



(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)



1-0032409

(51)⁷ C07D 401/14; C07D 405/14; A01N
43/713

(13) B

(21) 1-2017-00907

(22) 09/12/2009

(62) 1-2011-01767

(86) PCT/EP2009/008775 09/12/2009

(87) WO 2010/069502 24/06/2010

(30) 08172205.0 18/12/2008 EP

(45) 25/07/2022 412

(43) 25/05/2017 350A

(73) Bayer Cropscience Aktiengesellschaft (DE)

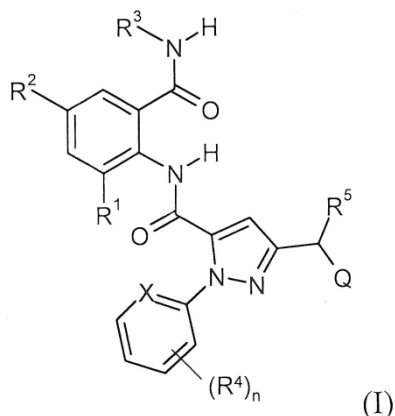
Alfred-Nobel-Str.50, 40789 Monheim am Rhein, Germany.

(72) FISCHER, Rüdiger (DE); FUNKE, Christian (DE); GESING, Ernst, Rudolf (DE); GRONDAL, Christoph (DE); HENSE, Achim (DE); BECKER, Angela (DE); FRANKEN, Eva-Maria (DE); MALSAM, Olga (DE); VOERSTE, Arnd (DE); GÖRGES, Ulrich (DE); WROBLOWSKY, Heinz-Juergen (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT ANTHRANILAMIT, CHẾ PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT ĐỘNG VẬT GÂY HẠI

(57) Sáng chế đề xuất anthranilamit được thể tetrazol có công thức (I)



trong đó R¹, R², R³, R⁴, R⁵, n, X và Q có nghĩa đã nêu trong bản mô tả và việc sử dụng chúng làm thuốc trừ sâu và/hoặc thuốc diệt ve, ngoài ra trong tổ hợp với các chất khác như chất thấm và/hoặc các muối amoni hoặc muối phosphoni.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các anthranilamit được thế tetrazol, đến nhiều quy trình để điều chế chúng và đến sự sử dụng chúng làm các hợp chất hoạt tính trong tổ hợp với các chất khác để tăng cường hoạt tính, cụ thể đến sự sử dụng chúng làm thuốc trừ sâu.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Tài liệu kỹ thuật đã mô tả rằng các anthranilamit nhất định (ví dụ WO 01/70671, WO 03/015519, WO 03/016284, WO 03/015518, WO 03/024222, WO 03/016282, WO 03/016283, WO 03/062226, WO 03/027099, WO 04/027042, WO 04/033468, WO 2004/046129, WO 2004/067528, WO 2005/118552, WO 2005/077934, WO 2005/085234, WO 2006/023783, WO 2006/000336, WO 2006/040113, WO 2006/111341, WO 2007/006670, WO 2007/024833, WO2007/020877 and WO 07/144100) có các đặc tính trừ sâu.

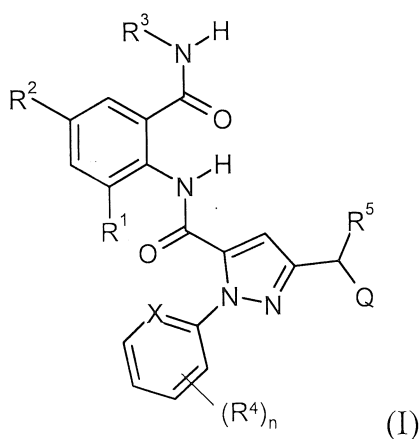
Tài liệu kỹ thuật cũng mô tả rằng hoạt tính của các hợp chất hoạt tính khác nhau có thể được tăng lên qua việc bổ sung các chất khác, không kể muối amoni. Tuy nhiên, các muối này là các muối có tác dụng tẩy rửa (ví dụ WO 95/017817) hoặc các muối có các phần tử thế aryl và/hoặc aryl mạch tương đối dài mà có tác dụng thấm qua hoặc làm tăng tính tan của hợp chất hoạt tính (ví dụ EP-A 0 453 086, EP-A 0 664 081, FRA 2 600 494, US 4 844 734, US 5 462 912, US 5 538 937, US-A 03/0224939, USA 05/0009880, US-A 05/0096386). Ngoài ra, tình trạng kỹ thuật mô tả hoạt tính chỉ đối với các hợp chất hoạt tính nhất định và/hoặc các ứng dụng của các chế phẩm liên quan. Trong các trường hợp khác, chúng là các muối của các axit sunfonic trong đó các axit có hoạt tính làm tê liệt các con côn trùng (US 2 842 476). Sự tăng hoạt tính bằng amoni sunphat, ví dụ, được mô tả qua ví dụ đối với các thuốc diệt cỏ glyphosat và photphinothrixin (US 6 645 914, EP-A2 0 036 106). Sự sử dụng amoni sunphat làm chất phụ trợ bào chế cũng đã được mô tả đối với các hợp chất hoạt tính nhất định và các ứng dụng (WO 92/16108), nhưng mục đích của nó ở đây là ổn định chế phẩm chứ không tăng cường hoạt tính. Các tổ hợp của các muối amoni với các hợp chất hoạt tính

còn được mô tả trong WO 07/068356, WO 07/068428, WO 07/068355, WO 07/068357 và WO 07/068350. Những công bố này chỉ được đưa vào đây để tham khảo.

Giờ đây đã phát hiện ra rằng các anthranilamit mới có ưu điểm so với tình trạng kỹ thuật, ví dụ nhờ đặc tính sinh học hoặc sinh thái tốt hơn của chúng. Ưu điểm khác mà có thể được đề cập qua ví dụ là các phương pháp ứng dụng rộng hơn, hoạt tính trừ sâu và/hoặc diệt ve tốt hơn và tính tương thích với cây hữu ích tốt. Anthranilamit chứa tetrazol có thể được sử dụng trong tổ hợp với các chất khác để cải thiện tính hiệu quả cụ thể chống lại côn trùng khó kiểm soát.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất anthranilamit được thể tetrazol có công thức chung (I)



trong đó

R^1 là metyl hoặc clo,

R^2 là halogen, xyano, metyl hoặc C_1 - C_4 -alkylsulphonyl,

R^3 là hydro hoặc là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng được thể đơn hoặc đa bằng các phần tử thể khác nhau, trong đó các phần tử thể độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, amino, xyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_2 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -xycloalkylamino và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần,

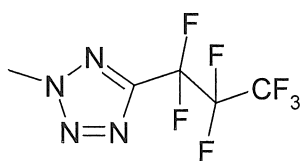
n là 1, 2, 3 hoặc 4,

X là N, CH, CF, CCl, CBr,

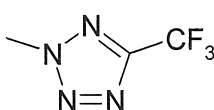
R⁴ độc lập với nhau là hydro, xyano, halo-C₁-C₆-alkyl, halogen hoặc halo-C₁-C₄-alkoxy,

R⁵ là hydro hoặc C₁-C₆-alkyl,

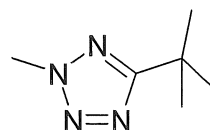
Q là một trong gốc tetrazol từ nhóm Q-1 đến Q-11 ở dưới mà được thế đơn bởi C₁-C₆-alkyl, halo-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl,



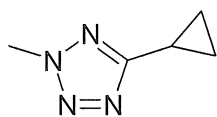
Q-1



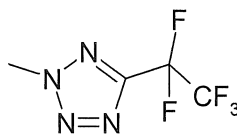
Q-2



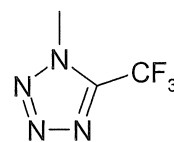
Q-3



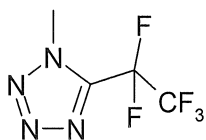
Q-4



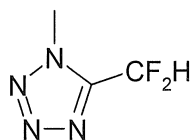
Q-5



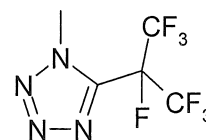
Q-6



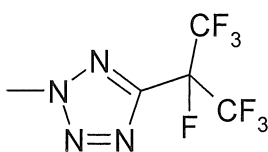
Q-7



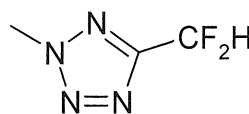
Q-8



Q-9



Q-10



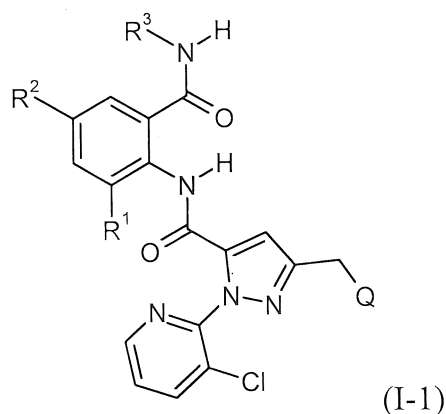
Q-11

và ngoài ra đến các muối của hợp chất có công thức (I).

Nếu thích hợp, hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại ở các dạng đa hình khác nhau hoặc là các hỗn hợp của các dạng đa hình khác nhau. Cả chất đa hình tinh khiết và các hỗn hợp chất đa hình được đề xuất bởi sáng chế và có thể được sử dụng theo sáng chế.

Hợp chất (I) cho định nghĩa chung về anthranilamid được thế tetrazol theo sáng chế. Các định nghĩa ưu tiên về gốc cho các công thức đề cập ở trên và dưới đây được đưa ra dưới đây. Những định nghĩa này áp dụng với các sản phẩm cuối có công thức (I) và cũng với tất cả các chất trung gian.

Sự ưu tiên theo sáng chế dành cho các hợp chất có công thức (I-1)



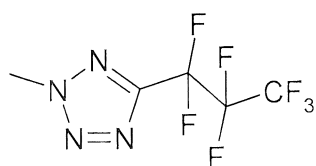
trong đó

R^1 là metyl hoặc clo,

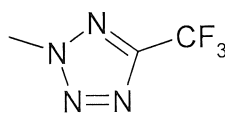
R^2 là halogen, xyano hoặc metyl,

R^3 là hydro hoặc là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng được thế đơn hoặc đa bằng các phần tử thế khác nhau, trong đó các phần tử thế độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, amino, xyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_2 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -xycloalkylamino và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần,

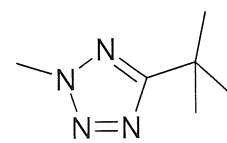
Q là một trong gốc tetrazol từ nhóm Q-1 đến Q-7 ở dưới mà được thế đơn bởi C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, hoặc C_3 - C_6 -xycloalkyl,



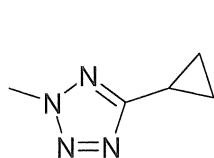
Q-1



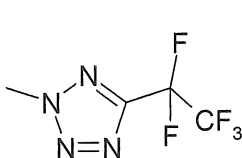
Q-2



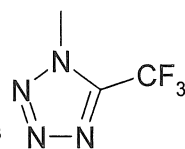
Q-3



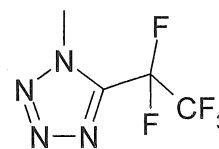
Q-4



Q-5



Q-6



Q-7

và ngoài ra đến các muối của hợp chất có công thức (I-1).

Ưu tiên và đặc biệt ưu tiên các hợp chất có công thức (I-1)

trong đó

R^1 ưu tiên và đặc biệt ưu tiên là methyl,

R^2 ưu tiên là halogen, xyano hoặc methyl,

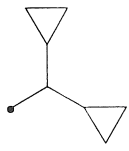
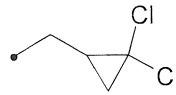
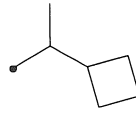
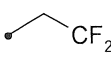
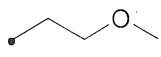
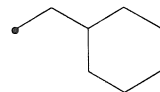
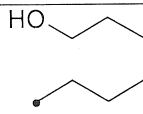
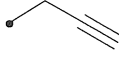
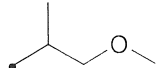
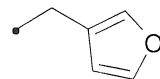
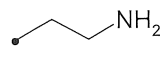
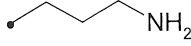
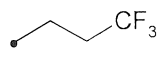
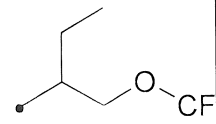
R^2 đặc biệt ưu tiên là clo hoặc xyano,

R^2 cũng đặc biệt ưu tiên là brom, flo, iot hoặc methyl,

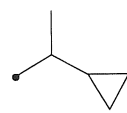
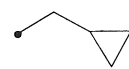
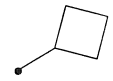
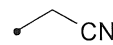
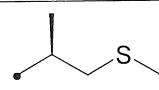
R^3 ưu tiên là hydro hoặc là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng tùy ý được thể đơn hoặc thể đa bằng các phần tử thể giống hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, amino, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_3 - C_6 -xycloalkyl và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần mà chứa 1 hoặc 2 dị nguyên tử từ nhóm gồm N, O và S, trong đó hai nguyên tử oxy không liền kề nhau trên vòng,

R^3 đặc biệt rất ưu tiên là một trong các gốc sau đây:

H				

R^3 đặc biệt rất ưu tiên là một trong các gốc sau đây

H				
				

Q ưu tiên là gốc Q-1, Q-2, Q-6,

Q cũng ưu tiên là các gốc Q-3, Q-4, Q-5, Q-7,

Q đặc biệt ưu tiên là các gốc Q-2, Q-6,

Q cũng đặc biệt ưu tiên là các gốc Q-5, Q-7.

Ngoài ra, theo sáng chế, ưu tiên các hợp chất có công thức (I) trong đó các gốc R^1 , R^2 , R^3 và Q có ý nghĩa ưu tiên, đặc biệt ưu tiên và đặc biệt rất ưu tiên nêu ở trên và trong đó:

R^4 ưu tiên là halo- C_1 - C_6 -alkyl hoặc halogen, đặc biệt ưu tiên clo hoặc brom, đặc biệt rất ưu tiên clo.

R^5 ưu tiên là hydro, metyl, etyl, propyl hoặc isopropyl, đặc biệt ưu tiên hydro hoặc metyl,

X ưu tiên là N, CCl hoặc CH, đặc biệt ưu tiên N hoặc CH,

n ưu tiên là 1, 2 hoặc 3, đặc biệt ưu tiên 1 hoặc 2, đặc biệt rất ưu tiên 1,

Q cũng ưu tiên là các gốc Q-8, Q-9, Q-10, Q-11.

