn tuỳ thuộc vào mục đích sử dụng cuối cùng. Một phương pháp dùng là phun chất phân tán nước hoặc dung dịch dầu tinh chế chứa hợp chất theo sáng chế. Việc kết hợp với dầu phun, tinh dầu để phun, chất dính phát tán, chất bổ trợ, các dung môi khác, và chất hiệp đồng như piperonyl butoxit thường làm tăng hiệu quả của hợp chất. Đối với các mục đích phi nông nghiệp, việc phun này có thể dùng các dụng cụ chứa như bình, chai hoặc các dụng cụ chứa khác, bằng cách bơm hoặc bằng cách giải phóng nó từ dụng cụ chứa tăng áp, ví dụ, bình phun sol khí tăng áp. Các chế phẩm phun này có thể ở nhiều dạng khác nhau, ví dụ, dạng phun, dạng mù, dạng bọt, dạng khói hoặc dạng sương mù. Do đó, các chế phẩm phun này còn có thể chứa chất đẩy, chất tạo bọt, v.v. khi cần thiết. Đáng lưu ý là chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất mang. Theo một phương án thực hiện, chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất đẩy. Ví dụ về các chất đẩy bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, metan, etan, propan, butan, isobutan, buten, pentan, isopentan, neopentan, penten, hyđroflocacbon, cloflocacbon, đimetyl ete, và hỗn hợp của các chất nêu trên. Đáng lưu ý là chế phẩm phun (và phương pháp sử dụng chế phẩm phun được phân tán từ thùng phun) được sử dụng ở dạng riêng lẻ hoặc kết hợp để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm muỗi, ruồi đen, ruồi chó, ruồi

châu Mỹ, ruồi ngựa, ong bắp cày, ong bắp cày đen và vàng, ve, nhện, kiến, muỗi mắt, và các loài động vật gây hại tương tự.

Các thử nghiệm ở dưới chứng minh hiệu quả phòng trừ của các hợp chất theo sáng chế đối với các loài gây hại cụ thể. Thuật ngữ "hiệu quả phòng trừ" chỉ khả năng ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (kể cả làm chết) dẫn đến việc giảm ăn một cách đáng kể. Tuy nhiên, sự bảo vệ phòng trừ dịch hại được tạo ra bởi các hợp chất là không bị giới hạn chỉ ở các loài này. Xem các Bảng danh mục A-N mô tả cho hợp chất. Xem Bảng danh mục O cho các dữ liệu ^{1}H NMR.

Các chữ viết tắt sau có thể được dùng trong các Bảng danh mục: Cmpd viết tắt cho Hợp chất, *t* viết tắt cho bậc ba, *c* viết tắt cho xyclo, Me viết tắt cho metyl, Et viết tắt cho etyl, Pr viết tắt cho propyl, *i*-Pr viết tắt cho isopropyl, Bu viết tắt cho butyl, *c*-Pr viết tắt cho xyclopropyl, *c*-Pn viết tắt cho xyclopentyl, *c*-Hx viết tắt cho xyclohexyl, *t*-Bu viết tắt cho butyl bậc ba, Ph viết tắt cho phenyl, OMe viết tắt cho metoxy, SMe viết tắt cho metylthio, và SO_2Me viết tắt cho metylsulfonyl. Ký hiệu nét gạch ngang "-" trong công thức cấu trúc thể hiện cho điểm gắn của cấu trúc với phần còn lại của phân tử. Chữ viết tắt "Ex." chỉ "Ví dụ" và sau đó là số chỉ cho ví dụ mà hợp chất hợp chất được điều chế.

Bảng danh mục A

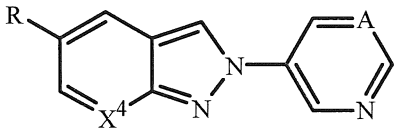


Hợp chất No.	R	X^2	X^3	X^4	A	Dữ liệu NMR/MS
1	-C(O)(1-pyroliđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
2	-C(O)NH(2-pyrimiđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
3	-C(O)(morpholino)	CH	CH	CH	CH	*
4	-C(O)NH(2-pyriđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
5	-C(O)NH(phenyl)	CH	CH	CH	CH	*
6	-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(t-butyl)	CH	CH	CH	CH	*
7	-	CH	CH	CH	CH	*

	C(O)NHCH(Me)C(O)NH(isopropyl)					
8	-C(O)NH(isopropyl)	CH	CH	CH	CH	*
9	-C(O)NHCH$_2$(2-pyriđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
10	-C(O)NHCH$_2$CH(OMe)$_2$	CH	CH	CH	CH	*
11	-C(O)NHCH$_2$(2-thiazolyl)	CH	CH	CH	CH	*
12	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CH	CH	CH	CH	*
13	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SMe	CH	CH	CH	CH	*
14	-C(O)NH(xyclopropyl)	CH	CH	CH	CH	*
15	-C(O)NH(1-piperiđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
16	-C(O)NH(xyclohexyl)	CH	CH	CH	CH	*
17	3-(trifloromethyl)-1-pyrazolyl	CH	CH	CH	CH	*
18	2-pyrimiđinyl	CH	CH	CH	CH	*
19	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CH	CH	CH	CH	*
20	6-(2-pyrimiđinyl)pyriđin-2-yl	CH	CH	CH	CH	*
21	-C(O)NHCH$_2$(2-pyrimiđinyl)	CH	CH	CH	CH	*
22	2-(2-pyriđinyl)thiazol-4-yl	CH	CH	CH	CH	*
23	2-(2-thiazolyl)thiazol-4-yl	CH	CH	CH	CH	*
24	-C(O)NHCH$_2$CHF$_2$	CH	CH	CH	CH	*
300	-C(O)NHCH$_2$(2-pyrimiđinyl)	CH	CH	CH	CF	*
303	1,2,4-oxađiazol-3-yl	CH	CH	CH	CH	*
304	5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	CH	CH	CH	CH	*
305	-C(O)NHCH$_2$(5-metyl-2-pyrazinyl)	CH	CH	CH	CH	*
306	-C(S)NH(xyclohexyl)	CH	CH	CH	CH	*
307	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CH	CH	CH	CF	*
308	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CH	CH	CH	CF	*
309	-C(O)NH(isopropyl)	CH	CH	CH	CF	*
315	2-thiometoxy-4-pyrimiđinyl	CH	CH	CH	CH	*
316	-C(S)NH(isopropyl)	CH	CH	CH	CH	*
500	-C(O)NH(isopropyl)	CF	CH	CH	CH	299
501	-C(O)NH(isopropyl)	CH	CH	CF	CH	299
502	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SMe	CH	CH	CF	CH	331
503	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SMe	CF	CH	CH	CH	331
504	-C(O)NHCH$_2$CH(OMe)$_2$	CH	CH	CH	CF	*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

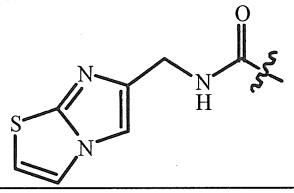
Bảng danh mục B



X^4 là CH

Hợp chất No.	R	A	Dữ liệu NMR/MS

25	-C(O)(1-pyroliđinyl)	CH	*
26	-C(O)NH(2-pyrimiđinyl)	CH	*
27	1-pyrazolyl	CH	*
28	-C(O)NH(2-pyriđinyl)	CH	*
29	-C(O)NH(phenyl)	CH	*
30	-NHC(O)(phenyl)	CH	*
31	-NHC(O)(2-pyriđinyl)	CH	*
32	- (*R*)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(t-butyl)	CH	*
33	-C(O)NMe_2	CH	*
34	-C(O)$NHCH_2CF_3$	CH	*
35	-C(O)NH(isopropyl)	CH	*
36	-C(O)(1-piperiđinyl)	CH	*
37	-C(O)NH(xyclopropyl)	CH	*
38	-C(O)$NHCH_2CH(-OCH_2CH_2O-)$	CH	*
39	-C(O)$NHCH_2CH(OMe)_2$	CH	*
40	-C(O)$NHCH_2$(2-thiazolyl)	CH	*
41	-C(O)$NHCH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CH	*
42	-C(O)$NHNHCO_2Me$	CH	*
43	-C(O)(4-metyl-1-piperazinyl)	CH	*
44	-C(O)(morpholino)	CH	*
45	-C(O)$NHOCH_2CH{=}CH_2$	CH	*
46	-C(O)$NHCH_2CH_2SEt$	CH	*
47	-C(O)$NHOCH_2$(xyclopropyl)	CH	*
48	-C(O)$NHS(O)_2$(4-clorophenyl)	CH	*
49	-C(O)$NHCH_2CN$	CH	*
50	-C(O)$N(-CH_2CH(CF_3)CH_2CH_2CH_2-)$	CH	*
51 (không yêu cầu bảo hộ)	-C(O)$NHCH_2$(2,2-đifloroxyclopropyl)	CH	*
52	-C(O)$NHCH_2CH_2CF_3$	CH	*
53	-C(O)$NHCH_2$(xyclopropyl)	CH	*
54	-C(O)$NHCH_2C(Me)F_2$	CH	*
55	-C(O)$NHCH_2$(2-pyrimiđinyl)	CH	*
56	-C(O)$NHCH_2$(6-brom-2-pyriđinyl)	CH	*
57	-C(O)$NHCH_2CH_2SMe$	CH	*
58	-C(O)$N(CH_2CH_2SMe)(CH_2OEt)$	CH	*
59	-C(O)$NHCH_2CH_2CH_2$(1-imiđazolyl)	CH	*
60	-C(O)$NHCH_2$(2-furanyl)	CH	*
61	-C(O)N(Et)(xyclohexyl)	CH	*
62	-C(O)NH(3.3-đifloroxyclobutyl)	CH	*
63	-C(O)NHCH(isopropyl)CO_2Me	CH	*
64	-C(O)N(Me)CH_2CF_3	CH	*
65	-C(O)$NHCH_2$(2-thienyl)	CH	*
66	-C(O)$N(CH_2CH_2CN)(CH_2$(3-pyriđinyl))	CH	*
67	-C(O)N(Me)(xyclopropyl)	CH	*

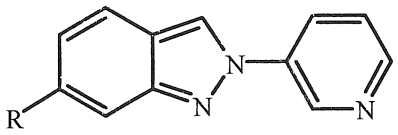
68	-C(O)NHCH(Me)CH_2OMe	CH	*
69	-C(O)N(CH_2CCH)$_2$	CH	*
70	-C(O)NHCH_2CH_2N(isopropyl)$_2$	CH	*
71	-C(O)NHCH_2((3-triflometoxy)phenyl)	CH	*
72	-C(O)N(-CH_2CH_2N(C(O)(xyclopropyl))CH_2CH_2-)	CH	*
73	-C(O)NHCH_2(2,2-đimetyl-1,3-đioxolan-4-yl)	CH	*
74	-C(O)N(-CH=NC(Me)$_2CH_2$-)	CH	*
75	-C(O)(thiomorpholino)	CH	*
76	-C(O)NHCH_2(5-metyl-2-pyrazinyl)	CH	*
131	-C(O)NHCH_2(tetrahyđro-2-furanyl)	CF	*
132	-C(O)NHCH_2C(Me)F_2	CF	*
133	-C(O)NHCH_2CH(OMe)$_2$	CF	*
134		CH	*
320	2-pyrimiđinyl	CH	*
321	2-oxazolyl	CH	*
322	5-(3-pyriđinyl)-1,2,4-oxađiazol-3-yl	CH	*
323	-C(O)NHCH_2CH_2OH	CH	*
324	2-pyrazinyl	CH	*
325	3-pyriđinyl	CH	*
326	2-thiometoxy-4-pyrimiđinyl	CH	*
327	6-clo-2-(SCH_2CO_2Et)-4-pyrimiđinyl	CH	*
328	-C(O)NHCH_2CO_2Me	CH	*
329	-C(O)N(Me)CH_2(2,2-đifloroxyclopropyl)	CH	343
330	-C(O)N(Me)CH_2CH(OMe)$_2$	CH	341
331	-C(O)NHCH_2CH_2OMe	CH	297
332	-C(O)NHCH_2CH_2OEt	CH	311
333	-C(O)NHCH_2CH_2O(isopropyl)	CH	325
334	-C(O)NHCH_2CH(Me)OMe	CH	311
335	-C(O)NH$CH_2CH_2CH_2$OMe	CH	311
336	-C(O)NH(3-metoxyxyclobutyl)	CH	323
338	-C(O)N(-$CH_2CH_2CH_2$-)	CH	279
339	-C(O)NHCH_2CH_2N(Me)$_2$	CH	310
340	1,3,4-oxađiazol-2-yl	CH	*
341	2-(SCH_2CO_2Et)-4-pyrimiđinyl	CH	*
342	-C(O)NHNHCO_2(t-butyl)	CH	*
343	-C(O)NHCH_2CHF_2	CH	303
344	-C(O)NHCH_2CH_2F	CH	285
345	-C(O)N(Me)Et	CH	281
346	-C(O)N(Me)Pr	CH	295

347	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CH	*
348	5-(trifloromethyl)-2-pyriđinyl	CH	*
349	-C(S)NH$_2$	CH	*
350	-C(O)NHMe	CH	253
351	-C(O)NHEt	CH	267
352	-C(O)NHPr	CH	281
353	-C(O)N(-CH$_2$CH$_2$CF$_2$CH$_2$CH$_2$-)	CH	343
354	-C(O)NHBu	CH	295
355	2-thiazolinyl	CH	*
356	-NHC(O)(2-furanyl)	CH	*
357	-NHC(O)CH$_2$SPh	CH	*
358	-NHC(O)(xyclopropyl)	CH	*
359	-NHC(O)CH$_2$Ph	CH	*
360	-NHC(O)CH(Me)Et	CH	*
361	-C(O)NHCH$_2$(5-pyrimiđinyl)	CH	*
362	-NHC(O)CH$_2$CH(Me)$_2$	CH	*
363	-C(O)NHNH(xyclohexyl)	CH	*
364	-C(O)NHCH$_2$(2-pyrimiđinyl)	C(OMe)	*
365	-C(O)NHCH(Me)CF$_3$	CF	*
366	-C(O)NHCH(Me)(xyclopropyl)	CF	*
367	-C(O)NHCH(CH$_2$OMe)$_2$	CF	*
368	-C(O)NHCH(isopropyl)CF$_3$	CF	*
369	-C(O)NHCH$_2$CO$_2$Et	CF	*
370	-C(O)NHCH(Me)CH$_2$OMe	CF	*
371	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$S(t-butyl)	CH	*
372	-C(O)NHCH(Me)Et	CH	*
373	-C(O)NHNHC(O)(2-thienyl)	CH	*
374	-C(O)NHCH$_2$(5-pyrimiđinyl)	CF	*
375	-C(O)NHNHCO$_2$Me	CF	*
376	-C(O)NHNHC(O)(t-butyl)	CH	*
377	-C(O)NHNHC(O)(2-furanyl)	CH	*
378	-C(O)NHNHC(O)phenyl	CH	*
379	-C(O)NHNHC(O)CF$_3$	CH	*
380	-C(O)NHNHCO$_2$Me	N	*
381	-C(O)NHCH(-C(O)SCH$_2$CH$_2$-)	CH	*
382	-C(O)N(-CH$_2$CH$_2$CH$_2$-)	CF	*
383	-C(O)NHCH$_2$(2-benzimiđazol)	CF	*
384	-C(O)NHCH$_2$CH(-CH$_2$N(CO$_2$(t-butyl))CH$_2$CH$_2$CH$_2$-)	CF	*
385	-C(O)NHNHCH$_2$CF$_3$	CH	*
386	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	N	*
387	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	N	*
388	-C(O)NH(xyclopropyl)	N	*
389	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CCl	*
390	-C(O)NH(xyclopropyl)	CCl	*

391	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CCl	*
392	-NHC(O)CH$_2$CF$_3$	CH	*
393	-C(O)NHNH(xyclopropyl)	CH	*
394	-C(O)NHC(Me)$_2$C=CH	CH	*
395	-C(O)NH(xyclobutyl)	CH	*
396	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CBr	*
397	-C(O)NHNHCO$_2$Me	CBr	*
398	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CBr	*
399	-C(O)NH(xyclopropyl)	CBr	*
400	-C(O)NHNHC(O)(3-pyriđinyl)	CH	*
401	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CF	*
402	-C(O)NHC(-CH$_2$CH$_2$-)CO$_2$Me	CH	*
403	-C(O)NHCH(Et)CH$_2$OMe	CH	*
404	-C(O)NHCH$_2$C=CH	CH	*
405	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	C(OMe)	*
406	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	C(OMe)	*
407	-C(O)NH(xyclopropyl)	C(OMe)	*
408	-C(O)NHNHCO$_2$Me	C(OMe)	*
409	-C(O)NHCH$_2$(5-pyrimiđinyl)	N	*
410	-C(O)NH(xyclopropyl)	CF	*
411	-C(O)NHCH(Me)CF$_3$	CH	*
412	-C(O)NHCH(isopropyl)CF$_3$	CH	*
413	-C(O)N(Et)$_2$	CH	*
414	-C(O)NHCH(xyclopropyl)(4-metoxyphenyl)	CH	*
415	-C(O)NHCH(Me)(xyclopropyl)	CH	*
416	-C(O)NHNHC(S)NH(isopropyl)	CH	*
417	-C(O)NHC(Me)$_2$CF$_3$	CH	349
418	-C(O)NHC(-CH$_2$CH$_2$-)CF$_3$	CH	347
419	-C(O)NHCH$_2$(2-pyriđinyl)	CH	330
420	-C(O)NHCH$_2$CH(Cl)CH$_2$CH$_2$CH$_2$Cl	CH	*
421	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	C(SMe)	*
422	2-(SCH$_2$CF$_3$)pyrimiđin-4-yl	CH	*
423	6-(2-pyrimiđinyl)pyriđin-2-yl	CH	*
424	5-(trifloromety1)pyrazin-2-yl	CH	*
425	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SCH$_2$CH$_2$CF$_3$	CH	395
426	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SCH$_2$CF$_3$	CH	381
427	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$S(O)$_2$CH$_2$CH$_2$CF$_3$	CH	427

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

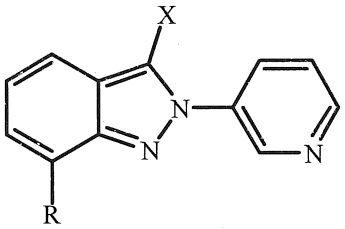
Bảng danh mục C



Hợp chất No.	R	A	Dữ liệu NMR/MS
428	$-C(O)NHCH_2CF_3$	CH	*
429	-C(O)NH(xyclopropyl)	CH	*
430	$-C(O)NHCH_2$(2-pyrimiđinyl)	CH	*
431	$-C(O)NHNHCO_2Me$	CH	*
432	$-C(O)NHCH_2CH_2SMe$	CH	*
433	$-C(O)NHCH_2CH(OMe)_2$	CH	*
434	$-C(O)NHCH(Me)CF_3$	CH	*
435	$-C(O)NHCH_2CHF_2$	CH	*
436	$-C(O)NHCH(CH_2OMe)_2$	CH	*
437	$-C(O)NHCH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	CH	*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

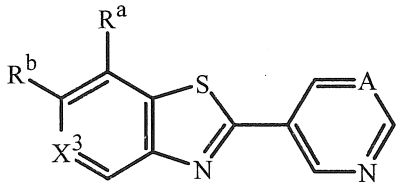
Bảng danh mục D



Hợp chất No.	R	X	Dữ liệu NMR/MS
135	$-C(O)NHNHCO_2Me$	Cl	*
136	$-C(O)NHCH_2CF_3$	Cl	*
137	$-C(O)NHCH_2$(2-pyrimiđinyl)	Cl	*
142	-C(O)NH(xyclopropyl)	H	*
438	$-C(O)NHCH_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	Cl	*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu 1H NMR.

Bảng danh mục E (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)



R^b là H

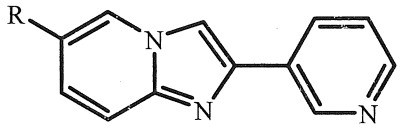
Hợp chất No.	R^a	X^3	A	Dữ liệu NMR/MS
84	-C(O)NHCH$_2$CH$_2$SMe	CH	CH	*

R^a là H

Hợp chất No.	R^b	X^3	A	Dữ liệu NMR/MS
127	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	CH	CF	*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

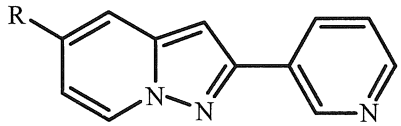
Bảng danh mục J (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)



Hợp chất No.	R	Dữ liệu NMR/MS
457	-C(O)NHCH$_2$CF$_3$	321

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

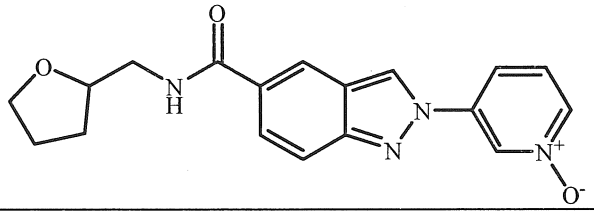
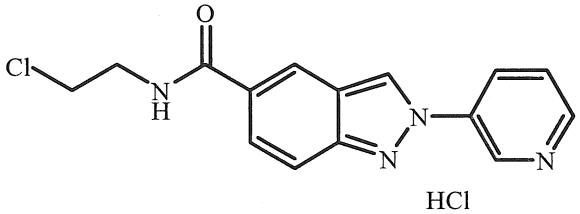
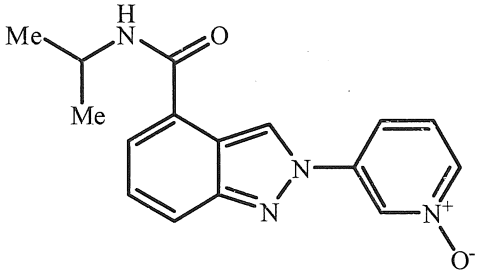
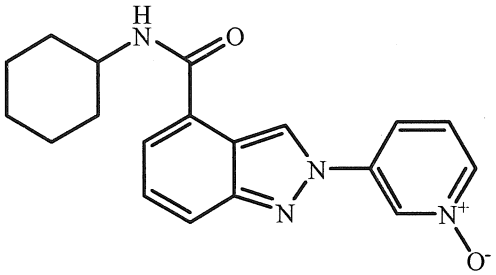
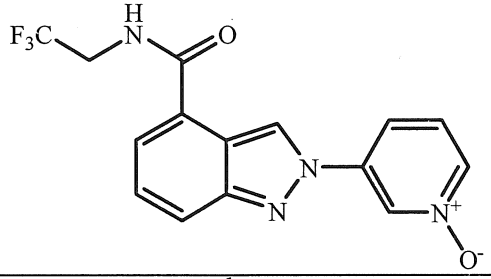
Bảng danh mục M (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)



Hợp chất No.	R	Dữ liệu MS
467	-C(O)NHCH$_2$(tetrahyđro-2-furanyl)	*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

Bảng danh mục N

Hợp chất No.	Cấu trúc	Dữ liệu NMR/MS
462		*
463		*
464		*
465		*
466		*

* Xem Bảng danh mục O cho dữ liệu ^{1}H NMR.