Mô tả chi tiết sáng chế

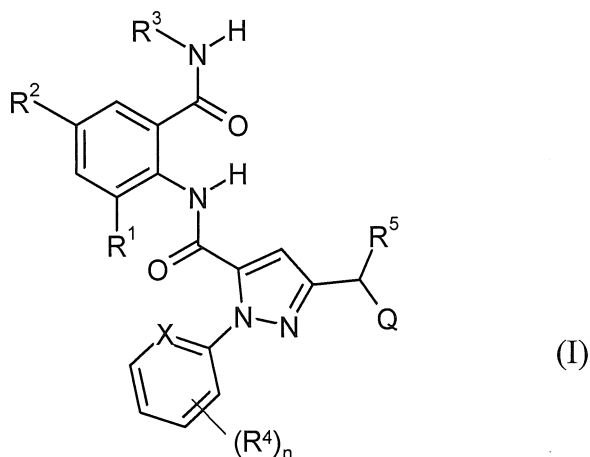
Các hợp chất có công thức (I) và (I-1) có thể tồn tại dưới dạng các đồng phân khác nhau. Sáng chế theo đó cũng đề xuất các chất đồng phân của các hợp chất có các công thức (I) và (I-1) và các hỗn hợp của các dạng chất đồng phân khác nhau.

Các hợp chất có công thức (I) và (I-1) có thể tồn tại dưới dạng các regioisomer khác nhau, ví dụ ở dạng các hỗn hợp của các hợp chất có định nghĩa Q2 và Q6. Do đó, sáng chế cũng bao gồm hỗn hợp của các hợp chất có công thức (I) và (I-1), trong đó Q có ý nghĩa Q2 và Q6 và các hợp chất có thể tồn tại trong các tỷ lệ trộn khác nhau. Ở đây ưu tiên các tỷ lệ trộn hợp chất có công thức (I) hoặc (I-1) trong đó gốc Q là Q2, với các hợp chất có công thức (I) hoặc (I-1) trong đó gốc Q là Q6, từ 60:40 đến 99:1, đặc biệt ưu tiên từ 70:30 đến 97:3, đặc biệt rất ưu tiên từ 80:20 đến 95:5. Đặc biệt ưu tiên các tỷ lệ trộn sau đây giữa hợp chất có công thức (I) hoặc (I-1) trong đó Q có nghĩa Q2 và hợp chất có công thức (I) hoặc (I-1) trong đó Q có nghĩa Q6: 80:20; 81:19; 82:18; 83:17; 84:16; 85:15; 86:14; 87:13; 88:12; 89:11; 90:10; 91:9; 92:8; 93:7; 96:6; 95:5.

Điều chế các hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế

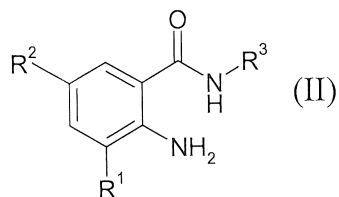
Anthranilamit có công thức (I) thu được bằng một trong các quy trình sau.

Anthranilamit có công thức (I)



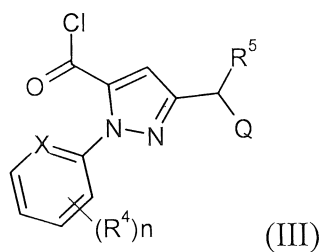
trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , n , X và Q có nghĩa đã nêu ở trên thu được bằng cách

(A) cho anilin có công thức (II)



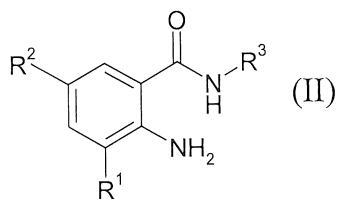
trong đó R^1 , R^2 và R^3 có ý nghĩa đã nêu ở trên,

với cacbonyl clorua có công thức (III)



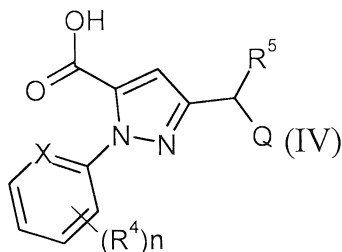
trong đó X , Q , R^4 , R^5 và n có ý nghĩa đã nêu ở trên, trong sự có mặt của chất liên kết axit,

(B) cho các anilin có công thức (II)



trong đó R^1 , R^2 và R^3 có ý nghĩa đã nêu ở trên,

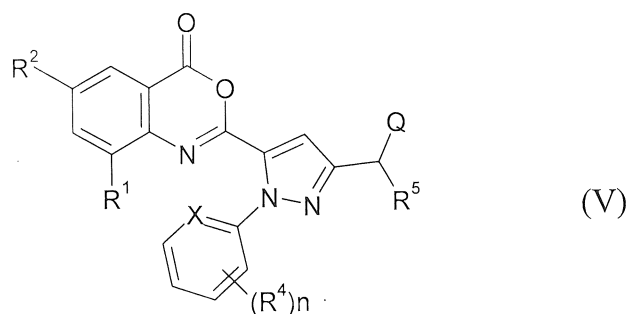
phản ứng với các axit cacboxylic có công thức (IV)



trong đó Q , R^4 , R^5 , n , X có ý nghĩa đã nêu ở trên,

trong sự có mặt của chất ngưng tụ hoặc bằng

(C) phản ứng của benzoxazinon có công thức (V)



trong đó R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , n , X và Q có nghĩa đã nêu ở trên,

với amin có công thức (X)

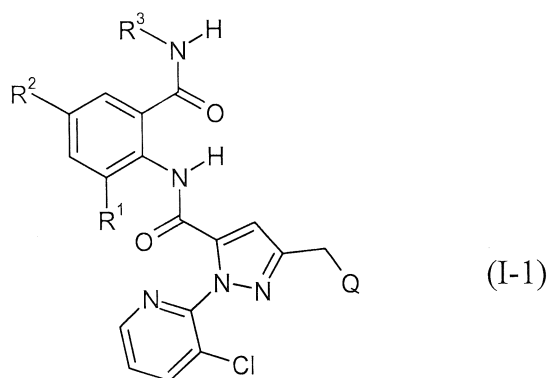


trong đó R^3 có nghĩa đã nêu ở trên,

trong sự có mặt của chất làm loãng.

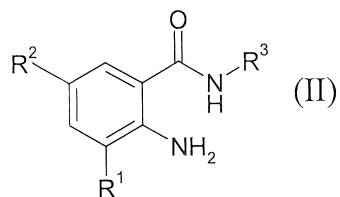
Ngoài ra, phát hiện ra rằng các anthranilamit có công thức (I-1) thu được bằng một trong các quy trình ở dưới:

Anthranilamit có công thức (I-1)



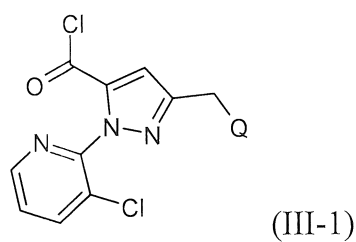
trong đó R^1 , R^2 , R^3 và Q có ý nghĩa đã nêu ở trên thu được bằng cách

(A) cho anilin có công thức (II)



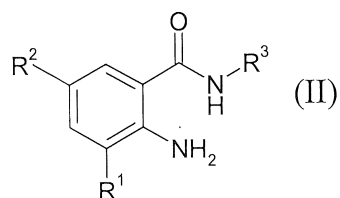
trong đó R^1 , R^2 và R^3 có ý nghĩa đã nêu ở trên,

với cacbonyl clorua có công thức (III)



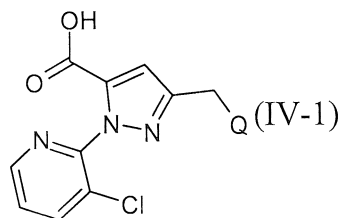
trong đó Q có ý nghĩa đã nêu ở trên, trong sự có mặt của chất liên kết axit,

(B) cho các anilin có công thức (II)



trong đó R^1 , R^2 và R^3 có ý nghĩa đã nêu ở trên,

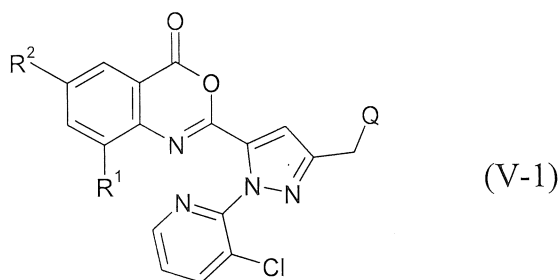
phản ứng với các axit cacboxylic có công thức (IV)



trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên,

trong sự có mặt của chất ngưng tụ hoặc bằng

(C) phản ứng của benzoxazinon có công thức (V-1)



trong đó R^1 , R^2 và Q có ý nghĩa nêu ở trên,

với amin có công thức (X)



trong đó R^3 có nghĩa đã nêu ở trên,

trong sự có mặt của chất làm loãng.

Các hợp chất hoạt tính theo sáng chế, kết hợp với tính chống chịu tốt ở cây, độc tính thuận lợi với các động vật máu nóng và được dung nạp tốt bởi môi trường, thích hợp để bảo vệ các cây trồng và bộ phận cây trồng, tăng năng suất thu hoạch, cải thiện tính chất vật liệu thu hoạch và kiểm soát các động vật gây hại, cụ thể là các côn trùng, động vật lớp nhện, giun sán, giun tròn và động vật thân mềm, gặp trong nông nghiệp, nghề làm vườn, nghề chăn nuôi, trong các khu rừng, trong các khu vườn và các thiết bị giải trí, trong bảo vệ các sản phẩm bảo quản và các nguyên liệu, và trong khu vực vệ sinh. Chúng có thể được sử dụng tốt hơn làm các chất bảo vệ cây trồng. Chúng có tính hoạt tính đối với các dạng có tính kháng và nhạy cảm và đối với rất cả hoặc một số giai đoạn phát triển. Các vật gây hại đã được đề cập ở trên gồm:

Từ Bộ chấy giận (giận chấy) ví dụ *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

Từ lớp nhện, ví dụ bét ve, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes*

spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

Từ lớp hai mảnh vỏ, ví dụ *Dreissena* spp.

Từ bộ chân môi, ví dụ *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

Từ bộ cánh cứng, ví dụ, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

Từ bộ đuôi bật, ví dụ *Onychiurus armatus*.

Từ bộ cánh da, ví dụ *Forficula auricularia*

Từ bộ chân kép, ví dụ *Blaniulus guttulatus*.

Từ bộ Hai cánh, ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia*

hominis, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella* frit, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp..

Từ lớp chân bụng, ví dụ *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

Từ lớp giun sán, ví dụ *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostromylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Hơn nữa có thể kiểm soát được động vật nguyên sinh, như là *Eimeria*.

Từ bộ cánh nửa, ví dụ, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

Từ Cánh giống, ví dụ, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis*

cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneiocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccoxystus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

Từ bộ cánh màng, ví dụ Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Từ bộ chân đều, ví dụ Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Từ các bộ Cánh đều, ví dụ Reticulitermes spp., Odontotermes spp.

Từ bộ cánh vẩy, ví dụ Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella,

Cheimatobia brumata, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophan antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.

Từ bộ cánh thẳng, ví dụ *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

Từ bộ bộ chét, ví dụ *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

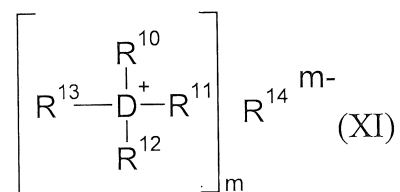
Từ phân lớp rết tơ, ví dụ *Scutigera* spp.

Từ các bộ Cánh tơ, ví dụ, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Từ bộ ba đuôi, ví dụ *Lepisma saccharina*.

Giun tròn ký sinh thực vật bao gồm, ví dụ, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

Tính hiệu quả của các hợp chất có công thức (I) có thể được tăng bằng muối amoni và muối phosphoni. Muối amoni và muối phosphoni được xác định bởi công thức (XI)



trong đó

D là nitơ hoặc photpho,

D tốt hơn là nitơ,

R^{10} , R^{11} , R^{12} , và R^{13} độc lập với nhau là hydro hoặc trong từng trường hợp là C_1 - C_8 -alkyl tùy ý được thế hoặc C_1 - C_8 -alkylen đơn hoặc đa bão hòa, tùy ý được thế, trong đó các phần tử thế có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, nitro và xyano,

R^{10} , R^{11} , R^{12} , và R^{13} độc lập với nhau ưu tiên là hydro hoặc trong từng trường hợp là C_1 - C_4 -alkyl tùy ý được thế, trong đó các phần tử thế có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, nitro và xyano,

R^{10} , R^{11} , R^{12} , và R^{13} độc lập với nhau đặc biệt ưu tiên là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl hoặc t-butyl,

R^{10} , R^{11} , R^{12} và R^{13} đặc biệt rất ưu tiên là hydro,

m là 1, 2, 3 hoặc 4,

m ưu tiên là 1 hoặc 2,

R^{14} là anion hữu cơ hoặc vô cơ,

R^{14} ưu tiên là bicacbonat, tetraborat, florua, bromua, iodia, cloua, monohydrophosphat, dihydrophosphat, hydrosulphat, tartrat, sulphat, nitrat, thiosulphat, thioxyanat, format, lactat, axetat, propionat, butyrat, pentanoat, xitrat hoặc oxalat,

R^{14} đặc biệt ưu tiên là lactat, sulphat, monohydrophosphat, dihydrophosphat, nitrat, thiosulphat, thioxyanat, xitrat, oxalat hoặc format,

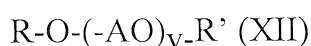
R¹⁴ đặc biệt rất ưu tiên là sulphat.

Các muối amoni và các muối phosphoni có công thức (XI) có thể được sử dụng trong khoảng nồng độ rộng để tăng tác dụng của các chế phẩm bảo vệ thực vật bao gồm các hợp chất có công thức (I). Nhìn chung, các muối amoni hoặc các muối phosphoni được sử dụng trong chế phẩm bảo vệ thực vật dùng sẵn trong nồng độ từ 0,5 đến 80mmol/l, ưu tiên từ 0,75 đến 37,5mmol/l, đặc biệt ưu tiên từ 1,5 đến 25mmol/l. Trong trường hợp sản phẩm được bào chế, nồng độ của muối amoni và/hoặc muối phosphoni trong công thức được chọn để nằm trong khoảng chung đã nêu, khoảng ưu tiên hoặc đặc biệt ưu tiên sau khi làm loãng công thức đến nồng độ thích hợp của hợp chất hoạt tính. Nồng độ của muối trong công thức ở đây thường là 1-50% trọng lượng.