Bảng danh mục O

Hợp chất No.	Dữ liệu ^{1}H NMR [a]
1	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,23 (s, 1H), 8,74 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,66 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,28 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,85 (dt, J=8,7, 0,9 Hz, 1H), 7,47-7,50 (m, 1H), 7,35 (dd, J=8,7, 6,8 Hz, 1H), 7,28-7,30 (m, 1H), 3,75 (br s, 2H), 3,59 (br s, 2H), 1,97-2,04 (br s, 2H), 1,92 (br s, 2H)

2	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,27 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,0 (s, 1H), 8,72 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,05 (d, J=24,1 Hz, 1H, 7,69 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,44 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 7,12 (t, J=4,9 Hz, 1H)
3	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (s, 1H), 8,69 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,25-8,32 (m, 1H), 7,87 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,4, 4,7 Hz, 1H), 7,36 (dd, J=8,8, 6,8 Hz, 1H), 7,17 (d, J=6,8, 1H), 3,72-3,82 (m, 4H)
4	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,28 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,14 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,96-9,00 (m, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J=8,4, 0,9 Hz, 1H), 8,30-8,33 (m, 1H), 8,01 (dd, J=8,7, 0,7 Hz, 1H), 7,80 (dd, J=1,9, 1,1 Hz, 1H), 7,67 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,49-7,52 (m, 1H), 7,42 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 7,08-7,12 (m, 1H)
5	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,27 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,28-8,31 (m, 1H), 8,02-8,06 (br s, 1H), 8,00 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,69 (d, J=8,6, Hz, 2H), 7,57 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,48-7,52 (m, 1H), 7,42 (dd, J=8,5, 7,3 Hz, 3H), 7,21 (t, J=24,1 Hz, 1H)
6	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29-8,34 (m, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 2H), 7,35-7,41 (m, 1H), 7,10-7,16 (m, 1H), 4,55-4,66 (m, 1H), 1,52 (d, J=6,9 Hz, 3H), 1,39 (s, 9H)
7	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,32 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (d, J=9,8 Hz, 1H), 8,51-8,57 (m, 1H), 8,48 (d, J=14,3 Hz, 1H), 7,93 (d, J=14,7 Hz, 1H), 7,79 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,77 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,44 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 4,49-4,58 (m, 1H), 3,83-3,92 (m, 1H), 1,37 (d, J=7,3 Hz, 3H), 1,06-1,10 (m, 6H)
8	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,92 (dt, J=8,5, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,31-7,41 (m, 2H), 6,15 (s, 1H), 4,31-4,41 (m, 1H), 1,33 (d, J=6,6 Hz, 6H)
9	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,27 (d, J=10,1 Hz, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59-8,64 (m, 1H), 8,30-8,35 (m, 1H), 7,96 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,81 (br. s, 1H), 7,72 (t, J=18,8 Hz, 1H), 7,62 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,48-7,52 (m, 1H), 7,40 (dd, J=8,8, 6,9 Hz, 1H), 7,37 (d, J=7,9 Hz, 1H), 4,85 (d, J=4,9 Hz, 2H)
10	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,08 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 7,45 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,37 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,51 (br. s., 1H), 4,55 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,69 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,48 (s, 6H)
11	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,25 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,66 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,30 (d, J=20,3 Hz, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J=3,2 Hz, 1H), 7,54 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,44-7,51 (m, 2H), 7,34 (d, J=3,3 Hz, 2H), 5,03 (d, J=5,5 Hz, 2H)
12	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,26-8,35 (m, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,47 (dd, J=42,1, 6,8 Hz, 2H), 7,37 (dd, J=32,6, 8,7 Hz, 1H), 6,82 (br. s, 1H), 4,09-4,19 (m, 1H), 3,78-3,99 (m, 3H), 3,35-3,46 (m, 1H), 2,03-2,15 (m, 1H), 1,96 (t, J=7,3 Hz, 2H), 1,66 (ddd, J=59,9, 12,3, 8,2 Hz, 1H)
13	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,10 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,26-8,33 (m, 1H), 7,95 (d, J=21,0 Hz, 1H), 7,45-7,54 (m, 2H), 7,37 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,83 (br. s, 1H), 3,75 (dd, J=39,1, 33,7 Hz, 2H), 2,83 (t, J=27,4 Hz, 2H), 2,18 (s, 3H)

14	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,0 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J=18,0 Hz, 1H), 7,50 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,29-7,38 (m, 2H), 6,50 (br. s., 1H), 2,91-3,02 (m, 1H), 0,93 (dd, J=32,8, 27,3 Hz, 2H), 0,69 (d, J=27,7 Hz, 2H)
15	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,27 (d, J=17,5 Hz, 1H), 7,84 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,35 (dd, J=27,1, 19,9 Hz, 1H), 7,15 (d, J=21,8 Hz, 1H), 3,49 (s, 5H), 1,47-1,71 (m, 5H)
16	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,93 (dt, J=8,0, 1,1 Hz, 1H), 7,49 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,33-7,40 (m, 2H), 6,15 (br s, 1H), 4,05 (dd, J=38,3, 8,0 Hz, 1H), 2,10 (dd, J=12,5, 3,5 Hz, 2H), 1,80 (dd, J=26,8, 13,9 Hz, 2H), 1,66-1,74 (m, 1H), 1,48 (dd, J=47,4, 13,6 Hz, 2H), 1,22-1,38 (m, 3H)
17	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,05 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,27-8,35 (m, 1H), 8,13 (dd, J=2,4, 0,9 Hz, 1H), 7,80 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,39 (dd, J=8,7, 7,3 Hz, 1H), 7,22-7,28 (m, 1H), 6,80 (d, J=2,5 Hz, 1H)
18	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,47 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,31 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,90 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,68 (d, J=20,8 Hz, 1H), 8,44 (d, J=19,4 Hz, 1H), 8,35-8,40 (m, 1H), 7,95 (d, J=27,0 Hz, 1H), 7,51 (t, J=16,6 Hz, 2H), 7,23 (t, J=4,8 Hz, 1H)
19	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,28 (d, J=19,9 Hz, 1H), 9,06 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,65-8,75 (m, 1H), 8,25-8,35 (m, 1H), 8,02 (d, J=27,4 Hz, 1H), 7,45-7,56 (m, 2H), 7,36-7,44 (m, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,16-4,28 (m, 2H)
20	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 10,44 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,43 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,02 (d, J=4,7 Hz, 2H), 8,67 (d, J=12,0 Hz, 1H), 8,50-8,53 (m, 1H), 8,48 (dd, J=7,7, 0,8 Hz, 1H), 8,09 (d, J=7,4 Hz, 1H), 8,00 (t, J=21,4 Hz, 1H), 8,01 (d, J=18,0 Hz, 1H), 7,76 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,50-7,55 (m, 1H), 7,44-7,49 (m, 1H), 7,39 (t, J=16,9 Hz, 1H)
21	^{1}H NMR (DMSO-d_6) d: 9,39 (d, J=0,8 Hz, 1H), 9,36 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,14 (t, J=5,9 Hz, 1H), 8,79 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50-8,57 (m, 1H), 7,96 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,80 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,47 (dd, J=8,8, 6,9 Hz, 1H), 7,41 (t, J=4,9 Hz, 1H), 4,76 (d, J=6,0 Hz, 2H)
22	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26-9,33 (m, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,62-8,76 (m, 2H), 8,40 (d, J=19,7 Hz, 1H), 8,32 (d, J=18,9 Hz, 1H), 7,90 (t, J=28,4 Hz, 1H), 7,77-7,85 (m, J=32,5 Hz, 2H), 7,65 (d, J=18,1 Hz, 1H), 7,50-7,59 (m, 1H), 7,45 (t, J=27,3 Hz, 1H), 7,37-7,41 (m, 1H)
23	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,27 (d, J=10,6 Hz, 1H), 9,23 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,66-8,72 (m, 2H), 8,39 (d, J=19,4 Hz, 1H), 8,33 (d, J=7,7 Hz, 1H), 7,89 (dd, J=13,6, 1,4 Hz, 1H), 7,83 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,51-7,56 (m, 1H), 7,45 (dd, J=15,8, 1,7 Hz, 1H), 7,36-7,41 (m, 1H)
24	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,41 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,26 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,51-8,58 (m, 1H), 8,24 (br s, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,74 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,43 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,01-6,31 (m, J=112,9 Hz, 1H), 3,80-3,96 (m, 2H),
25	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,79 (d, J=21,8 Hz, 1H), 7,48-7,54 (m, 2H), 3,69 (t, J=6,8 Hz, 2H), 3,52 (t, J=6,3 Hz, 2H), 1,95-2,03 (t, J=6,2 Hz, 2H), 1,91 (t, J=6,5 Hz, 2H)

26	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,72 (dd, J=9,8, 1,0 Hz, 1H), 8,69 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,29-8,34 (m, 1H), 7,88 (d, J=1,3 Hz, 2H), 7,51-7,56 (m, 1H), 7,08 (t, J=4,8 Hz, 1H)
27	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,69 (d, J=4,1 Hz, 1H), 8,51 (s, 1H), 8,30 (d, J=22,1 Hz, 1H), 7,97 (d, J=1,7 Hz, 2H), 7,89 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,78-7,82 (m, 1H), 7,78-7,82 (m, 2H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,50 (t, J=9,1 Hz, 1H)
28	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,23 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,44 (t, J=1,3 Hz, 1H), 8,42 (d, J=10,9 Hz, 1H), 8,31-8,34 (m, 2H), 7,88-7,90 (m, 2H), 7,75-7,83 (m, 1H), 7,50-7,58 (m, 1H), 7,10 (ddd, J=7,3, 4,9, 1,0 Hz, 1H)
29	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,29-8,35 (m, 1H), 7,88 (d, J=0,8 Hz, 2H), 7,81 (d, J=15,9 Hz, 1H), 7,68 (d, J=18,1 Hz, 2H), 7,54 (dd, J=18,8, 8,4 Hz, 1H), 7,41 (t, J=8,4 Hz, 3H), 7,18 (t, J=20,3 Hz, 2H)
30	^{1}H NMR (DMSO-d_6) d: 9,32 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,14 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,64 (d, J=7,7 Hz, 1H), 8,44-8,50 (m, 1H), 8,16 (d, J=11,5 Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,95 (d, J=10,4 Hz, 1H), 7,82 (t, J=24,7 Hz, 1H), 7,72 (d, J=10,7 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 2H), 7,51 (d, J=20,2 Hz, 1H), 7,28 (d, J=13,9 Hz, 1H)
31	^{1}H NMR (DMSO-d_6) d: 9,32 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,29-9,31 (m, 1H), 9,28-9,31 (m, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,63 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,50 (m, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,68 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 7,34-7,42 (m, 1H), 7,12 (br. s, 2H)
32	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 2H), 7,35-7,41 (m, 1H), 7,10-7,16 (m, 1H), 4,55-4,66 (m, 1H), 1,52 (d, J=6,9 Hz, 3H), 1,39 (s, 9H)
33	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=12,0 Hz, 1H), 8,53 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,33 (m, 1H), 7,85-7,88 (m, 1H), 7,81 (d, J=15,6 Hz, 1H), 7,50-7,55 (m, 1H), 7,40 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,03-3,23 (m, 6H)
34	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,32 (dd, J=1,7, 1,0 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,85 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,51-7,55 (m, 1H), 6,47 (br s, 1H), 4,12-4,26 (m, 2H)
35	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=3,6 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,81 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,69 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,49-7,56 (m, 1H), 5,98 (br s, 1H), 4,26-4,44 (m, 1H), 1,31 (d, J=6,6 Hz, 6H)
36	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,83 (dd, J=9,6, 3,3 Hz, 1H), 7,79-7,82 (m, 1H), 7,52 (dd, J=19,7, 4,1 Hz, 1H), 7,37 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,45-3,74 (m, 5H), 1,51-1,70 (m, 5H)
37	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,68 (d, J=17,7 Hz, 1H), 8,47-8,52 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,84 (d, J=13,4 Hz, 1H), 7,74 (d, J=11,7 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 1H), 2,93-3,00 (m, 1H), 0,71-0,80 (m, 2H), 0,61-0,68 (m, 2H)
38	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,47-8,52 (m, 1H), 8,44 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,88 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,61-7,67 (m, 1H), 5,06 (s, 1H), 3,98-4,01 (m, 1H), (m, 2H), 2,8 (br s, 4H)
39	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,28 (dd, J=1,7, 1,0 Hz, 1H), 7,82 (dt, J=9,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,50-7,54 (m, 1H), 6,40-6,45 (m, 1H), 4,54 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,66 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,47 (s, 6H)