Trong một phương án ưu tiên của sáng chế, không chỉ muối amoni và/hoặc muối phosphoni mà chất thấm được thêm vào các chế phẩm bảo vệ thực vật để làm tăng hoạt tính. Sự tăng hoạt tính có thể được quan sát ngay cả trong các trường hợp này. Do đó, sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng chất thấm và ngoài ra sự sử dụng tổ hợp của chất thấm và các muối amoni và/hoặc các muối phosphoni để làm tăng hoạt tính các chế phẩm bảo vệ thực vật mà gồm các hợp chất hoạt tính diệt ve/trừ sâu có công thức (I) làm hợp chất hoạt tính. Cuối cùng, sáng chế cũng đề xuất sự sử dụng các chế phẩm này để kiểm soát các côn trùng có hại.

Các chất thấm phù hợp trong sáng chế gồm tất cả các chất thấm thường được sử dụng để tăng cường sự thấm của các hợp chất hoạt tính hóa nông vào cây trồng. Các chất thấm được xác định trong tài liệu này bởi khả năng thấm từ dịch phun có nước và/hoặc từ lớp phủ phun vào biểu bì của cây trồng và do đó làm tăng tính lưu động của các hợp chất hoạt tính trong biểu bì. Phương pháp được mô tả trong tài liệu (Baur và cộng sự, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác định đặc tính này.

Các chất thấm phù hợp là, ví dụ, ankanol ankoxylat. Các chất thấm theo sáng chế là các ankanol ankoxylat có công thức



trong đó

R là ankyl mạch thẳng hoặc được phân nhánh có từ 4 đến 20 nguyên tử cacbon,

R' là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, n-pentyl hoặc n-hexyl,

AO là gốc etylen oxit, gốc propylen oxit, gốc butylen oxit hoặc là các hỗn hợp của metylen oxit và các gốc propylen oxit hoặc các gốc butylen oxit và

v là các số từ 2 đến 30,

Nhóm các chất thẩm được ưu tiên là các ankoxylat ankanol có công thức



trong đó

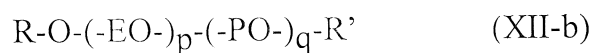
R có ý nghĩa đã nêu ở trên,

R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,

EO là $-CH_2-CH_2-O-$ và

n là các số từ 2 đến 20,

Nhóm các chất thẩm được ưu tiên hơn là các ankoxylat ankanol có công thức

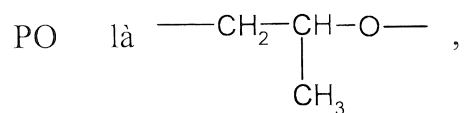


trong đó

R có ý nghĩa đã nêu ở trên,

R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,

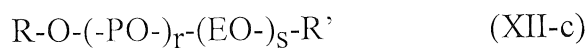
EO là $-CH_2-CH_2-O-$,



p là số từ 1 đến 10, và

q là các số từ 1 đến 10,

Nhóm các chất thẩm được ưu tiên hơn là các ankoxylat ankanol có công thức

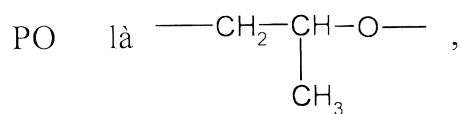


trong đó

R có ý nghĩa đã nêu ở trên,

R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,

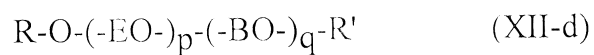
EO là $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,



r là số từ 1 đến 10, và

s là các số từ 1 đến 10,

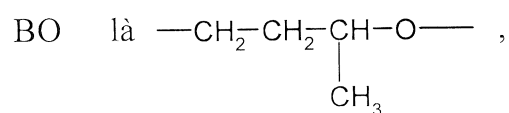
Nhóm các chất thẩm được ưu tiên hơn là các ankoxylat ankanol có công thức



trong đó

R và R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,

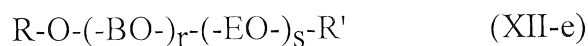
EO là $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,



p là số từ 1 đến 10, và

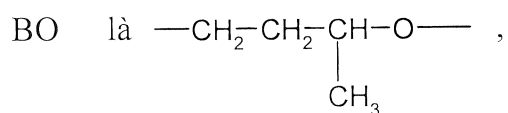
q là các số từ 1 đến 10,

Nhóm các chất thẩm được ưu tiên hơn là các ankoxylat ankanol có công thức



trong đó

R và R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,



EO là $-\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---O-}$,

r là số từ 1 đến 10, và

s là các số từ 1 đến 10,

Nhóm các chất thẩm được ưu tiên hơn là các ankoxylat ankanol có công thức



trong đó

R' có ý nghĩa đã nêu ở trên,

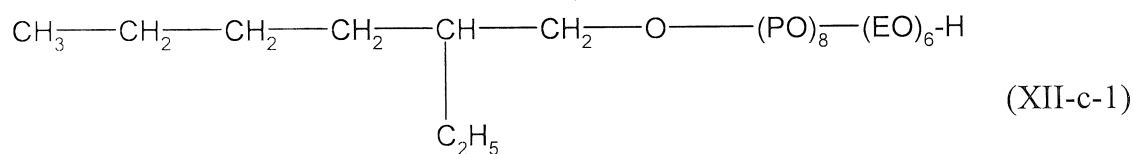
t là các số từ 8 đến 13,

u là các số từ 6 đến 17,

Trong công thức đã được đưa ra ở trên,

R ưu tiên là butyl, isobutyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, n-hexyl, isohexyl, n-octyl, isooctyl, 2-ethylhexyl, nonyl, isononyl, đexyl, n-dodexyl, isododexyl, lauryl, myristyl, isotridexyl, trimetylnonyl, panmityl, stearyl hoặc eicosyl.

Như ví dụ về ankanol ankoxylat có công thức (XII-c) có thể được tạo thành từ 2-ethylhexyl ankoxylat có công thức



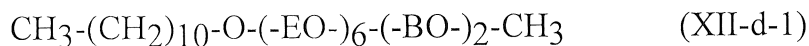
trong đó

EO là $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,

PO là $\text{---CH}_2\text{---}\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---O---}$, và

các số 8 và 6 là các giá trị trung bình.

Ví dụ về ankanol ankoxylat có công thức (XII-d) có thể được tạo thành từ công thức



trong đó

EO là $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,

BO là $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---}\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---O---}$, và

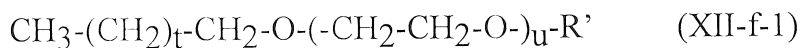
các số 10, 6 và 2 là các giá trị trung bình..

Các alkoxylat ankanol có công thức (XII-f) đặc biệt ưu tiên là các hợp chất có công thức này trong đó

t là số từ 9 đến 12, và

u là số từ 7 đến 9.

Đặc biệt rất ưu tiên là alkanol alkoxylat có công thức (XII-f-1)



trong đó

t là giá trị trung bình 10,5 và

u là giá trị trung bình 8,4

Công thức trên đưa ra định nghĩa chung về các ankanol ankoxylat. Các chất này là các hỗn hợp của các chất loại đã được biết với độ dài chuỗi khác nhau. Do đó, các chỉ số là các giá trị trung bình mà cũng có thể lệch so với các số nguyên.

Các alkanol ankoxylat có công thức đã nêu được biết đến và trong một số trường hợp chúng có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết (tham khảo WO 98/35 553, WO 00/35 278 và EPA 0 681 865).

Các chất thấm thích hợp cũng bao gồm, chẳng hạn, các chất tăng cường tính hòa tan của các hợp chất có công thức (I) trong lớp phủ phun. Các chất này gồm có, ví dụ, dầu khoáng và dầu thực vật. Dầu phù hợp là tất cả các loại dầu khoáng hoặc dầu thực vật đã được cải biến hoặc có thể thường được sử dụng trong các chế phẩm hóa nông. Ví dụ, dầu hướng dương, dầu hạt cải, dầu ôliu, dầu thầu dầu, dầu cải dầu, dầu hạt ngô, dầu hạt bông và dầu đậu tương hoặc các este của các dầu đó. Ưu tiên đối với dầu hạt cải, dầu hướng dương và các este etyl hoặc metyl của chúng.

Nồng độ của chất thấm có thể được thay đổi trong phạm vi rộng. Trong trường hợp chế phẩm bảo vệ thực vật đã bào chế, thường là từ 1 đến 95% trọng lượng, ưu tiên từ 1 đến 55% trọng lượng, đặc biệt ưu tiên từ 15 đến 40% trọng lượng. Đối với các chế phẩm sử dụng ngay (dung dịch phun), nồng độ nói chung trong khoảng 0,1 và 10 g/l, tốt hơn là trong khoảng 0,5 và 5 g/l.

Tổ hợp được nhấn mạnh mang tính sáng tạo chứa thành phần hoạt tính, muối và chất thấm được liệt kê trong bảng dưới đây. Ở đây, “theo thử nghiệm” nghĩa là hợp chất bất kỳ mà hoạt động như một chất thấm trong thử nghiệm sự thấm qua biểu bì (Baur cộng sự, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) là phù hợp.

#	Hợp chất hoạt tính	Muối	Chất thử
1	I	Amoni sulphat	Theo thử nghiệm
2	I	Amoni lactat	Theo thử nghiệm
3	I	Amoni nitrat	Theo thử nghiệm
4	I	Amoni thiosulphat	Theo thử nghiệm
5	I	Ammoni thioxyanat	Theo thử nghiệm
6	I	Amoni xitrat	Theo thử nghiệm
7	I	Amoni oxalat	Theo thử nghiệm
8	I	Amoni format	Theo thử nghiệm
9	I	Amoni hydrophosphat	Theo thử nghiệm
10	I	Amoni dihydrophosphat	Theo thử nghiệm
11	I	Amoni cacbonat	Theo thử nghiệm
12	I	Amoni benzoat	Theo thử nghiệm
13	I	Amoni sulphit	Theo thử nghiệm
14	I	Amoni benzoat	Theo thử nghiệm
15	I	Amoni hydrooxalat	Theo thử nghiệm
16	I	Ammoni hydroxitrat	Theo thử nghiệm
17	I	Amoni axetat	Theo thử nghiệm
18	I	Tetrametylamoni sulphat	Theo thử nghiệm
19	I	Tetrametylamoni lactat	Theo thử nghiệm
20	I	Tetrametylamoni nitrat	Theo thử nghiệm
21	I	Tetrametylamoni thiosulphat	Theo thử nghiệm
22	I	Tetrametylamoni thioxyanat	Theo thử nghiệm
23	I	Tetrametylamoni xitrat	Theo thử nghiệm
24	I	Tetrametylamoni oxalat	Theo thử nghiệm
25	I	Tetrametylamoni format	Theo thử nghiệm
26	I	Tetrametylamoni hydrophosphat	Theo thử nghiệm
27	I	Tetrametylamoni dihydrophosphat	Theo thử nghiệm
28	I	Tetraetylamoni sulphat	Theo thử nghiệm
29	I	Tetraetylamoni lactat	Theo thử nghiệm
30	I	Tetraetylamoni nitrat	Theo thử nghiệm
31	I	Tetraetylamoni thiosulphat	Theo thử nghiệm
32	I	Tetraetylamoni thioxyanat	Theo thử nghiệm
33	I	Tetraetylamoni xitrat	Theo thử nghiệm
34	I	Tetraetylamoni oxalat	Theo thử nghiệm

#	Hợp chất hoạt tính	Muối	Chất tham
35	I	Tetraethylamoni format	Theo thử nghiệm
36	I	Tetraethylamoni hydrophosphat	Theo thử nghiệm
37	I	Tetraethylamoni dihydrophosphat	Theo thử nghiệm

Nếu phù hợp, các hợp chất theo sáng chế có thể, ở các nồng độ hoặc các tỷ lệ áp dụng đã biết, cũng được sử dụng làm các thuốc diệt cỏ, chất an toàn, các chất điều biến sự tăng trưởng hoặc các chất để làm cải thiện các tính chất cây trồng, hoặc là các chất sát trùng, ví dụ các thuốc diệt nấm, các thuốc chống nấm, các thuốc sát trùng, các thuốc chống virus (gồm cả các chất chống lại các virus) hoặc các chất chống lại LO (virus phytoplasma) và RLO (vi khuẩn trùng giện). Nếu phù hợp, chúng có thể cũng được sử dụng để làm các chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các hợp chất hoạt tính khác.

Các hợp chất hoạt tính có thể được chuyển hóa thành các chế phẩm thông thường, chẳng hạn như dung dịch, nhũ tương, bột làm ẩm được, huyền phù gốc nước và huyền phù gốc dầu, bột, bụi, bột nhão, bột tan được, hạt tan được, hạt để rải rắc, chất cô đặc nhũ huyền phù, hợp chất tự nhiên được ngâm tẩm với hợp chất hoạt tính, chất tổng hợp được ngâm tẩm với hợp chất hoạt tính, phân bón và còn các vi nang trong các chất cao phân tử.

Các công thức này được tạo ra theo cách đã biết, ví dụ bằng cách trộn các hợp chất hoạt tính với các chất kéo dài, đó là các dung môi lỏng và/hoặc các chất mang rắn, tùy ý sử dụng các chất hoạt tính bề mặt, mà là các chất nhũ hóa và/hoặc các chất tán sắc và/hoặc các chất tạo bọt. Các chế phẩm được điều chế hoặc là trong các nhà máy thích hợp hoặc là nơi khác trước khi hoặc trong quá trình áp dụng.

Thích hợp để sử dụng làm các chất phụ trợ là các chất thích hợp để truyền cho chính chế phẩm và/hoặc cho các chế phẩm bắt nguồn từ đó (ví dụ dung dịch phun, vỏ hạt) các đặc tính như các đặc tính kỹ thuật nhất định và/hoặc cả các đặc tính sinh học đặc biệt. Các chất phụ trợ thích hợp thông thường là: Các chất độn, dung môi và chất mang.