40	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,61 (br s, 1H), 8,50-8,52 (m, 1H), 8,49 (dd, J=2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (d, J=3,3 Hz, 1H), 7,62-7,66 (m, 1H), 7,51 (d, J=3,2 Hz, 1H), 4,92 (d, J=6,0 Hz, 2H)
41	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,28-8,30 (m, 2H), 7,82 (d, J=12,6 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,61 (br s, 1H), 3,92 (dt, J=8,4, 6,7 Hz, 1H), 3,77-3,89 (m, 2H), 3,33-3,44 (m, 1H), 2,05 (d, J=43,0 Hz, 1H), 1,90-2,01 (m, 2H), 1,72-1,79 (m, 1H), 1,60-1,71 (m, 1H)
42	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,60 (s, 1H), 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,20 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,69 (d, J=11,5 Hz, 1H), 8,48-8,52 (m, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,26 (br s, 1H), 7,87 (d, J=16,6 Hz, 1H), 7,81 (d, J=16,6 Hz, 1H), 7,62-7,67 (m, 1H), 3,70 (s, 3H)
43	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,84-7,87 (m, 1H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,38 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,66 (br s, 4H), 2,46 (br. s, 4H), 2,35 (s, 3H)
44	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,82 (dt, J=8,9, 0,9 Hz, 1H), 7,47-7,55 (m, 1H), 7,37 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,84 (br s, 4H)
45	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,58 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,25 (s, 1H), 7,83 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,64 (dd, J=9,1, 1,5 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,0, 4,7 Hz, 1H), 6,02-6,14 (m, 1H), 5,35-5,48 (m, 2H), 4,57 (d, J=6,3 Hz, 2H)
46	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=2,6, 1,5 Hz, 2H), 7,82 (d, J=15,8 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 6,71 (br s, 1H), 3,65-3,76 (m, 2H), 2,84 (t, J=18,4 Hz, 2H), 2,62 (q, J=7,4 Hz, 2H), 1,31 (t, J=7,4 Hz, 3H)
47	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,17 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,79 (br s, 1H), 8,69 (d, J=18,1 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,26-8,31 (m, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,81 (d, J=13,2 Hz, 1H), 7,66 (d, J=21,6 Hz, 1H), 7,49-7,53 (m, 1H), 4,28-4,38 (m, 1H), 1,35 (d, J=6,3 Hz, 6H)
48	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,32 (s, 1H), 9,07-9,17 (m, 1H), 8,64-8,70 (m, 1H), 8,55-8,61 (m, 1H), 8,41-8,50 (m, 1H), 8,13 (d, J=8,5 Hz, 3H), 7,88 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,73 (d, J=9,8 Hz, 1H), 7,59-7,67 (m, 3H)
49	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70-8,75 (m, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,36 (m, 2H), 7,86 (d, J=12,9 Hz, 1H), 7,69 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52-7,54 (m, 1H), 6,46 (s, 1H), 4,45 (d, J=5,7 Hz, 2H)
50	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,79-7,88 (m, 2H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,35 (dd, J=8,9, 1,5 Hz, 1H), 4,00-4,18 (m, 1H), 2,93-3,10 (m, 2H), 2,30-2,44 (m, 1H), 2,10-2,19 (m, 1H), 1,80-1,92 (m, 1H), 1,71-1,80 (m, 1H), 1,51-1,71 (m, 1H), 0,90-1,04 (m, 1H)
51 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,2 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 2H), 7,83 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,46 (br s, 1H), 3,89-4,05 (m, 1H), 3,27-3,38 (m, 1H), 1,95-2,08 (m, 1H), 1,69 (s, 3H), 1,46-1,59 (m, 1H), 1,16-1,31 (m, 2H)
52	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,69 (d, J=1,6 Hz, 1H), 7,49-7,57 (m, 1H), 6,48 (br s, 1H), 3,78 (q, J=6,3 Hz, 2H), 2,44-2,59 (m, 2H)

53	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19 (br s, 1H), 8,69 (d, J=4,1 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,25-8,31 (m, 2H), 7,81 (d, J=18,4 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,51 (dd, J=8,1, 4,7 Hz, 1H), 6,41 (br s, 1H), 3,36 (dd, J=7,1, 5,4 Hz, 2H), 1,05-1,17 (m, 1H), 0,58 (d, J=26,2 Hz, 2H), 0,31 (d, J=22,4 Hz, 2H)
54	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,46-8,52 (m, 2H), 8,13 (br s, 1H), 7,90 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 1H), 3,83-3,95 (m, 2H), 1,68 (t, J=18,8 Hz, 3H)
55	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=4,7 Hz, 1H), 9,20 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,78 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,69 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,48-8,54 (m, 2H), 8,24 (br s, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,81 (d, J=11,3 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,38 (t, J=4,9 Hz, 2H), 4,84 (d, J=5,5 Hz, 3H)
56	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,60 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,35 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,84 (d, J=23,0 Hz, 1H), 7,79 (d, J=12,5 Hz, 1H), 7,57 (t, J=17,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 1H), 7,43 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,32-7,39 (m, 2H), 4,78 (d, J=5,4 Hz, 2H)
57	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,35 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,54 (m, 1H), 8,37-8,43 (m, 1H), 7,93 (br s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=18,6 Hz, 1H), 7,59-7,68 (m, 1H), 3,60-3,69 (m, 2H), 2,73-2,79 (m, 2H), 2,14-2,16 (m, 3H)
58	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (d, J=3,5 Hz, 1H), 8,54 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,30 (d, J=9,5 Hz, 1H), 7,96 (br s, 1H), 7,82 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,5 Hz, 2H), 4,77 (br s, 2H), 3,80 (br s, 2H), 3,38 (br s, 2H), 2,87 (br s, 2H), 2,17-2,31 (m, 2H), 1,21 (br s, 1H)
59	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,46-8,51 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,76 (dt, J=9,1, 1,0 Hz, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 7,17 (t, J=1,3 Hz, 1H), 6,93 (t, J=1,0 Hz, 1H), 4,18 (t, J=6,9 Hz, 2H), 3,47 (dd, J=19,2, 5,8 Hz, 2H), 2,14 (t, J=6,9 Hz, 2H)
60	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 2H), 7,82 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=1,8, 0,9 Hz, 1H), 6,49 (br s, 1H), 6,36 (ddd, J=14,0, 3,2, 1,3 Hz, 2H), 4,69 (d, J=5,4 Hz, 2H)
61	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,6, 1,0 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,26-8,33 (m, 1H), 7,80 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,50 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,31 (dd, J=8,9, 1,3 Hz, 1H), 4,03-4,18 (m, 1H), 3,98-4,24 (m, 1H), 3,47 (br s, 3H), 2,15 (br s, 1H), 1,77 (br s, 4H), 1,47-1,69 (m, 4H), 1,21-1,36 (m, J=7,1 Hz, 3H), 1,05 (br s, 3H), 0,93 (s, 1H)
62	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,10-8,15 (m, 1H), 7,84 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 7,53 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 4,59 (t, J=12,1 Hz, 4H)
63	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,26-8,35 (m, 2H), 7,83 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,75 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,45-7,58 (m, 1H), 4,83 (dd, J=8,7, 4,9 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,48 (q, J=6,9 Hz, 6H), 2,32 (d, J=5,0 Hz, 1H)

64	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,84 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,48-7,57 (m, 1H), 7,39 (d, J=8,7 Hz, 1H), 3,20 (s, 3H), 1,60 (s, 2H), 1,55-1,68 (m, 2H)
65	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 2H), 7,82 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,27 (d, J=16,9 Hz, 3H), 7,09 (dd, J=3,5, 1,1 Hz, 1H), 7,00 (dd, J=5,2, 3,5 Hz, 1H), 6,47 (br s, 1H), 4,80-4,97 (m, 2H)
66	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,61 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,8 Hz, 2H), 8,26-8,31 (m, 1H), 7,92-7,97 (m, 1H), 7,85 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,56-7,64 (m, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,43 (dd, J=9,0, 1,3 Hz, 1H), 7,34 (d, J=4,7 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,68 (s, 1H), 2,80 (br s, 2H), 1,74 (br s, 2H)
67	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 3H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,77 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,52 (s, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,83-2,96 (m, 1H), 0,46-0,74 (m, 4H)
68	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,45 (d, J=7,6 Hz, 1H), 4,36-4,49 (m, 1H), 3,45-3,60 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,34 (d, J=6,8 Hz, 3H)
69	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 8,03-8,09 (m, 1H), 7,85 (dt, J=9,0, 0,9 Hz, 1H), 7,49-7,57 (m, 2H), 4,40 (br s, 4H), 2,33-2,45 (m, 2H), 1,65 (br s, 1H), 1,61-1,71 (m, 2H)
70	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,25-8,41 (m, 2H), 7,81 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,69-7,78 (m, 1H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 3,52 (br s, 1H), 3,14 (br s, 1H), 2,79 (br s, 2H), 1,63-1,91 (m, 2H), 1,11 (br s, 8H)
71	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,32 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,28-8,31 (m, J=5,7 Hz, 1H), 7,83 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=7,4, 1,6 Hz, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,37-7,44 (m, J=8,0 Hz, 1H), 7,34 (d, J=7,7 Hz, 1H), 7,24 (s, 1H), 7,17 (d, J=8,2 Hz, 1H), 6,55 (br s, 1H)
72	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,84 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49-7,56 (m, 1H), 7,38 (d, J=7,4 Hz, 1H), 3,53-3,96 (m, 8H), 1,70-1,79 (m, 1H), 1,03 (dd, J=4,7, 2,9 Hz, 2H), 0,82 (dd, J=7,6, 2,9 Hz, 2H)
73	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (d, J=3,5 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 2H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,50-7,56 (m, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,32-4,51 (m, 1H), 4,05-4,19 (m, 1H), 3,68-3,89 (m, 2H), 3,51-3,62 (m, 1H), 1,32-1,72 (m, 9H)
74	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,06 (t, J=1,2 Hz, 1H), 7,88 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,52-7,54 (m, 1H), 7,47 (br s, 1H), 3,71 (s, 2H), 1,70-1,87 (m, 1H), 1,41 (s, 6H)
75	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,83 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,49-7,56 (m, 1H), 7,34 (d, J=10,6 Hz, 1H), 3,53-4,15 (m, 4H), 2,44-3,03 (m, 4H)

76	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,58-8,62 (m, 2H), 8,43 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,36 (t, J=1,3 Hz, 1H), 8,27-8,33 (m, 1H), 7,83 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,78 (d, J=7,6 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,29-7,40 (m, 1H), 4,82 (d, J=5,0 Hz, 2H), 2,59 (s, 3H),
84 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,39 (d, J=1,7 Hz, 1H), 8,74 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,40-8,47 (dt, 1H), 8,26 (dd, J=8,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=7,6, 0,9 Hz, 1H), 7,58-7,64 (t, 1H), 7,47 (dd, J=7,2, 5,0 Hz, 1H), 6,94 (br t, 1H), 3,75-3,82 (q, 2H), 2,80-2,88 (t, 2H), 2,18 (s, 3H)
127 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,13 (br s, 1H), 8,64 (br s, 1H), 8,49 (d, J=1,7 Hz, 1H), 8,14-8,20 (m, 2H), 7,92 (dd, J=8,5, 1,7 Hz, 1H), 6,43 (br t, J=6,6 Hz, 1H), 4,20 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
129	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,49 (s, 1H), 9,19 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,80 (d, J=4,7 Hz, 2H), 8,73 (s, 1H), 8,60-8,67 (m, 1H), 8,19 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,84 (br s, 1H), 7,29-7,36 (m, J=9,6 Hz, 1H), 5,00 (d, J=4,3 Hz, 2H)
131	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,03 (s, 1H), 8,60 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,56 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,13 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,73 (d, J=7,6 Hz, 1H), 6,64 (br s, 1H), 4,06-4,22 (m, 1H), 3,92 (dt, J=8,3, 6,7 Hz, 1H), 3,76-3,88 (m, 2H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,6 Hz, 1H), 2,03-2,13 (m, 1H), 1,91-2,00 (m, 2H), 1,81 (br s, 1H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,1 Hz, 1H)
132	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,03 (d, J=1,9 Hz, 1H), 8,61 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,57 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,27-8,32 (m, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,11-8,16 (m, 1H), 7,82 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J=7,3, 1,7 Hz, 1H), 6,50 (br s, 1H), 3,92 (td, J=13,7, 6,3 Hz, 2H), 1,66-1,79 (m, 3H), 1,71 (t, J=18,6 Hz, 4H)
133	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,03 (s, 1H), 8,60 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,56 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,13 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,50 (t, J=5,3 Hz, 1H), 4,54 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,66 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,47 (s, 6H)
134	^{1}H NMR (DMSO-d_6) d: 9,41 (d, J=0,8 Hz, 1H), 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,66-8,72 (m, 1H), 8,50-8,57 (m, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,85 (d, J=4,4 Hz, 2H), 7,78 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,65 (s, 2H), 7,21 (d, J=4,4 Hz, 1H), 4,49 (d, J=5,5 Hz, 2H)
135	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 10,24 (br s, 1H), 9,13 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,86 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (br. s, 1H), 8,29-8,39 (m, 2H), 8,00 (dd, J=8,4, 1,0 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J=8,2, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,45 (t, J=7,5 Hz, 1H), 3,69 (br s, 3H)
136	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,25 (br s, 1H), 9,11 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,86 (d, J=5,4 Hz, 1H), 8,29-8,39 (m, 2H), 7,99 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,77 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,46 (t, J=7,8 Hz, 1H), 4,36 (qd, J=9,5, 6,5 Hz, 2H)
137	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 10,06 (br s, 1H), 9,34 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,76-8,88 (m, 3H), 8,44-8,55 (m, 1H), 8,30 (dd, J=6,9, 1,1 Hz, 1H), 7,94 (dd, J=8,5, 1,1 Hz, 1H), 7,79 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,41 (s, 1H), 4,93 (d, J=4,7 Hz, 2H)
142	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,14 (br s, 1H), 8,73 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,35 (d, J=7,1 Hz, 1H), 8,20 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,88 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,56 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,30 (t, J=7,7 Hz, 1H), 3,08 (td, J=7,3, 3,5 Hz, 1H), 0,87-1,01 (m, 2H), 0,65-0,80 (m, 2H), 0,01 (br s, 1H), -0,01 (br s, 1H)
303	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,31 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,13 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,83 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,26-8,46 (m, 1H), 8,09 (dd, J=6,9, 0,8 Hz, 1H), 7,99 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,38-7,59 (m, 2H),