Các chất độn thích hợp là, ví dụ, nước, các chất lỏng hoá hữu cơ phân cực hoặc không phân cực, ví dụ từ các lớp gồm các hydrocacbon thơm và không thơm (như các parafin, các alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), các rượu và các polyol (nếu thích hợp, cũng có thể được thế, ete hoá và/hoặc este hoá), các keton (như axeton, xyclohexanon), các este (gồm các chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin được thế và không được thế, các amit, lactam (như các N-alkylpyrolidon) và các lacton, các sulphon và sulphoxit (như dimetyl sulphoxit).

Nếu chất độn sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, các dung môi hữu cơ làm các dung môi phụ trợ. Về cơ bản, các dung môi lỏng thích hợp là các chất thơm như xylen, toluen, hoặc các alkylnaphtalen, các hydrocacbon béo đã clo hóa hoặc thơm đã clo hóa, như các clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, các hydrocacbon béo, như các xyclohexan hoặc các parafin, ví dụ về các phần cất dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu, như butanol hoặc glycol, và ngoài ra còn các este và các ete của chúng như axeton, xeton metyl etyl, xeton metyl isobutyl hoặc xyclohexanon, các dung môi phân cực mạnh như dimetyl sulphoxit và cả nước.

Các chất mang rắn phù hợp là:

các muối amoni và các khoáng tự nhiên trong đất như cao lanh, đất sét, đá tan, đá phấn, thạch anh, atapungit, monmorilonit hoặc đất diatome, và các vật liệu tổng hợp từ đất như silic oxit phân tán cao, nhôm oxit và silicat; các chất rắn phù hợp loại các hạt nhỏ như: ví dụ, đá tự nhiên nghiền hoặc cắt phân đoạn như canxit, đá hoa, đá bột, sepiolit và dolomit, và cả các hạt kim loại vô cơ và hữu cơ tổng hợp, và các hạt từ vật liệu hữu cơ như giấy, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô và thân cây thuốc lá; các chất nhũ hoá và/hoặc các chất tạo bọt thích hợp là: ví dụ các chất nhũ hóa không ở dạng ion và ở dạng anion như các este của axit béo polyoxyetylen, rượu ete béo polyoxyetylen ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulphonat, alkyl sulphat, arylsulphonat và protein hydrolysat; các chất phân tán thích hợp là các chất không ở dạng ion và/hoặc ở dạng ion thích hợp, ví dụ từ các nhóm chứa rượu-POE- và/hoặc -POP-ete, axit và/hoặc POP-POE este, alkyl aryl và/hoặc POP- POE ete, sản phẩm cộng béo và/hoặc POP-POE, dẫn xuất POE- và/hoặc POP-polyol, sản phẩm cộng POE- và/hoặc POP-sorbitan- hoặc -đường, alkyl hoặc aryl sulphat, alkyl- hoặc arylsulphonat và alkyl hoặc aryl phosphat hoặc các sản

phẩm cộng PO-ete tương ứng. Ngoài ra, các oligo- hoặc polyme thích hợp, ví dụ những chất có nguồn gốc từ các vinylic monome, từ axit acrylic, từ một mình EO và/hoặc PO hoặc kết hợp với, ví dụ, các (đa)rượu hoặc các (đa)amin. Cũng có thể sử dụng linhin và các dẫn xuất axit sulphonie của nó, các xenluloza biến đổi và không biến đổi, các axit sulphonie thơm và/hoặc béo và các sản phẩm cộng của chúng với formaldehyt.

Các chất dính như carboxymetylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp dưới dạng bột, hạt nhỏ hoặc các nhựa mủ, như gôm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, cũng như các phospholipit tự nhiên như xephalin và các lexithin, và các phospholipit tổng hợp, có thể được sử dụng trong các chế phẩm.

Có thể sử dụng các thuốc nhuộm màu như các chất nhuộm màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và chất nhuộm màu xanh phổ, và các thuốc nhuộm màu hữu cơ như các thuốc nhuộm màu alizarin, các thuốc nhuộm màu azo và các thuốc nhuộm màu phthaloxyanin kim loại, các dưỡng chất vi lượng như các muối của sắt, magiê, bo, đồng, coban, molybden và kẽm.

Các phụ gia có thể khác là các chất thơm, các dầu biến tính tùy ý, dầu khoáng và dầu thực vật, các sáp ong và các chất dinh dưỡng (gồm các dinh dưỡng vi chất), như các muối của sắt, magie, bo, đồng, coban, molybden và kẽm.

Các chất ổn định, như các chất ổn định với nhiệt độ thấp, các chất bảo quản, các chất chống oxy hóa, các chất ổn định với ánh sáng hoặc các chất khác nâng cao sự ổn định hóa học và/hoặc vật lý cũng có thể có mặt.

Các công thức thường gồm hợp chất hoạt tính giữa 0,01 và 98% khối lượng, tốt hơn giữa 0,5 và 90 %.

Hợp chất hoạt tính theo sáng chế có thể được sử dụng trong chế phẩm có sẵn trên thương mại của nó và trong dạng sử dụng, được điều chế từ các chế phẩm này ở dạng hỗn hợp với các hợp chất hoạt tính khác như thuốc trừ sâu, chất hấp dẫn côn trùng, chất vô trùng, chất diệt khuẩn, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt nấm, chất điều tiết tăng trưởng, thuốc diệt cỏ, chất an toàn, phân bón hoặc chất truyền tín hiệu.

Một hỗn hợp với các hợp chất hoạt tính đã biết như thuốc diệt cỏ, phân bón, chất điều biến sự tăng trưởng, chất an toàn, chất hóa học mang tín hiệu, hoặc các chất khác nữa để cải thiện tính chất cây trồng, cũng có thể được sử dụng.

Khi sử dụng làm các chất diệt côn trùng, các hợp chất hoạt tính theo sáng chế ngoài ra còn có thể có mặt trong các dạng chế phẩm có sẵn thương mại của chúng và trong các dạng sử dụng, được điều chế từ các chế phẩm này, như một hỗn hợp với các tác nhân đồng vận. Các chất điều phối là các hợp chất làm tăng sự hoạt động của các hợp chất hoạt tính, mà không cần cho tác nhân đồng vận vào để hoạt tính chính nó.

Khi sử dụng làm các chất diệt côn trùng, các hợp chất hoạt tính theo sáng chế ngoài ra còn có thể có mặt trong các dạng chế phẩm có sẵn thương mại của chúng và trong các dạng sử dụng, được điều chế từ các chế phẩm này, như một hỗn hợp với các chất ức chế làm giảm sự thoái hóa của hợp chất sau khi sử dụng trong môi trường của cây trồng, trên bề mặt của các cây hoặc trong các mô cây.

Các dạng thức sử dụng có hàm lượng chất hoạt tính được điều chế từ các công thức có sẵn trên thị trường có thể thay đổi trong phạm vi rộng. Nồng độ hợp chất hoạt tính của các dạng thức sử dụng có thể từ 0,00000001 đến 95% khối lượng các hợp chất hoạt tính, tốt hơn là giữa 0,00001 và 1% khối lượng.

Các hợp chất được sử dụng theo cách thông thường phù hợp cho các dạng sử dụng.

Tất cả các cây trồng và các bộ phận cây trồng có thể được xử lý theo sáng chế. Cây được hiểu ở đây có nghĩa là tất cả các cây và quần thể cây như cây hoang dã mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm cây xuất hiện tự nhiên). Cây trồng có thể là cây mà có thể nhận được bằng các phương pháp gây giống và tối ưu hóa thông thường hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và kỹ thuật di truyền hoặc sự kết hợp của các phương pháp này, gồm cả cây chuyển gen và gồm cả các giống cây mà có thể hoặc không thể được bảo vệ bởi quyền sở hữu giống. Các phần của cây được hiểu với ý nghĩa là tất cả các phần dưới mặt đất và trên mặt đất và các bộ phận của cây, như chồi cây, lá, hoa và rễ, các ví dụ mà có thể được nói đến là lá, gai, cuống, thân cây, hoa, thể quả, quả và hạt và còn rễ, thân củ và thân rễ. Các

phần của cây còn bao gồm vật liệu đã thu hoạch và vật liệu sinh sản và sinh dưỡng, ví dụ cành đâm, củ, thân rễ, cành ghép và hạt giống.

Xử lý theo sáng chế các cây trồng và bộ phận cây trồng với hợp chất hoạt tính được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cho phép các hợp chất tác dụng lên xung quanh, môi trường sống hoặc nơi bảo quản bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng ngâm, phun, làm bay hơi, sương, phân tán, sơn lên, tiêm và trong trường hợp nguyên liệu nhân giống, cụ thể là các hạt, còn áp dụng một hoặc nhiều lớp phủ.

Như đã đề cập ở trên, có thể xử lý tất cả các cây và các bộ phận của chúng theo sáng chế. Theo một phương án ưu tiên, các loại cây đại và các cây trồng hoặc những cây thu được bằng sự gây giống sinh học thông thường, như lai hoặc dung hợp, và các bộ phận của nó, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên nữa, các cây chuyển gen và các cây trồng thu được bằng các phương pháp công nghệ gen, nếu phù hợp thì kết hợp với các phương pháp thông thường (các cơ quan được biến đổi gen) và các bộ phận của nó được xử lý. Các thuật ngữ “các phần”, “các phần của cây” và “các phần cây” đã được giải thích ở trên.

Đặc biệt tốt hơn là, các cây trồng của các cây vụ mùa là trong mỗi trường hợp có sẵn trên thị trường hoặc trong việc sử dụng để xử lý theo sáng chế. Các cây trồng được hiểu theo nghĩa là các cây trồng có các tính chất mới (“tính trạng”) mà chúng được thu được bằng sự gây giống thông thường, bằng sự tổng hợp đột biến hoặc bằng các kỹ thuật tái tổ hợp ADN. Những kỹ thuật này có thể là các kỹ thuật cấy, các kỹ thuật di truyền hoặc các kỹ thuật di truyền sinh học.

Phụ thuộc vào các loài cây hoặc giống cây, vị trí và điều kiện sinh trưởng của chúng (đất trồng, khí hậu, thời kỳ sinh dưỡng, chế độ dinh dưỡng), sự xử lý theo sáng chế có thể cũng gây ra các hiệu ứng siêu tăng cường (“đồng vận”). Do đó, ví dụ, có thể có các tác dụng sau đây mà vượt quá các tác dụng được mong đợi: tỷ lệ áp dụng giảm và/hoặc phổ hoạt tính được mở rộng và/hoặc hoạt tính của các chất hoạt tính và các chế phẩm mà có thể được sử dụng theo sáng chế tăng, cây phát triển tốt hơn, sự chịu đựng của cây trước các nhiệt độ cao hoặc thấp tăng, sự chịu đựng của cây trước hạn hán hoặc độ mặn của nước hoặc đất tăng, hoa ra nhiều hơn, thu hoạch dễ hơn, quả mau chín hơn, sản lượng thu hoạch cao hơn, quả to hơn, cây cao hơn, lá xanh hơn, ra hoa

sớm hơn, chất lượng tốt hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, khả năng bảo quản và/hoặc xử lý các sản phẩm thu hoạch tốt hơn.

Các cây trồng biến đổi gen hoặc việc trồng các cây trồng (thu được bằng kỹ thuật gen) mà ưu tiên được xử lý theo sáng chế gồm tất cả các cây trồng được biến đổi gen nhận được nguyên liệu gen thông thường được truyền các đặc điểm hữu ích, đặc biệt có lợi đối với các cây này. Ví dụ về những đặc tính này là sự sinh trưởng cây trồng tốt hơn, sức chịu đựng được tăng lên đối với các nhiệt độ cao hoặc thấp, sức chịu đựng được tăng lên đối với sự hạn hán hoặc đối với nước hoặc hàm lượng muối trong đất trồng, hiệu suất trồng hoa được tăng lên, việc thu hoạch dễ dàng hơn, sự tăng trưởng nhanh hơn, các lượng thu hoạch cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc các sản phẩm đã được thu hoạch có giá trị dinh dưỡng cao hơn, tính ổn định khi tích trữ và/hoặc khả năng gia công chế biến các sản phẩm đã thu hoạch được tốt hơn. Ví dụ khác và đặc biệt được nhấn mạnh về các đặc tính này là tính tự vệ tốt hơn của các cây trồng để chống lại các động vật và bộ gây hại như chống lại các côn trùng, các con bét, ve, nấm gây bệnh, vi khuẩn và/hoặc các virus, ngoài ra sức chịu đựng được tăng lên của các cây trồng đối với các hợp chất hoạt tính diệt cỏ đã biết. Ví dụ của các cây trồng chuyển đổi gen có thể được đề cập là các cây trồng vụ mùa rất quan trọng như các cây ngũ cốc (lúa mì, gạo), ngô, đậu tương, khoai tây, cây củ cải đường, cà chua, cây đậu Hà Lan và các loại thực vật khác, cây bông, thuốc lá, cây dầu cải và còn có các cây trồng ăn quả (như các cây táo, các cây lê, các cây nho và các cây giống cam quýt), và đặc biệt là các cây như ngô, các cây đậu tương, các cây khoai tây, các cây bông, các cây thuốc lá và các cây dầu cải. Các trạng được nhấn mạnh cụ thể là khả năng tự vệ của các cây trồng chống lại các côn trùng, động vật thuộc lớp nhện, giun tròn và động vật thân mềm, nhờ các độc tố được hình thành trong các cây trồng, cụ thể là chúng được hình thành trong các cây bằng các vật liệu gen từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả các hỗn hợp của nó) (được đề cập dưới đây là “các cây Bt”). Những tính trạng mà cũng được nhấn mạnh cụ thể là khả năng tự vệ của các cây trồng được tăng lên để chống lại nấm, vi khuẩn và các virus bằng kích thích tính kháng bệnh lưu dẫn (SAR), hormone thực vật, các chất kháng sinh có nguồn gốc từ cây cỏ, các chất kích kháng bệnh thực vật, và các gen có tính kháng bệnh và các protein được ép ra tương ứng và các độc tố. Những tính trạng được nhấn mạnh cụ thể hơn nữa

là khả năng chống chịu của các cây trồng đối với các hợp chất hoạt tính diệt cỏ đã biết, ví dụ imidazolinon, sulphonylureas, glyphosat hoặc photphinotricin (ví dụ gen “PAT”) được tăng lên. Các gen truyền các đặc điểm mong muốn có thể cũng được thể hiện kết hợp với gen khác trong các cây trồng biến đổi gen. Các ví dụ “các cây trồng Bt” được đề cập đến là các loại ngô, các loại cây bông, các loại đậu tương và các loại khoai tây- ở dạng rắn có tên thương mại YIELD GARD® (ví dụ ngô, cây bông, đậu tương), KnockOut® (ví dụ ngô), StarLink® (ví dụ ngô), Bollgard® (cây bông), Nucotn® (cây bông) và NewLeaf® (khoai tây). Các ví dụ của các cây trồng có khả năng chịu được thuốc diệt cỏ có thể được nói đến là các loại ngô, các loại cây bông, và các loại đậu tương- dạng rắn có tên thương mại Roundup Ready® (khả năng chịu thuốc glyphosat, ví dụ ngô, cây bông, đậu tương), Liberty Link® (khả năng chịu thuốc photphinotricin, ví dụ cây dầu hạt cải), IMI® (khả năng chịu thuốc imidazolinon) và STS® (khả năng chịu thuốc sunphonylure, ví dụ ngô). Các cây trồng có tính kháng thuốc diệt cỏ (các cây trồng sinh ra theo một cách thức thông thường để chịu thuốc diệt cỏ) có thể được nói đến gồm các loại được bán dưới nhãn hiệu Clearfield® (ví dụ ngô). Tất nhiên, những báo cáo này cũng có thể được áp dụng cho các cây trồng có những tính trạng di truyền này hoặc những tính trạng di truyền vẫn đang được phát triển, mà các cây này có thể được phát triển và/hoặc đưa ra thị trường trong tương lai.