304	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,33 (s, 1H), 9,29 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,69 (d, J=4,7 Hz, 1H), 8,35 (dd, J=8,4, 1,6 Hz, 1H), 8,05 (s, 2H), 7,94 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,71 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,44-7,61 (m, 2H)
305	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,27 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,08-9,14 (m, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,21-8,38 (m, 1H), 7,97 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,45-7,59 (m, 2H), 7,40 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 2H), 4,85 (d, J=5,0 Hz, 3H) 2,53-2,67 (s, 3H)
306	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,08 (br s, 1H), 8,41 (br s, 1H), 7,85 (d, J=7,6 Hz, 3H), 7,58 (br s, 2H), 7,34 (br s, 1H), 6,94 (br s, 2H), 4,64 (br s, 1H), 3,56-3,74 (m, 3H), 2,25 (br s, 2H), 1,80 (br s, 2H), 1,73 (s, 1H), 1,70 (s, 1H), 1,50 (s, 1H), 1,40 (br s, 1H)
307	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,05-9,15 (m, 2H), 8,56 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,90-8,06 (m, 1H), 7,49 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,50 (br s, 1H), 4,21 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
308	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,04-9,15 (m, 2H), 8,54 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,92 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,46 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,38 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,69 (br s, 1H), 4,13 (qd, J=7,2, 3,2 Hz, 1H), 3,76-3,96 (m, 3H), 3,40 (ddd, J=13,8, 7,7, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,18 (m, 1H), 1,90-2,02 (m, 2H), 1,51-1,71 (m, 2H)
309	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,13 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,54 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,92 (ddd, J=7,2, 2,3, 0,9 Hz, 1H), 7,32-7,43 (m, 2H), 6,08 (d, J=6,5 Hz, 1H), 4,36 (dt, J=7,7, 6,6 Hz, 1H), 1,33 (d, J=6,5 Hz, 5H)
315	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,61 (br s, 1H), 9,38 (d, J=6,1 Hz, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,46-8,56 (m, 2H), 8,28 (br. S, 1H), 7,80-7,97 (m, 2H), 7,66 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H)
316	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,10 (br s, 1H), 8,40 (br s, 1H), 7,75 (br s, 2H), 7,58 (br s, 1H), 7,31 (d, J=9,3 Hz, 1H), 6,94 (br s, 1H), 1,77 (br s, 1H), 1,08 (br s, 2H), 0,84 (br s, 2H)
320	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,38 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,18 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,95-9,07 (m, 1H), 8,89 (d, J=5,1 Hz, 2H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,9 Hz, 2H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,37 (t, J=4,8 Hz, 1H)
321	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,37 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,18 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,44-8,57 (m, 2H), 8,02-8,09 (m, 1H), 7,77-7,96 (m, 1H), 7,65 (dd, J=8,4, 4,7 Hz, 1H), 7,32 (d, J=0,8 Hz, 1H)
322	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,49 (d, J=2,0 Hz, 1H), 9,24 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,87 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,66-8,74 (m, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,52 (dt, J=8,0, 1,9 Hz, 1H), 8,23-8,42 (m, 1H), 8,13 (dd, J=9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,40-7,57 (m, 2H)
323	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,15 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,40-8,46 (m, 1H), 7,88 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 2H), 7,76 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 3,72 (t, J=5,6 Hz, 2H), 3,55 (q, J=5,7 Hz, 2H)
324	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,10 (s, 1H), 8,45 (s, 2H), 8,09-8,15 (m, 3H), 7,75-7,85 (m, 3H), 7,62 (t, J=7,7 Hz, 3H), 7,49 (t, J=7,5 Hz, 2H)
325	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (s, 1H), 8,93 (dd, J=7,1 Hz, 1H), 8,69 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,62 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,32 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,89-7,97 (m, 3H), 7,60 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,40 (ddd, J=7,9, 4,8, 0,9 Hz, 1H)

326	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,77 (dd, J=1,7, 0,9 Hz, 1H), 8,69 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,63 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,21 (dd, J=5,0 Hz, 1H), 7,87 (dt, J=9,3, 0,9 Hz, 1H), 7,75 (d, J=5,5 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 2,65 (s, 3H)
327	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=6,3 Hz, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,78-8,85 (m, 1H), 8,69 (dd, J=7,5 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,18 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,82-7,92 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 4,16-4,28 (m, 2H), 4,12 (s, 2H), 1,22-1,31 (m, 3H)
328	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,11-8,19 (m, 1H), 7,88 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,64 (t, J=6,8 Hz, 1H), 4,18 (d, J=6,0 Hz, 2H), 3,70-3,74 (m, 3H)
340	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,38 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 8,65-8,84 (m, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,38-8,56 (m, 1H), 8,05 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,94 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,67 (dd, J=8,3, 4,7 Hz, 1H)
341	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,76 (dd, J=1,7, 0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,62 (d, J=5,4 Hz, 1H), 8,51 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 8,19 (dd, J=9,2, 1,7 Hz, 1H), 7,86 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,77 (d, J=5,4 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 4,14-4,26 (m, 1H), 4,20 (d, J=7,1 Hz, 2H), 4,10 (s, 2H), 1,20-1,27 (m, 3H)
342	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,43-8,59 (m, 2H), 7,86 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,58-7,72 (m, 1H) 2,01-2,09 (m, 10H)
347	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,38 (br s, 2H), 9,17 (br s, 1H), 8,70 (br s, 1H), 8,54 (d, J=8,0 Hz, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,4 Hz, 2H), 7,76-7,90 (m, 2H), 7,61-7,76 (m, 3H), 6,97-7,16 (m, 2H), 6,75-6,97 (m, 3H), 4,32 (qd, J=7,0, 4,5 Hz, 1H), 3,98-4,19 (m, 2H), 3,70-3,91 (m, 2H), 1,82-2,00 (m, 3H), 1,73 (ddt, 3H)
348	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,70 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,23-8,41 (m, 1H), 7,96-8,12 (m, 2H), 7,85-7,96 (m, 2H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,26 (s, 1H)
349	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9,34 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,13 (d, J=6,9 Hz, 1H), 8,64 (d, J=5,3 Hz, 1H), 8,46-8,55 (m, 1H), 8,17 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=8,7, 1,0 Hz, 1H), 7,60-7,67 (m, 2H), 1,60 (s, 3H)
355	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,1 Hz, 1H), 7,80-7,91 (m, 1H), 7,76 (dd, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,11 (br. s, 1H), 4,43-4,50 (m, 2H), 4,23-4,35 (m, 2H), 3,41 (t, J=8,4 Hz, 2H)
356	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,47 (br s, 1H), 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,65 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,41-8,54 (m, 2H), 7,78 (s, 1H), 7,72 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,59-7,67 (m, 2H), 7,24 (d, J=3,5 Hz, 1H), 6,67 (dd, J=2,1 Hz, 1H)
357	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,43 (br s, 1H), 9,32 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,93 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,64 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,34 (d, J=1,3 Hz, 1H), 7,67 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,59-7,63 (m, 1H), 7,49 (d, J=7,4 Hz, 2H), 7,29-7,39 (m, 3H), 7,06-7,28 (m, 1H), 3,88 (s, 2H)
358	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,44 (br s, 1H), 9,32 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,89 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,63 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,44 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,66 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,58-7,62 (m, 1H), 7,38 (dd, J=9,3, 1,9 Hz, 1H), 1,79 (tt, J=7,9, 4,6 Hz, 1H), 0,86-0,99 (m, 2H), 0,73-0,86 (m, 2H)

359	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,14-9,21 (m, 1H), 9,15 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,64 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,30-8,45 (m, 1H), 8,18-8,28 (m, 1H), 7,66 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,32-7,50 (m, 6H), 7,17-7,23 (m, 1H), 6,90-7,02 (m, 1H), 3,78 (s, 2H)
360	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,33 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,11 (br s, 1H), 8,91 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,63 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41-8,53 (m, 1H), 7,59-7,77 (m, 2H), 7,37 (dd, J=8,6 Hz, 1H), 2,44 (dd, J=14,1, 6,9 Hz, 1H), 1,75 (dt, J=13,4, 7,8 Hz, 1H), 1,47 (ddd, J=13,4, 7,4, 6,0 Hz, 1H), 1,18 (d, J=6,8 Hz, 2H), 0,94 (t, J=7,4 Hz, 2H)
361	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,13 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71-8,91 (m, 2H), 8,61 (s, 1H), 8,55 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,85 (s, 2H), 4,96 (d, J=4,6 Hz, 2H)
362	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,13 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71-8,91 (m, 2H), 8,61 (s, 1H), 8,55 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,85 (s, 2H), 4,96 (d, J=4,6 Hz, 2H)
363	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,69 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,78-7,94 (m, 2H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,8 Hz, 1H), 7,37 (d, J=8,4 Hz, 1H), 3,95-4,49 (m, 2H), 3,41-3,93 (m, 1H), 1,67-1,97 (m, 6H), 1,11 (br s, 3H)
364	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,74-8,82 (m, 2H), 8,62 (s, 1H), 8,35-8,48 (m, 1H), 7,83-7,94 (m, 2H), 7,59-7,67 (m, 1H), 7,25-7,29 (m, 3H), 4,96 (d, J=4,4 Hz, 2H), 4,00 (s, 2H)
365	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,24-9,27 (m, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,38 (d, J=10,0 Hz, 1H), 8,07-8,18 (m, 1H), 7,89 (dd, J=5,0 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 5,02 (d, J=8,5 Hz, 1H), 1,48 (d, J=7,1 Hz, 3H)
366	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,26 (br s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (br s, 1H), 8,34-8,44 (m, 2H), 7,88 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66-7,81 (m, 2H), 3,56-3,77 (m, 1H), 2,82 (d, J=16,7 Hz, 1H), 1,33 (d, J=6,5 Hz, 3H), 1,05 (d, J=6,1 Hz, 1H), 0,51 (br s, 1H), 0,37-0,48 (m, 2H), 0,28 (br s, 1H)
367	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,25 (s, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,39 (s, J=7,1, 7,1 Hz, 2H), 7,85 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,75 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49-7,60 (m, 1H), 4,38-4,51 (m, 1H), 3,48-3,62 (m, 4H), 3,34 (s, 6H),
368	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,26 (s, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,38 (d, J=9,4 Hz, 1H), 8,01 (d, J=9,6 Hz, 1H), 7,89 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=8,9 Hz, 1H), 4,82 (ddd, J=9,8, 8,9, 6,5 Hz, 1H), 2,25-2,36 (m, 1H), 1,12 (d, J=6,6 Hz, 6H),
369	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,28 (s, 1H), 9,25 (d, J=9,5 Hz, 1H), 8,63 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,39 (d, J=9,5 Hz, 1H), 8,11-8,19 (m, 1H), 7,89 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 4,15-4,20 (m, 4H), 2,79-2,84 (m, 1H), 1,26 (t, J=7,1 Hz, 3H)
370	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,26 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,32-8,43 (m, 2H), 7,87 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,75 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,49-7,59 (m, 1H), 4,29-4,44 (m, 1H), 3,52 (dd, J=9,3, 5,7 Hz, 1H), 3,40 (dd, J=9,5, 5,8 Hz, 1H), 3,34 (s, 3H), 1,26 (d, J=6,8 Hz, 3H)
371	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (s, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,99 (br s, 1H), 7,86 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,77 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 3,54-3,62 (m, 2H), 2,78-2,86 (m, 3H), 1,31-1,38 (m, 9H),
372	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (dd, J=2,9, 0,7 Hz, 1H), 9,14 (d, J=1,0 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (ddd, J=8,3, 2,9, 1,6 Hz, 1H), 8,37-8,40 (m, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,8 Hz, 1H), 7,75 (dt, J=9,1, 1,3 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (d, J=7,0 Hz, 1H), 4,05-4,15 (m, 1H), 1,55-1,70 (m, 2H), 1,24 (d, J=6,6 Hz, 3H), 0,97 (t, J=7,4 Hz, 3H)