Các cây trồng đã nêu có thể được xử lý theo sáng chế theo sáng chế với các hợp chất có công thức tổng quát (I) hoặc các hỗn hợp hợp chất hoạt tính theo sáng chế. Các khoảng ưu tiên đã nêu ở trên đối với các hợp chất hoặc các hỗn hợp hoạt tính cũng có thể được áp dụng để xử lý các cây trồng này. Sự nhấn mạnh đặc biệt là xử lý các cây trồng với các hợp chất hoặc các hỗn hợp được nói đến cụ thể trong tài liệu này.

Các hợp chất hoạt tính theo sáng chế tác dụng không chỉ chống lại các vật gây hại cây, khu vực vệ sinh và sản phẩm bảo quản mà còn trong lĩnh vực thú y chống lại các động vật ký sinh (ký sinh ngoài và ký sinh trong), như ve cứng, ve mềm, bọ ghẻ, rệp lá, sâu bệnh (cắn và liếm), ấu trùng sâu bệnh ký sinh, rận, chấy, rận da và bọ chét. Các con ký sinh này gồm:

Từ loại Anoplurida, ví dụ vi khuẩn *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.

Từ bộ Mallophagida và các phân bộ Amblycerina và Ischnocerina, ví dụ Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp. và Felicola spp.

Từ bộ côn trùng hai cánh và các phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp. và Melophagus spp.

Từ bộ Siphonapterida, ví dụ, Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp. và Ceratophyllus spp.

Từ bộ the Heteropterida, ví dụ, Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp. và Panstrongylus spp.

Từ bộ Blattarida, ví dụ, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, và Supella spp.

Từ phân lớp Acari (Acarina) và các bộ Meta- và Mesostigmata, ví dụ, Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp.

Từ bộ Actinedida (Prostigmata) và Acaridida (Astigmata), ví dụ, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp. và Laminosioptes spp.

Các hợp chất hoạt tính có công thức (I) theo sáng chế cũng thích hợp để kiểm soát các động vật chân đốt tràn vào phá hoại vật nuôi hữu ích nông nghiệp, như ví dụ, gia súc, cừu, dê, ngựa, lợn, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, gà, gà tây, vịt, ngỗng và ong, các con vật nuôi khác như, ví dụ, chó, mèo, chim lồng và cá cảnh, và các con vật được gọi là động vật thử nghiệm, như, ví dụ, chuột đồng, chuột lang, chuột nhắt và chuột. Bằng cách kiểm soát các động vật chân đốt này, trường hợp chết và giảm khả năng sản xuất (cho thịt, sữa, len, da sống, trứng, mật v.v...) được giảm đi, vì thế việc chăn nuôi động vật dễ dàng hơn và kinh tế hơn là có thể bằng cách sử dụng các hợp chất hoạt tính theo sáng chế.

Các hợp chất hoạt tính theo sáng chế được dùng trong lĩnh vực thú y và quản lý động vật theo một cách đã biết bằng cách đưa vào theo đường tiêu hóa, ví dụ dạng thuốc viên, dạng con nhộng, thuốc độc, liều thuốc lớn, dạng hạt nhỏ, dạng bột nhão, dạng viên to, đưa vào theo con đường thức ăn và dạng thuốc đạn (nhét vào hậu môn), bằng cách tiến hành ở ngoài ruột ví dụ như tiêm (tiêm vào cơ, tiêm vào dưới da, tiêm vào tĩnh mạch và tương tự), cấy dưới da, qua đường mũi, bằng cách dùng ngoài da ở các dạng ví dụ như tắm hay tẩy, phun, đổ vào và đánh dấu, làm sạch và làm nhỏ, và cùng với sự hỗ trợ của các vật thể được đúc để chứa các hợp chất hoạt tính, như vòng cổ, các nhãn hiệu ở tai, các nhãn hiệu ở đuôi, các nẹp ở chi, các dây thông lưng, các dụng cụ đánh dấu và tương tự.

Khi được sử dụng cho vật nuôi, gia cầm và động vật nuôi trong nhà và các động vật tương tự, các hợp chất hoạt tính có công thức (I) có thể được áp dụng như các chế phẩm (ví dụ bột, nhũ tương, chất có thể chảy được) bao gồm các hợp chất hoạt tính với lượng từ 1 đến 80% theo trọng lượng, trực tiếp hoặc sau khi pha loãng 100 đến 10 000 lần, hoặc chúng có thể được sử dụng như một bể dung dịch hóa học.

Ngoài ra được thấy là các hợp chất theo sáng chế cũng có tác dụng diệt côn trùng mạnh chống lại các côn trùng phá hủy các vật liệu công nghiệp.

Các con côn trùng sau đây có thể được đề cập đến làm các ví dụ và được ưu tiên hơn-mà không có sự hạn chế:

Bọ cánh cứng như *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

Loài bướm Dermapteran, như *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

Mối như *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*;

Các con bọ dài đuôi, như *Lepisma saccharina*.

Vật liệu công nghiệp được đề cập được hiểu theo nghĩa là các vật liệu không sống, như, ưu tiên, chất dẻo, chất kết dính, hồ, giấy, bìa cát tông, da, gỗ và các sản phẩm chế biến từ gỗ và các chất tổng hợp phủ ngoài.

Nếu phù hợp, các chế phẩm sử dụng ngay có thể còn gồm thêm các loại thuốc trừ sâu khác và, nếu phù hợp, có thêm một hoặc nhiều thuốc diệt nấm.

Đối với các thành phần trộn khác, tham khảo thuốc trừ sâu và diệt nấm đã nêu ở trên.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng đồng thời cùng một lúc để bảo vệ các đối tượng tiếp xúc với nước biển hoặc nước mặn, như các thân tàu thủy, các lưới bảo vệ, các mạng lưới, các tòa nhà, các dây chèo và các hệ thống báo hiệu, để chống lại sự tích tụ bẩn.

Ngoài ra, các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng một mình hoặc trong tổ hợp với các hợp chất hoạt tính khác là các chế phẩm chống gỉ.

Các hợp chất hoạt tính cũng phù hợp cho việc kiểm soát các động vật gây hại trong lĩnh vực nuôi gia súc trong nhà, trong vệ sinh và trong bảo vệ các sản phẩm lưu

kho, cụ thể là các côn trùng, các động vật thuộc lớp nhện và các con bét ve được tìm thấy trong các không gian khép kín, như, ví dụ các nhà ở, các phòng ở nhà máy, các cơ quan, các khoang xe tải và những nơi giống như thế. Chúng có thể được sử dụng một mình hoặc kết hợp với các hợp chất hoạt tính và các chất phụ trợ trong các sản phẩm thuốc diệt côn trùng gia đình để kiểm soát các vật gây hại. Chúng có hoạt tính chống lại các loài nhạy cảm và có tính kháng và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển. Những vật gây hại gồm:

Từ lớp Scorpionidea, ví dụ *Buthus occitanus*

Từ bộ bét-nhóm tiết túc gồm con ve, con tích, con bét, ví dụ *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.

Từ bộ nhện lưới, ví dụ *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Từ bộ chôn chôn, ví dụ *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Từ bộ chân đều thuộc động vật giáp xác, ví dụ *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Từ phân lớp chân kép, ví dụ *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Từ lớp chân môi, ví dụ *Geophilus* spp.

Từ lớp Zygentoma, ví dụ *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Từ lớp Blattaria, ví dụ *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panclora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Từ lớp Saltatoria, ví dụ *Acheta domesticus*.

Từ bộ cánh da, ví dụ *Forficula auricularia*

Từ bộ cánh đều, ví dụ *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp

Từ bộ có răng, ví dụ *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Từ bộ Cánh cứng, ví dụ, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

Từ bộ côn trùng hai cánh, ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

Từ bộ bướm, ví dụ *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Từ bộ bộ chết, ví dụ *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

Từ bộ cánh màng, ví dụ *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

Từ bộ Chấy rận, ví dụ, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

Từ bộ cánh nửa, ví dụ *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

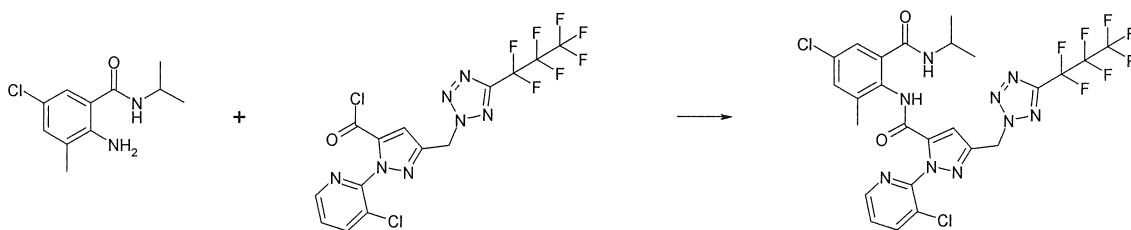
Trong lĩnh vực diệt sâu bọ trong gia đình, chúng được sử dụng một mình hay kết hợp với các hợp chất phù hợp khác, như các este của axit phosphoric, các carbamat, các pyrethroid, các neonicotinoid, các chất điều khiển sự phát triển hay các hợp chất hoạt tính từ các lớp khác của các thuốc diệt sâu bọ đã biết.

Chúng được sử dụng trong các bình phun, các sản phẩm phun không áp, ví dụ máy bơm và các máy phun nguyên tử hóa, các hệ tạo mù tự động, các máy tạo mù, tạo các bột, tạo dạng chất đặc quánh (gel), các sản phẩm bay hơi được làm từ xelulơ hoặc nhựa từ các băng lắng giàn bay hơi, các giàn bay hơi lỏng, các giàn bay hơi chất đặc quánh (gel) và màng, các giàn bay hơi cánh quạt gió, các hệ thống giàn bay hơi, thụ động, hoặc năng lượng tự do, các giấy nhậy, các cái túi nhậy, và các chất đặc quánh dạng gel nhậy như các dạng hạt nhỏ hoặc các dạng bụi, các môi để giải hoặc trong các trạm bẫy môi.

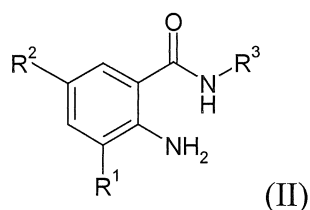
Giải thích quy trình và chất trung gian

Quy trình (A)

Sử dụng, ví dụ, 2-amino-5-clo-*N*-isopropyl-3-metylbenzamid và 2-(3-clopyridin-2-yl)-5-(5-heptafloropropyltetrazol-2-ylmetyl)-2*H*-pyrazol-3-cacbonyl clorua làm nguyên liệu ban đầu, tiến triển của quy trình (A) có thể được minh họa bằng sơ đồ công thức dưới đây.



Công thức (II) cho định nghĩa chung về các aminobenzamid cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (A).



Trong công thức (II), R^1 , R^2 và R^3 có ý nghĩa đã nêu ở trên,

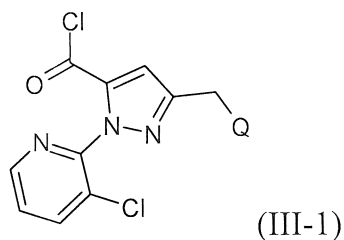
Quy trình (A) được thực hiện trong sự có mặt của axit liên kết. Thích hợp cho mục đích này là tất cả các bazơ vô cơ hoặc hữu cơ thông thường cho các phản ứng ghép. Ưu tiên sử dụng các hydrit, hydroxit, amit, alkoxit, axetat, cacbonat hoặc

bicacbonat của kim loại kiềm thổ hoặc kim loại kiềm, như ví dụ natri hydrua, natri amit, lithi diisopropylamit, natri metoxit, natri etoxit, kali tert-butoxit, natri hydroxit, kali hydroxit, natri axetat, natri cacbonat, kali cacbonat, kali bicacbonat, natri bicacbonat hoặc amoni cacbonat, và các tertiary amin, như trimetylamin, trietylamin, tributylamin, diisopropyletylamin, N,N-dimetylanilin, N,N-dimetylbenzylamin, pyridin, N-metylpiperidin, N-metylmorpholin, N,N-dimetylaminopyridin, diazabixyclooctan (DABCO), diazabixyclononen (DBN) hoặc diazabixycloundecen (DBU). Cũng có thể tùy ý sử dụng các chất liên kết axit được hỗ trợ polyme như ví dụ diisopropylamin được hỗ trợ polyme và dimetylaminopyridin được hỗ trợ polyme.

Quy trình (A) có thể, nếu thích hợp, được thực hiện trong sự có mặt của chất làm loãng hữu cơ trơ thông thường cho các phản ứng này. Ưu tiên bao gồm các hydrocacbon béo, vòng béo, hoặc thơm như ví dụ ete dầu mỏ, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin; các hydrocacbon được halogen hóa, như ví dụ, clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloform, cacbon tetraclohua, dicloetan hoặc tricloetan; ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl tert-butyl ete, metyl tert-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, 1,2-dietoxyetan hoặc anisol; các keton, như axeton, butanon, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon; các nitril như axetonitril, propionitril, n- hoặc isobutyronitril hoặc benzonitril; các amit, như N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit, N-metylformanilid, N-metylpyrrolidon hoặc hexametylphosphoric triamit, hoặc các hỗn hợp của chúng với nước hoặc nước tinh khiết.

Các aminobenzamit có công thức (II) đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết (tham khảo, ví dụ, M. J. Kornet, *J. Heterocycl. Chem.* 1992, 29, 103-105; G. P. Lahm và cộng sự, *Bioorg. Med. Chem. Letters* 2005, 15, 4898-4906; WO 2003/016284, WO 2006/055922, WO 2006/062978, WO 2008/010897, WO 2008/070158).

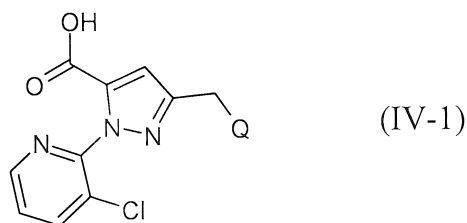
Công thức (III-1) cho định nghĩa chung về các pyrazolcacbonyl clorua cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (A).



Trong công thức (III-1) này, Q có nghĩa đã nêu ở trên,

Pyrazolcacbonyl clorua có công thức (III-1) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của dẫn xuất axit pyrazolcarboxylic có công thức (IV-1)

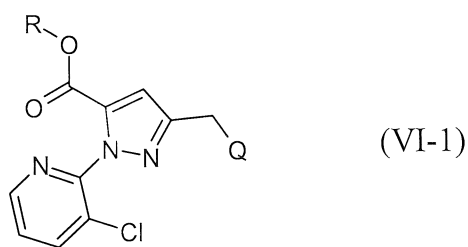


trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên,

với chất clo hóa (ví dụ thionyl clorua hoặc oxalyl clorua) trong sự có mặt của chất làm loãng trơ (ví dụ toluen hoặc diclometan) trong sự có mặt của lượng xúc tác chứa N,N-dimetylformamit.

Dẫn xuất axit pyrazolcarboxylic có công thức (IV-1) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của pyrazolecarboxylic este có công thức (VI-1)

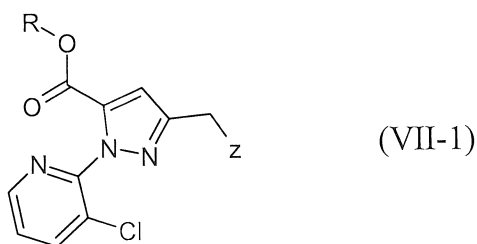


trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên và R là C₁-C₆-alkyl,

với hydroxit kim loại kiềm (ví dụ natri hydroxit hoặc kali hydroxit) trong sự có mặt của chất làm loãng trơ (ví dụ dioxan/nước hoặc etanol/nước).

Pyrazolcarboxylic este có công thức (VI) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của dẫn xuất pyrazolcarboxylic este có công thức (VII-1)



trong đó R có nghĩa đã nêu ở trên và Z là clo, brom, iot, metylsulphonyl hoặc toluensulphonyl, với tetrazol có công thức (VIII) trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên, trong sự có mặt của bazơ, (ví dụ natri hydroxit, kali cacbonat, natri cacbonat, caesi cacbonat, natri metoxit, trietylamin hoặc natri hydrua) trong sự có mặt của dung môi (ví dụ tetrahydrofuran, toluen, axeton, axetonitril, metanol, dimetylformamit hoặc dioxan).

Q-H (VIII)

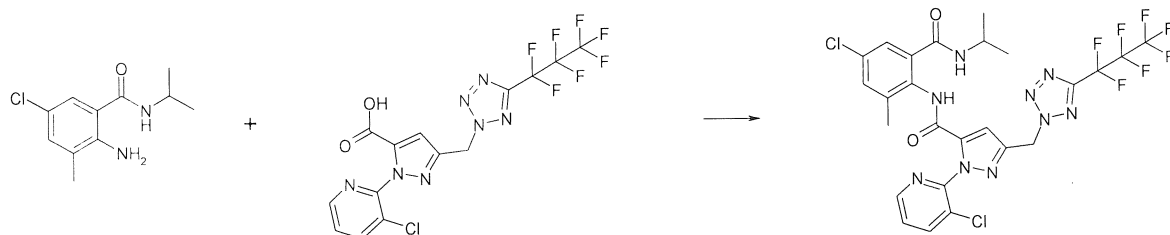
Các tetrazol có công thức (VIII) đã được biết, một số thậm chí có sẵn trong thương mại, hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết (tham khảo, ví dụ WO2004/020445; William P. Norris, *J. Org. Chem.*, **1962**, 27 (9), 3248-3251; Henry C. Brown, Robert J. Kassal, *J. Org. Chem.*, **1967**, 32 (6), 1871-1873; Dennis P. Curran, Sabine Hadida, Sun-Young Kim, *Tetrahedron*, **1999**, 55 (29), 8997-9006; L.D. Hansen, E.J. Baca, P. Scheiner, *Journal of Heterocyclic Chemistry*, **1970**, 7, 991-996).

Dẫn xuất pyrazolcarboxylic este có công thức (VII) đã biết hoặc có thể thu được bằng các quy trình đã biết (tham khảo, ví dụ WO2007/144100)

Quy trình (B)

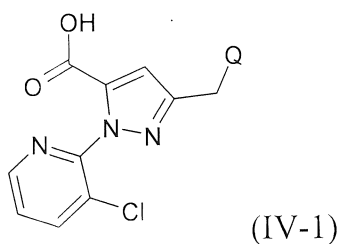
Sử dụng, ví dụ, 2-amino-5-clo-N-isopropyl-3-metylbenzamid và axit 2-(3-clopyridin-2-yl)-5-(5-heptafloropropyltetrazol-2-ylmetyl)-2H-pyrazol-3-carboxylic làm

nguyên liệu ban đầu, tiến trình của quy trình (B) có thể được minh họa bằng sơ đồ công thức ở dưới.



Các anthranilamit có công thức (II) cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (B) đã được mô tả kết hợp với quy trình (A).

Công thức (IV-1) cho định nghĩa chung về các axit pyrazolcarboxylic cần thêm làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (B).



Trong công thức (IV-1) này, Q có nghĩa đã nêu ở trên,

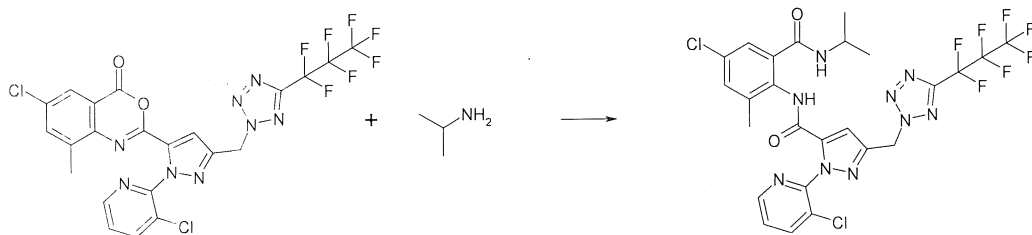
Quy trình (B) được thực hiện trong sự có mặt của chất ngưng tụ. Thích hợp cho mục đích này là tất cả các chất thông thường cho các phản ứng ghép. Các chất tạo axit halogenua như phosgen, phospho tribromua, phospho trichlorua, phospho pentachlorua, phospho oxycloclorua hoặc thionyl clorua; các chất tạo anhydrit, như etyl cloformat, metyl cloformat, isopropyl cloformat, isobutyl cloformat hoặc metansulphonyl clorua; carbodiimitt, như N,N'-dicyclohexylcarbodiimitt (DCC) hoặc các chất ngưng tụ thông thường khác như phospho pentoxit, axit polyphosphoric, 1,1'-cacbonyldiimidazol, 2-etoxy-N-etoxyacbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/cacbon tetrachlorua, bromotripyrrolidinophosphoni hexaflophosphat, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl) phosphin clorua hoặc benzotriazol-1-yloxytris(dimethylamino)phosphoni hexaflophosphat có thể được đề cập qua ví dụ. Các chất phản ứng được hỗ trợ polyme như ví dụ xyclohexylcarbodiimitt được hỗ trợ polyme, cũng có thể được sử dụng.

Quy trình (B), nếu phù hợp, được thực hiện trong sự có mặt của chất xúc tác. 4-Dimethylaminopyridin, 1-hydroxybenzotriazol hoặc dimetylformamit có thể được đề cập qua ví dụ.

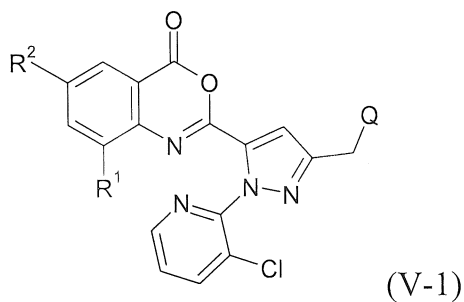
Quy trình (B) có thể, nếu thích hợp, được thực hiện trong sự có mặt của chất làm loãng hữu cơ trơ thông thường cho các phản ứng này. Ưu tiên bao gồm các hydrocacbon béo, vòng béo, hoặc thơm như ví dụ ete dầu mỏ, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin; các hydrocacbon được halogen hóa, như ví dụ, clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloform, cacbon tetraclorea, dicloetan hoặc tricloetan; ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl tert-butyl ete, metyl tert-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, 1,2-dietoxyetan hoặc anisol; các keton, như axeton, butanon, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon; các nitril như axetonitril, propionitril, n- hoặc isobutyronitril hoặc benzonitril; các amit, như N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylxetamit, N-metylformanilid, N-metylpyrrolidon hoặc hexametylphosphoric triamit, hoặc các hỗn hợp của chúng với nước hoặc nước tinh khiết.

Quy trình (C)

Sử dụng 6-clo-2-[2-(3-clopyridin-2-yl)-5-(5-heptaflopropyltetrazol-2-ylmetyl)-2H-pyrazol-3-yl]-8-metylbenzo[d][1,3]oxazin-4-on và isopropylamin, tiến trình của quy trình (C) có thể được minh họa bằng sơ đồ công thức ở dưới.

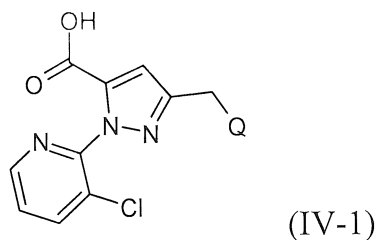


Công thức (V-1) cho định nghĩa chung về các benzoxazinon cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (C).



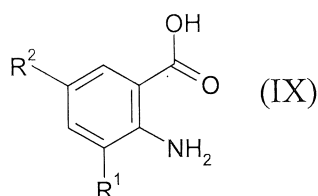
Trong công thức (II), R^1 , R^2 và Q có nghĩa đã nêu ở trên.

Benzoxazinon có công thức (V-1) là mới. Chúng có thể thu được, ví dụ, bằng phản ứng của dẫn xuất axit pyrazolcarboxylic có công thức (IV-1)



trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên,

với các axit anthranilic có công thức (IX)



trong đó R^1 và R^2 có nghĩa đã nêu ở trên, trong sự có mặt của bazơ (ví dụ triethylamin hoặc pyridin) và trong sự có mặt của sulphonyl clorua (ví dụ metansulphonyl clorua) và, nếu thích hợp, trong sự có mặt của chất làm loãng (ví dụ axetonitril).

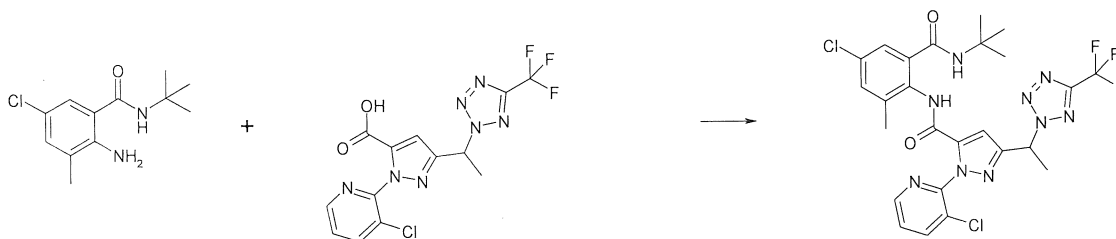
Dẫn xuất axit pyrazolecarboxylic có công thức (IV-1) cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình đã được mô tả kết hợp với quy trình (A).

Các anthranilic có công thức (IX) đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp tổng hợp chung (tham khảo, ví dụ, Baker và cộng sự. *J. Org. Chem.* 1952, 149-153; G. Reissenweber et al., *Angew. Chem* 1981, 93, 914-915, P.J.

Montoya-Pelaez, *J. Org. Chem.* 2006, 71, 5921-5929; F. E. Sheibley, *J. Org. Chem.* 1938, 3, 414-423, WO 2006023783).

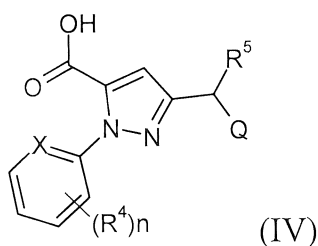
Quy trình (D)

Sử dụng, ví dụ, 2-amino-N-tert-butyl-5-clo-3-metylbenzamid và axit 1-(3-clopyridin-2-yl)-3-{1-[5-(triflometyl)-2H-tetrazol-2-yl]etyl}-1H-pyrazol-5-carboxylic làm nguyên liệu ban đầu, tiến trình của quy trình (D) có thể được minh họa bằng sơ đồ công thức ở dưới..



Các anthranilamid có công thức (II) cần làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (D) đã được mô tả kết hợp với quy trình (A).

Công thức (IV) cho định nghĩa chung về các axit pyrazolcarboxylic cần thêm làm nguyên liệu ban đầu để thực hiện quy trình (D).



Trong công thức (IV) này, X, Q, R⁴, R⁵ và n có nghĩa đã nêu ở trên.