373	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,78 (br s, 1H), 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,2 Hz, 1H), 8,43-8,61 (m, 2H), 7,86-7,99 (m, 2H), 7,74-7,85 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,3, 4,7 Hz, 1H), 7,21 (t, J=4,2 Hz, 1H)
374	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,04 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 8,35 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,29 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,08-8,20 (m, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,40-7,50 (m, 1H), 7,37 (d, J=9,3 Hz, 1H), 6,97 (t, J=4,8 Hz, 1H), 4,26 (d, J=5,8 Hz, 2H)
375	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,28 (s, 2H), 8,64 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,40 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,86 (d, J=1,4 Hz, 1H), 7,78-7,84 (m, 1H), 3,70 (s, 3H)
376	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=2,5 Hz, 2H), 9,20 (s, 2H), 8,85 (br. s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,40-8,58 (m, 3H), 7,87 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (dd, J=8,2, 4,9 Hz, 1H), 1,29 (s, 10H)
377	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,68 (br. s, 1H), 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,44-8,61 (m, 2H), 7,86-8,07 (m, 1H), 7,74-7,86 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,4, 4,3 Hz, 1H), 7,23 (d, J=3,3 Hz, 1H), 6,66 (dd, J=3,3, 1,6 Hz, 1H)
378	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,74 (br. s, 1H), 9,38 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,61 (m, 2H), 8,02 (d, J=7,3 Hz, 2H), 7,92 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,57-7,73 (m, 2H), 7,53 (t, J=7,2 Hz, 2H)
379	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,96-9,03 (m, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,45-8,59 (m, 1H), 8,36-8,43 (m, 1H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,78 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,65 (dd, J=8,3, 4,5 Hz, 1H)
380	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,55 (s, J=8,1 Hz, 2H), 9,34 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,60-8,66 (m, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,74-7,88 (m, 1H), 3,93 (s, 3H)
381	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,38-8,57 (m, 2H), 8,02 (d, J=8,4 Hz, 1H), 7,87 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,79 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 5,00 (ddd, J=12,9, 8,2, 7,0 Hz, 1H), 3,56 (ddd, J=12,0, 11,2, 5,4 Hz, 1H), 3,39 (ddd, J=11,2, 7,0, 1,0 Hz, 1H), 2,73 (dddd, J=12,3, 6,9, 5,4, 1,4 Hz, 1H), 2,29-2,48 (m, 1H)
382	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,97-9,11 (m, 1H), 8,52-8,63 (m, 2H), 8,13 (dt, J=9,0, 2,4 Hz, 1H), 8,00-8,09 (m, 1H), 7,78 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,63 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,26 (s, 2H), 4,38 (br s, 2H), 4,28 (br s, 2H), 2,39 (t, J=7,7 Hz, 2H)
383	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9,49 (s, 1H), 9,31 (s, 2H), 8,73 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,46-8,62 (m, 2H), 7,91 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,42-7,59 (m, 2H), 7,10-7,18 (m, 2H), 4,74 (d, J=3,6 Hz, 2H)
384	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,24-9,29 (m, 1H), 9,22 (d, J=1,0 Hz, 1H), 8,62 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,38 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,93-8,05 (m, 1H), 7,85-7,93 (m, 1H), 7,76 (d, J=9,1 Hz, 1H), 3,39-3,59 (m, 4H), 3,22-3,34 (m, 1H), 3,07-3,15 (m, 1H), 2,51-2,66 (m, 1H), 1,66-1,82 (m, 1H), 1,43 (s, 8H)
385	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,60 (br s, 1H), 9,36 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,21 (d, J=15,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,8 Hz, 1H), 8,49-8,52 (m, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=8,9 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 5,49 (d, J=4,4 Hz, 1H), 3,59-3,75 (m, 2H),
386	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,36-9,38 (m, 2H), 9,28 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 7,82 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,75 (d, J=9,2 Hz, 1H), 6,65 (br s, 1H), 4,12 (dd, J=7,3, 3,1 Hz, 1H), 3,78-3,95 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,7, 7,7, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,21 (m, 2H), 1,88-2,02 (m, 2H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,1 Hz, 1H)

387	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,35-9,39 (m, 2H), 9,27-9,33 (m, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,23-8,43 (m, 1H), 7,87 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,74 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,40 (br s, 1H), 4,19 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
388	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,37 (s, 2H), 9,29 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,68 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,30 (br s, 1H), 2,96 (dd, J=7,0, 3,9 Hz, 1H), 0,80-1,01 (m, 3H), 0,62-0,79 (m, 2H)
389	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,08 (s, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,80 (dt, J=10,2 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=8,9 Hz, 1H), 6,61 (br s, 1H), 4,03-4,19 (m, 2H), 3,78-3,95 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,13 (m, 2H), 1,83-2,02 (m, 3H),
390	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,32 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,21 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,59 (t, J=2,2 Hz, 1H), 8,33-8,41 (m, 1H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,60-7,79 (m, 2H), 2,72-2,85 (m, 10H), 2,13-2,20 (m, 1H), 0,70-0,81 (m, 2H), 0,49-0,69 (m, 2H)
391	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,08 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,59-8,75 (m, 2H), 8,48-8,59 (m, 1H), 8,38 (t, J=2,2 Hz, 1H), 7,97 (dd, J=9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 3,97 (s, 2H)
392	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,55-8,74 (m, 1H), 8,43 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,17-8,32 (m, 1H), 7,77 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,40 (br s, 1H), 7,13 (d, J=9,0 Hz, 1H), 3,30 (q, J=10,5 Hz, 2H)
393	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,62-8,79 (m, 1H), 8,47-8,62 (m, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,81 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 7,43 (br s, 1H), 0,98-1,17 (m, 1H), 0,42-0,63 (m, 2H), 0,19 (br s, 2H)
394	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=3,9 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,24-8,36 (m, 2H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,69 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,0, 4,7 Hz, 1H), 6,28 (br s, 1H), 2,42 (s, 1H), 1,81 (s, 6H)
395	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,67-8,85 (m, 2H), 8,57 (s, 1H), 8,22-8,44 (m, 2H), 7,76-7,93 (m, J=9,1 Hz, 1H), 7,61-7,75 (m, J=9,0 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,7 Hz, 2H), 6,27 (d, J=6,6 Hz, 2H), 4,60-4,72 (m, 1H), 2,43-2,55 (m, 2H), 1,91-2,08 (m, 2H), 1,68-1,90 (m, 2H)
396	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,12 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,46-8,64 (m, 2H), 8,27 (s, 1H), 7,80 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,73 (d, J=8,9 Hz, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,11 (dd, J=7,2, 3,1 Hz, 1H), 3,77-3,98 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,6 Hz, 1H), 2,01-2,21 (m, 1H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,60-1,78 (m, 1H)
397	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,32 (s, 1H), 8,75-8,83 (m, 2H), 8,56-8,65 (m, 1H), 7,93 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 3,92 (s, 3H)
398	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,12 (d, J=1,9 Hz, 1H), 8,76 (d, J=1,6 Hz, 1H), 8,61 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,53 (t, J=2,2 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,80-7,93 (m, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 4,19 (dd, J=9,1, 6,4 Hz, 2H)
399	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,11 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,46-8,61 (m, 2H), 8,12-8,31 (m, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 6,26 (br. S, 1H), 2,95 (d, J=3,2 Hz, 1H), 0,91 (d, J=5,7 Hz, 2H), 0,61-0,77 (m, 2H)
400	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,92-10,04 (m, 1H), 9,81-9,92 (m, 1H), 9,37 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,20-9,26 (m, 1H), 9,03-9,20 (m, 1H), 8,78 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,62 (m, 2H), 8,32 (d, J=7,9 Hz, 1H), 7,87-7,99 (m, 1H), 7,83 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,61-7,74 (m, 1H), 7,55 (s, 1H)

401	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,25 (s, 1H), 9,23-9,28 (m, 1H), 9,21-9,32 (m, 1H), 8,63 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,48 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,31-8,44 (m, 1H), 7,90 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 4,23 (q, J=9,5 Hz, 1H), 4,22 (q, J=9,5 Hz, 2H)
402	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (br s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,61-8,83 (m, 1H), 8,51 (d, J=7,7 Hz, 1H), 8,42 (s, 1H), 8,35 (br s, 1H), 7,87 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,66 (t, J=7,1 Hz, 1H), 3,65 (s, 3H) 1,45-1,59 (m, 2H), 1,19-1,35 (m, 2H)
403	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,83 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,72 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 6,36-6,45 (m, 1H), 4,18-4,31 (m, 1H), 3,55 (dd, J=9,9, 3,5 Hz, 2H), 3,41 (s, 3H), 1,65-1,81 (m, 2H), 1,02 (t, J=7,5 Hz, 3H)
404	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,51-8,64 (m, 1H), 8,28-8,36 (m, 2H), 7,84 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 6,31 (br s, 1H), 4,31 (dd, J=5,1, 2,6 Hz, 2H)
405	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,60 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,40 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,81-7,92 (m, 2H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 4,19 (dd, J=9,1, 6,4 Hz, 2H), 4,00 (s, 3H)
406	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,74 (s, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,38 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,80 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,73 (d, J=9,0 Hz, 1H), 6,66 (br s, 1H), 4,05-4,19 (m, 1H), 3,91-4,00 (m, 4H), 3,78-3,87 (m, 2H), 3,38 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,8 Hz, 1H), 2,01-2,12 (m, 2H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,3 Hz, 1H)
407	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,39 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,24 (d, J=0,9 Hz, 1H), 7,87 (t, J=2,4 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 6,28 (br s, 1H), 3,99 (s, 3H), 2,95 (dd, J=6,9, 3,8 Hz, 1H), 0,91 (d, J=5,7 Hz, 2H), 0,56-0,75 (m, 2H)
408	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,75 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,40 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,34 (s, 1H), 7,79-7,98 (m, 2H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,83 (s, 3H)
409	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,38 (s, 2H), 9,30 (s, 1H), 8,78 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,64 (s, 1H), 8,43 (s, 2H), 7,87 (d, J=1,1 Hz, 2H), 7,64 (br. S, 1H), 4,97 (d, J=4,4 Hz, 2H)
410	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,26 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,34-8,42 (m, 2H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 2H), 7,74 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 2H), 2,89-3,06 (m, 1H), 0,70-0,81 (m, 2H), 0,58-0,69 (m, 2H)
411	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (br s, 1H), 8,71 (d, J=4,3 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,25-8,35 (m, 2H), 7,84 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,27 (s, 1H), 6,25 (d, J=9,5 Hz, 1H), 4,92-5,08 (m, 1H), 1,47 (d, J=7,1 Hz, 3H)
412	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,72 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 2H), 7,87 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,22 (s, 1H), 4,84 (ddd, J=10,2, 8,5, 4,7 Hz, 1H) 1,10 (dd, J=9,3, 7,1 Hz, 6H)
413	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,68 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,78-7,82 (m, 2H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,35 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,28 (s, 1H), 3,48 (q, J=7,1 Hz, 5H), 1,21-1,36 (m, 5H)

414	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19 (s, 1H), 9,20 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,69 (dt, J=4,7, 1,7 Hz, 1H), 8,56 (dd, J=6,9, 0,8 Hz, 1H), 8,24-8,34 (m, 2H), 7,77-7,89 (m, 1H), 7,62-7,77 (m, 1H), 7,46-7,58 (m, 1H), 7,41-7,43 (m, 1H), 7,40 (d, J=7,8 Hz, 1H), 7,33 (d, J=7,7 Hz, 1H), 6,87-6,96 (m, 2H), 6,52 (d, J=7,7 Hz, 1H), 5,17 (d, J=7,7 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,48 (q, J=7,1 Hz, 1H), 1,24-1,47 (m, 2H), 0,67 (d, J=8,7 Hz, 2H)
415	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,25-8,33 (m, 2H), 7,82 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,16 (d, J=7,6 Hz, 1H), 3,60-3,72 (m, 1H), 1,35 (d, J=6,6 Hz, 3H), 0,87-1,05 (m, 1H), 0,42-0,62 (m, 3H), 0,34 (dt, J=9,8, 4,7 Hz, 1H)
416	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,18-9,31 (m, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,36-8,56 (m, 3H), 7,88 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 2H), 4,63 (d, J=6,6 Hz, 1H), 1,19 (d, J=6,6 Hz, 6H)
420	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,25-8,35 (m, 2H), 7,84 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,72 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 6,64 (br s, 1H), 4,15-4,27 (m, 1H), 4,05 (ddd, J=14,2, 6,8, 3,5 Hz, 1H), 3,52-3,66 (m, 3H), 2,02-2,17 (m, 2H), 1,87-2,02 (m, 2H)
421	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,88 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,50-8,59 (m, 2H), 8,23-8,33 (m, 1H), 8,17 (t, J=2,2 Hz, 1H), 7,81 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H) 6,59 (br s, 1H), 4,03-4,19 (m, 1H), 3,77-3,95 (m, 3H), 3,38 (ddd, J=13,7, 7,6, 4,7 Hz, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,01-2,17 (m, 1H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,56-1,74 (m, 3H)
422	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (s, 1H), 8,71 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,55-8,64 (m, 3H), 8,32 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 8,03 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,90 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,45-7,57 (m, 2H), 4,09 (q, J=9,9 Hz, 2H)
423	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,23 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,98 (d, J=5,2 Hz, 2H), 8,62-8,75 (m, 1H), 8,56 (d, J=8,0 Hz, 2H), 8,44 (d, J=6,9 Hz, 1H), 8,26-8,38 (m, 1H), 8,16 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,84-8,01 (m, 3H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,35 (t, J=4,8 Hz, 1H)
424	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19-9,27 (m, 8H), 8,90-9,09 (m, 5H), 8,72 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 5H), 8,64 (d, J=6,4 Hz, 4H), 8,49-8,58 (m, 4H), 8,33 (ddd, J=8,2, 2,6, 1,4 Hz, 6H), 8,10 (dd, J=9,2, 1,7 Hz, 5H), 7,96 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 5H), 7,54 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 5H)
428	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,10 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,42-8,56 (m, 2H), 8,38 (d, J=1,3 Hz, 1H), 7,90 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 1H), 7,63-7,71 (m, 2H), 5,63 (s, 1H), 4,25 (qd, J=9,6, 6,5 Hz, 2H)
429	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,34 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,3 Hz, 1H), 8,48 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,24 (d, J=1,1 Hz, 1H), 7,83 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 2H), 7,58-7,65 (m, 2H), 2,99 (d, J=3,9 Hz, 1H), 0,72-0,93 (m, 3H), 0,53-0,72 (m, 2H)
430	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,22 (s, 1H), 8,77 (d, J=5,1 Hz, 2H), 8,70 (d, J=4,6 Hz, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,31 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,82 (dd, J=17,3 Hz, 1H), 7,73-7,76 (m, 1H), 7,70 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,22-7,32 (m, 1H), 4,97 (d, J=4,4 Hz, 2H)
431	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=7,1 Hz, 1H), 8,52 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,12-8,34 (m, 2H), 7,82 (d, J=8,7 Hz, 2H), 7,49-7,61 (m, 2H), 3,83 (s, 3H)
432	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,68 (d, J=4,9 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,30 (s, 1H), 8,02 (br s, 1H), 7,85 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,59-7,69 (m, 2H), 3,62-3,69 (m, 2H), 2,74-2,83 (m, 3H), 2,16 (s, 3H)

433	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,85 (dd, J=8,7, 0,9 Hz, 2H), 7,62-7,67 (m, 2H), 4,61 (t, J=5,5 Hz, 1H), 3,55 (t, J=5,8 Hz, 2H), 3,38-3,40 (m, 6H)
434	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,18 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,88 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,63-7,68 (m, 2H), 4,96-5,14 (m, 1H), 1,51 (d, J=7,1 Hz, 3H)
435	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=7,1 Hz, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,50 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,31-8,41 (m, 1H), 8,25 (br s, 1H), 7,88 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,63-7,69 (m, 2H), 6,14 (t, J=4,3 Hz, 1H), 3,84 (tdd, 2H)
436	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,36 (d, J=7,1 Hz, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,50 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,31-8,41 (m, 1H), 8,25 (br s, 1H), 7,88 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,63-7,69 (m, 2H), 6,14 (t, J=4,3 Hz, 1H), 3,84 (tdd, 2H)
437	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,35 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,48 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,85 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 2H), 7,56-7,74 (m, 2H), 4,08 (dd, J=6,6, 5,2 Hz, 1H), 3,86 (ddd, J=8,1, 7,2, 6,1 Hz, 1H), 3,69 (td, J=7,7, 6,5 Hz, 1H), 3,40-3,58 (m, 2H), 2,00-2,08 (m, 5H), 1,83-1,94 (m, 2H), 1,70 (dd, J=12,1, 8,7 Hz, 1H)
438	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,04-9,20 (m, 2H), 8,79 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,36 (dd, J=7,1, 1,1 Hz, 1H), 8,16 (ddd, J=8,2, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,79 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 1H), 7,57 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,33 (dd, J=8,4, 7,0 Hz, 1H), 4,15 (dd, J=6,4, 3,9 Hz, 1H), 3,72-3,91 (m, 3H), 3,62 (dt, J=13,9, 6,0 Hz, 1H), 1,95-2,11 (m, 1H), 1,84-1,95 (m, 2H), 1,69 (dd, J=12,2, 8,7 Hz, 2H)
462	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9,41 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,10 (t, J=1,7 Hz, 1H), 8,62 (t, J=5,8 Hz, 1H), 8,35-8,40 (m, 1H), 8,31 (ddd, J=6,5, 1,6, 0,8 Hz, 1H), 8,11 (ddd, J=8,5, 1,9, 0,8 Hz, 1H), 7,82 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,76 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,64 (dd, J=8,5, 6,5 Hz, 1H), 4,01 (t, J=6,3 Hz, 1H), 3,80 (ddd, J=8,1, 7,1, 6,1 Hz, 1H), 3,58-3,70 (m, 1H), 3,28-3,39 (m, 3H), 1,78-1,97 (m, 3H), 1,57-1,67 (m, 1H)
463	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9,49 (s, 1H), 9,46 (s, 1H), 8,88 (t, J=5,5 Hz, 1H), 8,76 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,70-8,74 (m, 1H), 8,43 (s, 1H), 7,78-7,86 (m, 3H), 3,72-3,83 (m, 2H), 3,62 (q, J=6,2 Hz, 2H)
464	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,08 (s, 1H), 9,00 (t, J=1,7 Hz, 1H), 8,12-8,28 (m, 1H), 7,85-8,06 (m, 1H), 7,80 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=8,4, 6,5 Hz, 1H), 7,31-7,36 (m, 1H), 6,48 (br s, 1H), 2,96 (dd, J=7,1, 3,9 Hz, 1H), 0,84-0,99 (m, 2H), 0,61-0,76 (m, 2H)
465	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,99-9,09 (m, 3H), 8,21 (d, J=6,6 Hz, 2H), 7,84-7,96 (m, 2H), 7,80 (dt, J=8,4, 0,9 Hz, 2H), 7,30-7,47 (m, 5H), 6,17 (d, J=7,7 Hz, 2H), 3,98-4,19 (m, 2H), 2,09 (dd, J=12,5, 3,2 Hz, 4H), 1,80 (dt, J=13,8, 3,7 Hz, 4H), 1,69 (dt, J=13,0, 3,7 Hz, 2H), 1,41-1,55 (m, 4H), 1,23-1,36 (m, 5H)
466	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 8,91-9,08 (m, 2H), 8,23 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 2H), 7,81 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 2H), 7,34-7,56 (m, 4H), 6,61 (br s, 1H), 4,16-4,36 (m, 2H)
467 (đối chứng, không yêu cầu bảo hộ)	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ: 9,19 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,26 (dt, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,60 (br s, 1H), 4,10 (qd, 1H), 3,93 (dt, 1H), 3,89-3,76 (m, 2H), 3,38-3,29 (m, 1H), 2,11-2,02 (m, 1H), 2,00-1,83 (m, 3H)
504	^{1}H NMR (axeton-d_6) δ: 9,29-9,35 (m, 2H), 8,62 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,46 (d, J=9,8 Hz, 1H), 7,89 (d, J=8,8 Hz, 2H), 7,68 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,42 (dd, J=7,5 Hz, 1H), 4,62 (t, J=5,5 Hz, 1H), 3,57 (t, J=5,8 Hz, 2H), 3,39 (s, 6H)

[a] Dữ liệu ^{1}H NMR được tính theo ppm tính theo tetrametylsilan. Các liên hợp được ký hiệu bằng (s)-vạch đơn, (d)-vạch đôi, (t)-là vạch ba, (m)-vạch bội, (dd)-hai vạch đôi, (dt)-hai vạch ba, (br)-rộng.

Các thử nghiệm sinh học

Pha chế và phương pháp phun đối với các thử nghiệm A-F

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế trong dung dịch chứa 10% axeton, 90% nước và 300ppm chất hoạt động bề mặt không ion X-77^{TM} Spreader Lo-Foam chứa alkylarylpolyoxyetylen, axit béo tự do, glycol và 2-propanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Các hợp chất pha chế này được phun với lượng 1ml dung dịch bằng máy phun SUJ2 với vòi phun ở 1/8 JJ có thân máy tuỳ chỉnh (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) được đặt ở vị trí 1,27cm (0,5 insơ) bên trên mỗi mẫu thử nghiệm. Các hợp chất thử nghiệm được phun với nồng độ đã được chỉ ra và mỗi thử nghiệm được lặp lại ba lần.

Thử nghiệm A

Để đánh giá mức độ phòng trừ sâu của bướm đêm (*Plutella xylostella (*L.*)*), dụng cụ thử nghiệm là thùng có miệng nhỏ có cây củ cải từ 12-14 ngày tuổi đặt bên trong thùng. Các nhóm cây này được gây nhiễm bệnh từ trước bằng khoảng 50 ấu trùng được đưa vào mẫu thử nghiệm nhờ bột yến mạch ngô bằng cách sử dụng dụng cụ cấy kiểu bazoka. Ấu trùng được chuyển lên cây thử nghiệm sau khi được đưa vào mẫu thử nghiệm.

Các hợp chất thử nghiệm được phun với nồng độ 250ppm và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm, mỗi mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và trước khi đậy nắp lưới màu đen lên trên. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 25°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó, mức độ phá hại cho cây trồng được đánh giá bằng cách quan sát bằng mắt thường dựa trên số lá đã bị ăn, và sâu non được đánh giá về tỷ lệ tử vong.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau có mức độ hiệu quả phòng trừ tuyệt vời (mức độ gây tổn thương

cây là bằng hoặc dưới 40% và/hoặc tỷ lệ tử vong là 100%): 309, 501, 502, 344, 431 và 466.