Quy trình (D) được thực hiện trong sự có mặt của chất ngưng tụ. Thích hợp cho mục đích này là tất cả các chất thông thường cho các phản ứng ghép. Các chất tạo axit halogenua như phosgen, phospho tribromua, phospho trichlorua, phospho pentachlorua, phospho oxycloclorua hoặc thionyl clorua; các chất tạo anhydrit, như etyl cloformat, metyl cloformat, isopropyl cloformat, isobutyl cloformat hoặc metansulphonyl clorua; carbodiimitt, như N,N'-dixyclohexylcarbodiimitt (DCC) hoặc các chất ngưng tụ thông thường khác như phospho pentoxit, axit polyphosphoric, 1,1'-cacbonyldiimidazol, 2-

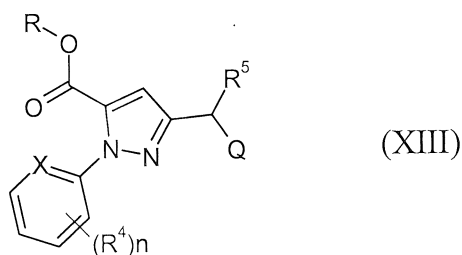
etoxy-N-etoxyacetyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/cacbon tetraclorua, bromotripyrrolidinophosphoni hexaflophosphat, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphin clorua hoặc benzotriazol-1-yloxytris(dimethylamino)phosphoni hexaflophosphat có thể được đề cập qua ví dụ. Các chất phản ứng được hỗ trợ polyme như ví dụ xyclohexylcarbodiimide được hỗ trợ polyme, cũng có thể được sử dụng.

Quy trình (D), nếu phù hợp, được thực hiện trong sự có mặt của chất xúc tác. 4-Dimethylaminopyridin, 1-hydroxybenzotriazol hoặc dimethylformamid có thể được đề cập qua ví dụ.

Quy trình (D) có thể, nếu thích hợp, được thực hiện trong sự có mặt của chất làm loãng hữu cơ trợ thông thường cho các phản ứng này. Ưu tiên bao gồm các hydrocacbon béo, vòng béo, hoặc thơm như ví dụ ete dầu mỏ, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin; các hydrocacbon được halogen hóa, như ví dụ, clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloform, cacbon tetraclorua, dicloetan hoặc tricloetan; ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl tert-butyl ete, metyl tert-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, 1,2-dietoxyetan hoặc anisol; các keton, như axeton, butanon, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon; các nitril như axetonitril, propionitril, n- hoặc isobutyronitril hoặc benzonitril; các amit, như N,N-dimethylformamid, N,N-dimethylaxetamid, N-methylformanilid, N-methylpyrrolidon hoặc hexamethylphosphoric triamid, hoặc các hỗn hợp của chúng với nước hoặc nước tinh khiết.

Axit pyrazolcarboxylic có công thức (IV) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của pyrazolcarboxylic este có công thức (XIII)

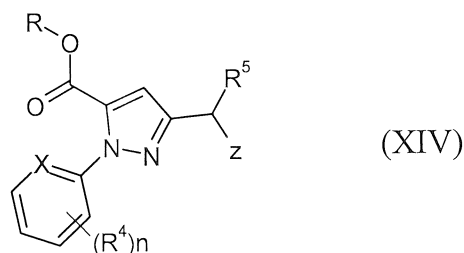


trong đó X, Q, R⁴, R⁵ và n có nghĩa đã nêu và R là C₁-C₆-alkyl,

với hydroxit kim loại kiềm (ví dụ natri hydroxit hoặc kali hydroxit) trong sự có mặt của chất làm loãng trơ (ví dụ dioxan/nước hoặc etanol/nước).

Pyrazolcarboxylic este có công thức (XIII) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của dẫn xuất pyrazolcarboxylic este có công thức (XIV)



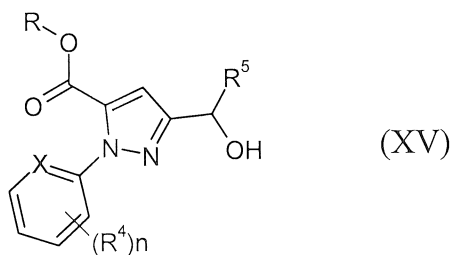
trong đó X, Q, R, R₄, R₅ và n có nghĩa đã nêu ở trên và Z là clo, brom, iot, metylsulphonyl hoặc toluensulphonyl, với tetrazol có công thức (VIII) trong đó Q có nghĩa đã nêu ở trên, trong sự có mặt của bazơ, (ví dụ natri hydroxit, kali cacbonat, natri cacbonat, caesi cacbonat, natri metoxit, trietylamin hoặc natri hydrua) trong sự có mặt của dung môi (ví dụ tetrahydrofuran, toluen, axeton, axetonitril, metanol, dimethylformamit hoặc dioxan).

Q-H (VIII)

Các tetrazol có công thức (VIII) đã được biết, một số thậm chí có sẵn trong thương mại, hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết (tham khảo, ví dụ WO2004/020445; William P. Norris, *J. Org. Chem.*, **1962**, 27 (9), 3248-3251; Henry C. Brown, Robert J. Kassal, *J. Org. Chem.*, **1967**, 32 (6), 1871-1873; Dennis P. Curran, Sabine Hadida, Sun-Young Kim, *Tetrahedron*, **1999**, 55 (29), 8997-9006; L.D. Hansen, E.J. Baca, P. Scheiner, *Journal of Heterocyclic Chemistry*, **1970**, 7, 991-996).

Pyrazolcarboxylic este có công thức (XIV) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

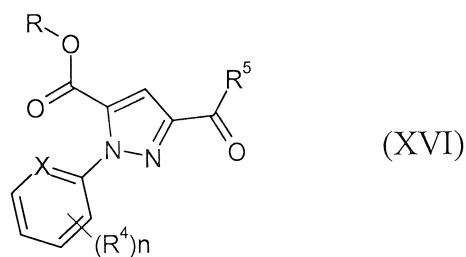
phản ứng của dẫn xuất rượu có công thức (XIII)



trong đó X, R, R⁴, R⁵ và n có nghĩa đã nêu ở trên, với sulphonyl clorua (ví dụ metylsulphonyl clorua hoặc toluensulphonyl clorua) hoặc chất halogen hóa (ví dụ thionyl clorua), nếu thích hợp trong sự có mặt của dung môi (ví dụ diclometan) và, nếu phù hợp, trong sự có mặt của bazơ (ví dụ trietylamin hoặc pyridin).

Dẫn xuất rượu có công thức (IV-1) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

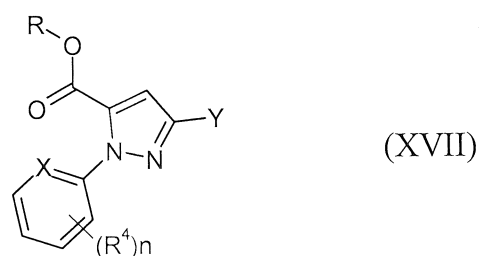
phản ứng của dẫn xuất keton có công thức (XVI)



trong đó X, R, R⁴, R⁵ và n có nghĩa đã nêu ở trên, với chất khử thích hợp (ví dụ natri borohydrit) trong sự có mặt của dung môi (ví dụ etanol).

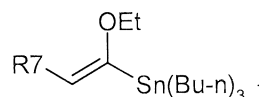
Dẫn xuất keton có công thức (XVI) là mới. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng

phản ứng của dẫn xuất pyrazol có công thức (XVII)



trong đó X, R, R⁴ và n có nghĩa đã nêu ở trên, và Y là clo hoặc brom, với dẫn xuất thiếc có công thức (XVIII) trong đó R⁷ là H hoặc C₁-C₃-alkyl trong sự có mặt của kim loại chuyển tiếp (ví dụ tetrakis(triphenylphosphin)paladi(0)) và muối (ví dụ lithi clorua) trong sự có mặt của dung môi (ví dụ tetrahydrofuran).

(XVIII)



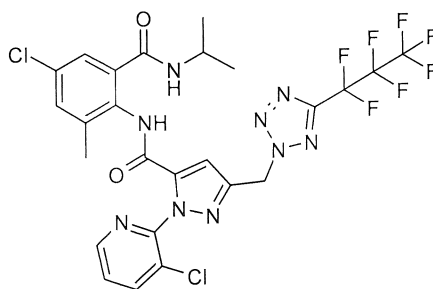
Dẫn xuất của hợp chất có công thức (XVII) đã được biết và/hoặc có sẵn trên thị trường.

Dẫn xuất pyrazol có công thức (XVII) đã được biết hoặc có thể thu được bằng các quy trình đã biết (tham khảo, ví dụ, WO2004/033468, WO2003/015518, WO2003/016283).

Ví dụ thực hiện sáng chế

Hợp chất:

Tổng hợp 4-clo-2-isopropylcarbamoyl-6-metylphenyl)amit của axit 2-(3-clopyridin-2-yl)-5-(5-heptafloropropyltetrazol-2-ylmetyl)-2H-pyrazol-3-carboxylic ((Ví dụ 1)

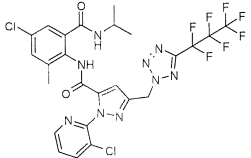
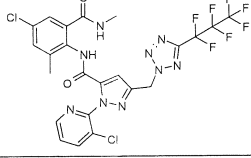
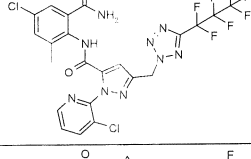
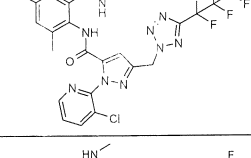
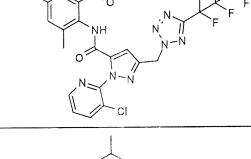
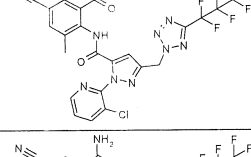
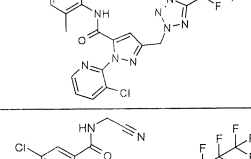
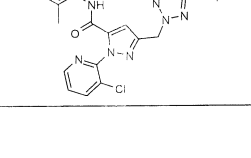


200mg (0,3mmol) 6-clo-2-[2-(3-clopyridin-2-yl)-5-(5-heptafloropropyltetrazol-2-ylmetyl)-2H-pyrazol-3-yl]-8-metylbenzo[d][1,3]oxazin-4-on đầu tiên được cho vào 2ml tetrahydrofuran, và 0,08ml (1mmol) isopropylamin được thêm vào. Hỗn hợp được khuấy ở 50°C trong 1 giờ và được cô đặc sau khi làm mát. Tinh chế phân dư bằng sự kết tinh hoặc phân tách sắc ký cho ra sản phẩm mong muốn (logP: 4,23, MH⁺: 682, ¹H-NMR (400 MHz, DMSO, δ, ppm): 1,02 (d, 6H), 2,14 (s, 3H), 3,91 (m, 1H), 6,30 (s,

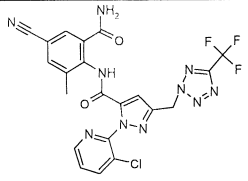
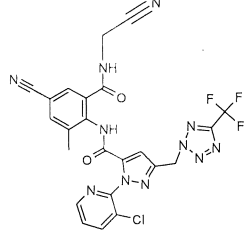
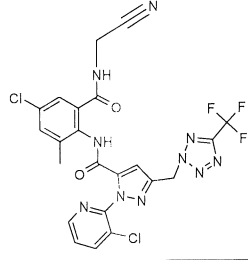
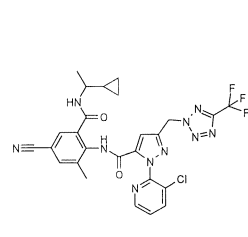
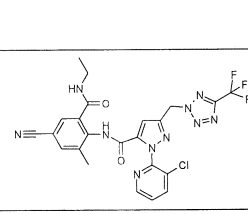
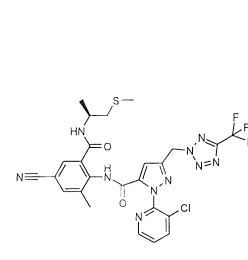
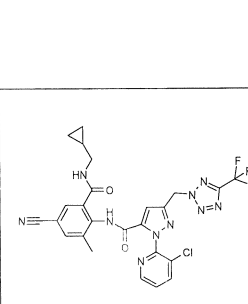
2H), 7,30 (m, 2H), 7,40 (d, 1H), 7,55 (dd, 1H), 7,77 (d, 1H), 8,08 (dd, 1H), 8,44 (dd, 1H), 10,07 (s, 1H).

Các ví dụ sau đây có thể thu được theo phương pháp tương tự:

Đối với ví dụ 1, các tín hiệu NMR hoàn chỉnh, và đối với các ví dụ khác, tổ hợp của giá trị logP, khối lượng (MH^+) và các tín hiệu NMR mà chỉ gốc phân tử được đưa cuối cùng vào quy trình.

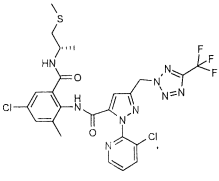
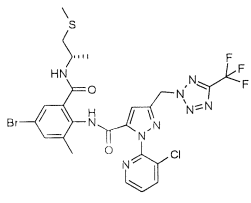
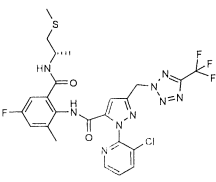
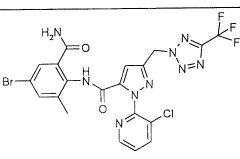
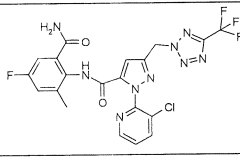
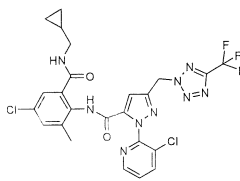
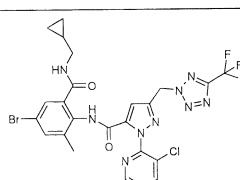
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH^+	NMR
1		4,23	682	DMSO: 1,02 (d, 6H, $NHCH(CH_3)_2$), 3,91 (m, 1H, $NHCH(CH_3)_2$)
2		3,75	654	DMSO: 2,67 (d, 3H, $NHCH_3$)
3		3,49	640	DMSO: 7,40 (bs, 2H, NH_2)
4		3,96	680	DMSO: 0,43 (m, 2H, $NHCH(CH_2)_2$), 0,60 (m, 2H, $NHCH(CH_2)_2$), 2,69 (m, 1H, $NHCH(CH_2)_2$)
5		3,43	645	DMSO: 2,68 (d, 3H, $NHCH_3$)
6		3,82	673	DMSO: 1,04 (d, 6H, $NHCH(CH_3)_2$), 3,92 (m, 1H, $NHCH(CH_3)_2$)
7		3,17	631	DMSO: 7,43 (bs, 1H, NH_2), 7,67 (bs, 1H, NH_2)
8		3,65	679	DMSO: 4,15 (d, 2H, $NHCH_2CN$)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
9		3,50	580 (M-H ⁺)	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
10		3,07	571 (M-H ⁺)	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
11		3,05	552 (M-H ⁺)	DMSO: 2m67 (d, 3H, NHCH ₃)
12		2,66	545	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
13		2,84	569 (M-H ⁺)	CD ₃ CN: 0,53 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,72 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,77 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
14		3,28	617, MH ⁺	CD ₃ CN: 1,22 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,61 (d, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 4,16 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
15		3,40	585 (M-H ⁺)	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
16		2,77	540	CD ₃ CN: 6,30 (bs, 2H, NH ₂)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
17		2,45	531	CD ₃ CN: 6,33 (bs, 1H, NH ₂), 6,85 (bs, 1H, NH ₂)
18		2,61	570	CD ₃ CN: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
19		2,93	579	CD ₃ CN: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
20		3,33	599	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (dd, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
21		2,85	559	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,17 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
22		3,27	619	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,49 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,57 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 4,00 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
23		3,13	585	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,03 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