Thử nghiệm B

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ bọ nhảy hại lá khoai tây (*Empoasca fabae* Harris) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây đậu Soleil từ 5 đến 6 ngày tuổi (mới nhú lá mầm). Cát trắng được phủ lên lớp đất, và một trong số các lá mầm được ngắt ra trước khi phun.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250 ppm và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun các hợp chất thử nghiệm đã được pha chế, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ trước khi chúng được gây nhiễm bằng 5 con bọ nhảy hại lá khoai tây (các con trưởng thành từ 18 đến 21 ngày tuổi). Lưới chụp màu đen được chụp lên trên thùng chứa. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 24°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt về tỷ lệ tử vong của côn trùng.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 80%: 21, 131, 133, 300, 309, 366, 367, 368, 370, 375, 380, 382, 386, 387, 388, 409 và 466.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 80%: 309, 375, 380, 382, 386, 387 và 388.

Thử nghiệm C

Để đánh giá mức độ phòng trừ rệp vừng đào xanh (*Myzus persicae*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây củ cải từ 12 đến 15 ngày tuổi. Các cây này được gây nhiễm bệnh từ trước bằng cách đưa lên lá của cây thử nghiệm từ 30 đến 40 rệp cây ở miếng lá được cắt ra từ cây (phương pháp cắt lá). Các con rệp được

đưa lên cây thử nghiệm khi miếng lá khô. Sau khi làm nhiễm bệnh từ trước, đất chứa trong mẫu thử nghiệm được phủ bằng một lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250 ppm và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun hợp chất đã được pha chế, mỗi mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và sau đó đậy nắp lưới màu đen lên trên. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 19 đến 21°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 50 đến 70%. Sau đó, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về tỷ lệ côn trùng chết.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 1, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 44, 46, 49, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 60, 61, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 72, 73, 74, 75, 76, 131, 132, 133, 300, 301, 308, 309, 320, 321, 322, 323, 324, 326, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 338, 340, 341, 342, 343, 344, 345, 346, 348, 350, 351, 352, 353, 354, 363, 364, 366, 370, 372, 374, 375, 376, 377, 378, 380, 381, 382, 387, 388, 393, 400, 401, 402, 403, 404, 409, 410, 411, 412, 413, 415, 416, 419, 462, 463, 464, 500, 501, 502 và 503.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 80%: 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 16, 17, 18, 19, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 46, 49, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 60, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 73, 75, 76, 131, 132, 133, 300, 308, 309, 320, 322, 323, 324, 325, 326, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 338, 340, 342, 343, 344, 345, 346, 348, 350, 351, 352, 353, 354, 366, 374, 375, 376, 378, 380, 382, 387, 388, 401, 402, 403, 404, 409, 410, 411, 412, 413, 415, 419, 462, 463, 464, 500, 501, 502 và 503.

Thử nghiệm D

Để đánh giá mức độ phòng trừ rệp vừng bông dưa (Aphis gossypii) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, dụng cụ thử nghiệm là thùng chứa nhỏ để hở chứa bên trong cây bông từ 6 đến 7 ngày tuổi. Các cây này được gây nhiễm

bệnh từ trước bằng từ 30 đến 40 côn trùng lên miếng lá theo phương pháp cắt lá được mô tả trong thử nghiệm C, và đất trong mẫu thử nghiệm này được phủ một lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250 ppm và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 19°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về tỷ lệ côn trùng chết.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 6, 7, 8, 11, 12, 14, 16, 19, 21, 24, 25, 37, 39, 40, 41, 52, 54, 55, 58, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 131, 133, 309, 323, 336, 342, 345, 348, 350, 351, 353, 366, 401, 403, 412, 419, 462, 464, 500, 501 và 503.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 80%: 6, 8, 14, 16, 19, 21, 24, 39, 41, 42, 52, 54, 55, 58, 67, 76, 131, 133, 323, 348, 351, 401 và 403.

Thử nghiệm E

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ bọ trĩ hại hoa miền Tây (*Frankliniella occidentalis*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây đậu Soleil từ 5 đến 7 ngày tuổi.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250 và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ, cho từ 22 đến 27 con bọ trĩ trưởng thành vào mỗi mẫu và sau đó đậy nắp lưới màu đen lên trên và các mẫu thử nghiệm được giữ trong 7 ngày ở 25°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 45 đến 55%.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có mức độ hiệu quả phòng trừ tuyệt vời (gây tổn thương thực vật bằng hoặc dưới 30% và/hoặc tỷ lệ tử vong là 100%): 13, 64, 68, 70, 72, 131, 132, 133, 314, 340, 348, 367, 409, 410, 415, 464 và 504.

Thử nghiệm F

Để đánh giá mức độ phòng trừ ruồi trắng hại khoai tây bột (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây bông từ 12 đến 14 ngày tuổi. Trước khi phun, cả hai lá mầm được ngắt ra khỏi cây, chỉ để lại một lá cho thử nghiệm. Ruồi trắng trưởng thành được để đẻ trứng trên cây và sau đó được gỡ ra khỏi mẫu. Cây bông đã được gây nhiễm bệnh bằng ít nhất 15 trứng được dùng cho thử nghiệm phun.

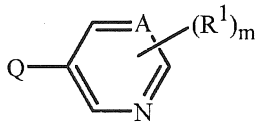
Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250 và/hoặc 50 ppm. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ. Các ống hình trụ được bỏ ra, và các mẫu thử nghiệm được giữ trong 13 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 28°C và độ ẩm tương đối 50-70%. Sau đó, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về tỷ lệ côn trùng chết.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 50%: 8, 42, 58, 63, 64, 68, 72, 321, 324, 326, 330, 334, 339, 340, 348, 349, 360, 366, 368, 402, 403, 412 và 463.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, hợp chất sau dẫn đến tỷ lệ tử vong ít nhất là 50%: 326.

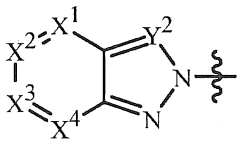
YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất được chọn trong số các hợp chất công thức (1), N-oxit hoặc muối của nó,



1

trong đó Q là:



;

Q-2

A là CH, CR^1 hoặc N;

mỗi R^1 độc lập là halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, C_1-C_4 alkylthio hoặc C_1-C_4 haloalkylthio;

m bằng 0, 1, 2 hoặc 3;

X^1 là CR^2, và mỗi X^2, X^3 và X^4 độc lập là CR^3; hoặc X^2 là CR^2, và mỗi X^1, X^3 và X^4 độc lập là CR^3;

R^2 là $C(=Z)NR^6R^7$, $N(R^8)C(=Z)R^9$, $C(=NR^{10})R^{11}$ hoặc Q^a;

mỗi Z độc lập là O hoặc S;

mỗi R^3 độc lập là H, halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy hoặc C_1-C_4 haloalkoxy; Y^2 là CR^{5a};

R^{5a} là H, halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy hoặc C_1-C_4 haloalkoxy;

R^6 là H, $NR^{15}R^{16}$, OR^{17}, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R^7 là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc

R^6 và R cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 10 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng tối đa 4 R^x; hoặc

R^6 và R^7 cùng nhau là $=S(O)_pR^{18}R^{19}$ hoặc $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy, C_3-C_6 xycloalkoxy, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $OC(O)R^{22}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$ $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$, $Si(R^{28})_3$, $OSi(R^{28})_3$ hoặc Q^b;

R^8 là H, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R^9 là H, $C(=NR^{10})R^{11}$, OR^{21} hoặc $NR^{15}R^{16}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc phenyl, phenoxy hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc vòng không thơm dị vòng có 3 tơi 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó

tối đa 1 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; mỗi R^{10} độc lập là OR^{12}, $S(O)_nR^{13}$ hoặc NHR^{14};

mỗi R^{11} độc lập là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗinhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy, C_3-C_6 xycloalkoxy, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$, $C(O)R^{22}$ hoặc Q^b;

mỗi R^{12} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{13}$ hoặc Q^b; mỗi R^{13} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{14} là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$ hoặc $C(O)OR^{21}$; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{15} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{27}$ hoặc $S(O)_2R^{27}$; hoặc phenyl hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{16} độc lập là H, C_1-C_6 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc

R^{15} và R^{16} cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 7 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm

halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

R^{17} là C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{18} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{19} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{18} và R^{19} cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào để tạo ra vòng;

R^{20} là H, xyano, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl hoặc $C(O)R^{22}$; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{21} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{22} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_6 haloxycloalkyl, C_3-C_6 xycloalky- lalkyl hoặc C_3-C_6 haloxycloalkylalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1-C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} một cách độc lập cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 7 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{27} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy hoặc $NR^{29}R^{30}$; hoặc phenyl hoặc vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{28} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R^{29} độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{30} độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{29} và R^{30} cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào để tạo ra vòng có 3 tới 10 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng tối đa 4 phần tử thếs độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

Q^a là hệ vòng hoặc vòng thơm có 5 tới 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc vòng no một phần có 3 tới 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là

nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, vòng thơm dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh hoặc vòng không thơm dị vòng có 3 tơi 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các thành viên vòng được chọn trong số nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn trong số nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn trong số C(=O) và C(=S) và thành viên vòng là nguyên tử lưu huỳnh được chọn trong số S, S(O) hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

A là CH hoặc CF; và

m bằng 0.

3. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này có công thức được chọn từ nhóm bao gồm:

N-(1-methyletyl)-2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-4-carboxamit;

N-xyclopropyl-2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-4-carboxamit;

N-xyclohexyl-2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-4-carboxamit;

2-(3-pyriđinyl)-N-(2,2,2-trifloroetyl)-2H-inđazol-4-carboxamit;

2-(3-pyriđinyl)-N-[(tetrahyđro-2-furanyl)metyl]-2H-inđazol-5-carboxamit;

metyl 2-[[2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-5-yl]carbonyl]hyđrazincarboxylat;

N-(2,2-đifloropropyl)-2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-5-carboxamit;

2-(3-pyriđinyl)-N-(2-pyrimiđinylmetyl)-2H-inđazol-5-carboxamit; và

N-[(5-methyl-2-pyrazinyl)metyl]-2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-5-carboxamit.

4. Chế phẩm chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 tới 3 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

5. Chế phẩm theo điểm 4, trong đó ít nhất một chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xyclopro- thrin, cycloxaprid, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, di-flubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenbutatin oxide, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron, flufenoxystrobin, fluensulfone, fluopyram, flupyradifurone, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, hep- tafluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb,

insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, metofluthrin, monocrotophos, monofluorothrin, nicotine, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumide, pymetro- zine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetramethylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tioxazafen, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlo- rfon, triflumezopyrim, triflumuron, nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn gây bệnh cho côn trùng, virut gây bệnh cho côn trùng và nấm bệnh cho côn trùng.

6. Chế phẩm theo điểm 5, trong đó chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma- cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamide, flufenoxuron, flufenoxystrobin, fluensulfone, flupyradifurone, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methoprene, methoxyfenozide,

metofluthrin, monofluorothrin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, tetramethylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, triazamate, triflumezopyrim, triflumuron, nội độc tố đelta *Bacillus thuringiensis*, toàn bộ chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng virut đa diện nhân.

7. Phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường sống của nó tiếp xúc với hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 tới 3 với lượng hữu hiệu sinh học, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp trị liệu để điều trị cho cơ thể người hoặc động vật.

8. Phương pháp theo điểm 7, trong đó môi trường là thực vật.

9. Phương pháp theo điểm 7, trong đó môi trường là hạt giống.

10. Phương pháp theo điểm 9, trong đó hạt giống được bao bằng hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 tới 3 đã được bào chế dưới dạng chế phẩm chứa chất tạo màng hoặc chất kết dính.

11. Hạt giống đã được xử lý chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 tới 3 với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% khối lượng hạt giống trước khi xử lý.

12. Hợp chất có công thức được chọn từ nhóm bao gồm axit 2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-5-carboxylic, 2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-5-carbonyl clorua, axit 2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-4-carboxylic, và 2-(3-pyriđinyl)-2H-inđazol-4-carbonyl clorua.