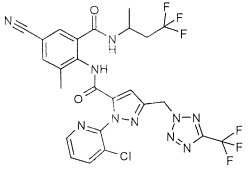
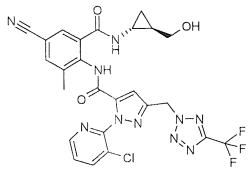
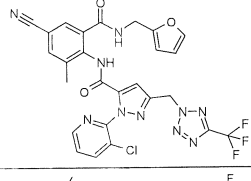
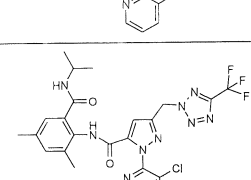
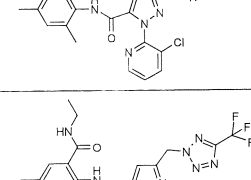
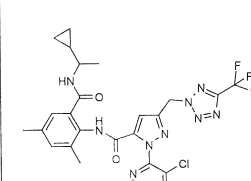
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
24		3,18	585	DMSO: 1,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,95 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,15 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
25		3,23	580	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
26		3,30	624	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
27		2,87	564	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
28		3,05	598	DMSO: 2,63 (d, 3H, NHCH ₃)
29		2,66	538	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
30		3,79	608	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
31		3,89	652	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
32		3,41	592	DMSO: 0,08-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				(d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
33		3,23	568	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
34		3,32	612	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
35		2,88	552	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
36		3,74	596	DMSO: 0,75 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 0,96 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,30-1,39 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,69-3,74 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)
37		3,78	596	DMSO: 0,79 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,67-1,76 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,94-2,97 (dd, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
38		3,37	587	DMSO: 0,81 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,69-1,75 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,95-2,97 (dd, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
39		3,57	626	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
40		3,11	566	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
41		3,68	628	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃)
42		3,77	672	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃)
43		3,31	612	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,16 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,44 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃)
44		2,81	584	DMSO: 7,32 (bs, 1H, NH ₂), 7,53 (bs, 1H, NH ₂)
45		2,46	524	DMSO: 7,37 (bs, 2H, NH ₂)
46		3,53	594	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
47		3,88	638	DMSO: 0,10 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂),

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
57		3,18	600	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
58		3,17	588	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
59		2,92	599	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
60		3,78	616	DMSO: 1,26 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
61		3,41	602	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
62		3,51	614	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,87 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,11 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,18 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
63		3,47	614	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,99 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
64		3,62	648	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,00 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,44 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,53 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
65		3,21	646	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
66		3,47	660	DMSO: 1,0 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
67		2,95	632	DMSO: 7,1 (bs, 1H, NH ₂), 7,1 (bs, 1H, NH ₂)
68		4,01	700	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
69		3,46	672	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
70		3,14	671	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
71		3,73	674	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
72		3,85	686	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,91 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,12 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,21 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
73		3,78	686	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
74		3,90	720	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,10 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,49 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
75		3,38	641	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃), 2,24-2,37 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃), 4,12-4,17 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃)
76		2,39	601	DMSO: 0,58-0,65 (m, 2H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 1,11-1,20 (m, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 2,60-2,64 (m, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 3,28-3,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 4,22 (t, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH)
77		3,14	611	DMSO: 4,34 (d, 2H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,22 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,31 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 7,46 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O)
78		2,81	534	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
79		3,29	562	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
80		2,62	520	DMSO: 7,24 (bs, 2H, NH ₂)
81		3,06	548	DMSO: 1,10 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
82		3,59	588	DMSO: 0,08-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
83		3,35	574	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,02 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
84		3,42	574	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,89 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,14 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,24 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
85		2,83	559	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
86		3,50	608	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,36 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,99 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
87		3,65	625	DMSO: 0,21 (m, 6H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,7, (m, 2H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,91 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 2,96 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
88		3,50	653	
89		3,46	599	
90		3,63	613	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 1,72-2,01 (m, 6H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 2,39 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 3,06

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				(m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃)
91		2,91	595	DMSO: 3,52 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,88 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
92		2,73	589	DMSO: 3,18 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,27- 3,68 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)
93		3,96	627	DMSO: 0,82-1,63 (m, 11H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅), 3,00 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅)
94		2,71	631	DMSO: 1,21-1,49 (m, 8H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH), 3,19 (t, 1H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH), 3,37 (m, 4H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH)
95		3,12	617	DMSO: 1,02 (s, 6H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,04 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,20 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃)
96		2,90	569	DMSO: 2,94 (t, 1H, NHCH ₂ C≡CH), 3,94 (m, 2H, NHCH ₂ C≡CH)
97		3,32	587	DMSO: 0,78 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,00 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,33- 1,42 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,71- 3,78 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)
98		2,95	603	DMSO: 1,01 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃), 3,18 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃), 3,27-3,30 (m 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃),

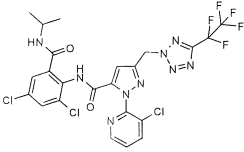
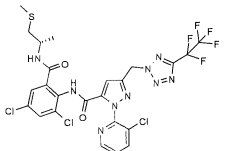
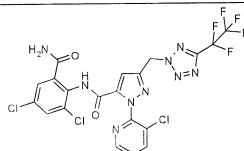
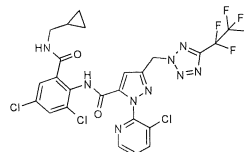
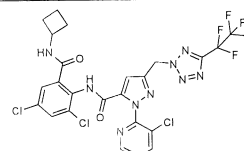
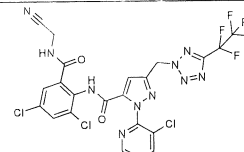
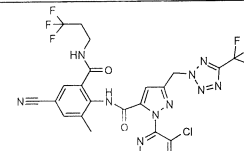
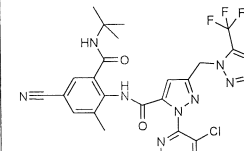
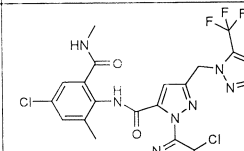
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				3,97-4,03 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃)
99		3,09	611	DMSO: 4,19 (d, 2H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,27 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,37 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 7,46 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O)
100		3,44	575	DMSO: 1,1 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
101		2,62	533	DMSO: 2,63 (d, 3H, NHCH ₃)
102		2,15	517	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
103		3,02	542	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
104		2,52	526	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
105		2,93	559	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
106		2,76	540	CD ₃ CN: 6,30 (bs, 2H, NH ₂)
107		4,60	696	CD ₃ CN: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
117		3,74	671	DMSO: 0,81 (t, 3H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 1,39-1,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 3,92 (d, 2H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 4,03 (m, 1H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃)
118		4,12	688	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
119		3,04	560	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
120		3,86	771	CD ₃ CN: 4,13 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
121		4,86	788	CD ₃ CN: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
122		3,33	670	CD ₃ CN: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
123		1,63	574	
124		1,63	588	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂), 2,69 (t, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂), 3,23 (t, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂)
125		3,39	604	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

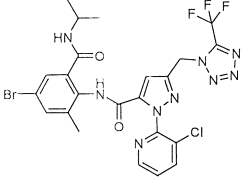
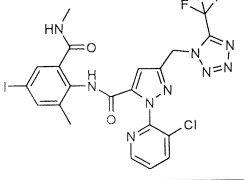
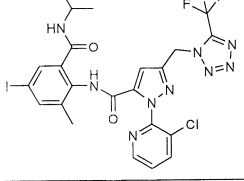
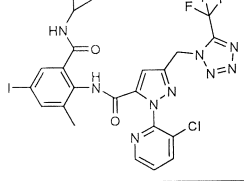
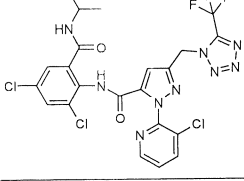
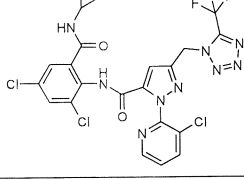
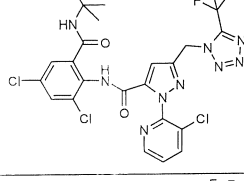
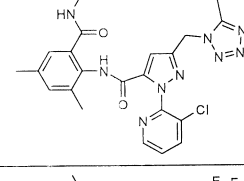
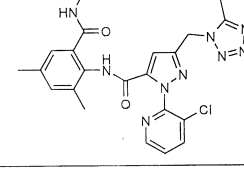
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
126		4,25	658	DMSO: 0,09-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
127		3,70	630	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
128		3,65	618	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
129		3,94	632	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
130		3,15	590	DMSO: 7,29-7,58 (bs, 2H, NH ₂)
131		3,93	644	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,29 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,00 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
132		4,03	644	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,89 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,08 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
133		3,32	629	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
134		3,84	649	DMSO: 0,09-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
135		3,55	623	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
136		3,86	637	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
137		2,83	581	DMSO: 7,44 (bs, 1H, NH ₂), 7,70 (bs, 1H, NH ₂)
138		3,56	635	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,78 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,90 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
139		3,61	635	DMSO: 1,64 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,93 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
140		3,64	695	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
141		4,42	750	DMSO: 0,10-0,48 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,29 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
142		4,19	723	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
143		3,50	647	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
144		4,29	702	DMSO: 0,10-0,48 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
				(d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
145		3,74	674	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
146		3,95	676	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
147		3,09	588	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
148		3,80	642	DMSO: 0,10-0,35 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,03 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,31 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
149		3,59	616	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
150		4,12	678	DMSO: 0,10-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,29 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
151		3,57	650	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
152		3,57	638	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,18 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
153		3,81	652	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
154		4,02	698	DMSO: 1,07 (dd, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,01 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
155		3,13	610	DMSO: 7,41 (bs, 1H, NH ₂), 7,51 (bs, 1H, NH ₂)
156		3,88	664	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
157		3,92	664	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,90 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,12 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,18 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
158		3,32	649	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
159		3,22	627	DMSO: 2,42 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃), 3,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃)
160		3,05	587	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
161		2,63	554	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

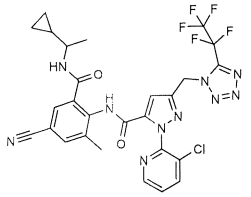
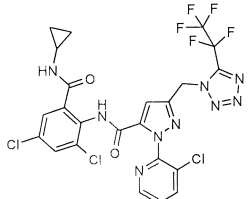
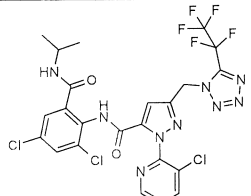
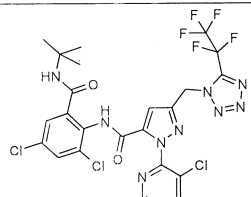
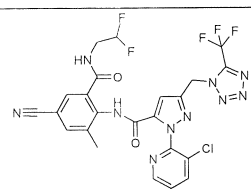
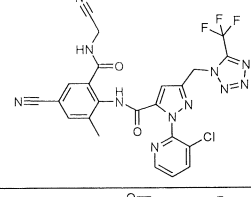
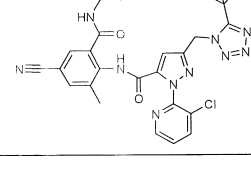
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
162		3,12	582	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
163		2,89	580	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
164		2,29	645	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
165		2,72	573	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
166		2,53	571	DMSO: 0,45 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
167		2,32	538	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
168		2,76	566	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
169		2,57	564	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
170		2,72	598	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
171		3,22	626	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
172		2,86	646	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
173		3,36	674	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
174		3,12	672	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
175		3,08	602	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
176		2,85	600	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
177		3,43	616	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
178		2,48	534	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
179		2,94	562	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

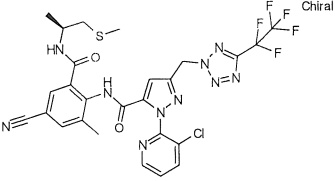
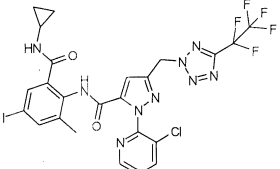
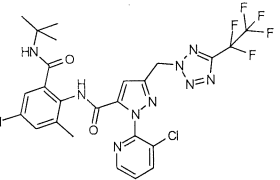
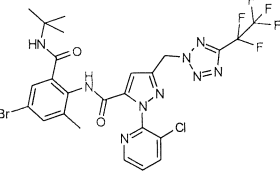
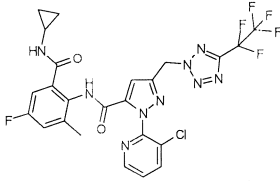
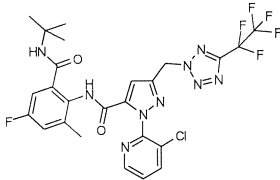
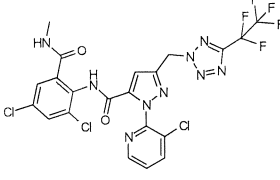
Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
180		2,71	560	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
181		2,99	624	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
182		3,62	640	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
183		3,74	688	DMSO: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
184		2,63	574	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
185		3,00	599	DMSO: 0,14-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,35 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
186		2,83	585	DMSO: 1,65 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,91 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,15 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,23 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
187		2,48	569	DMSO: 2,94 (t, 1H, NHCH ₂ C≡CH), 3,94 (m, 2H, NHCH ₂ C≡CH)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
188		2,88	627	DMSO: 2,40 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃), 3,35 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃)
189		2,74	617	DMSO: 1,02 (s, 6H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,04 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,22 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃)
190		3,16	654	
191		2,50	559	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
192		2,12	531	DMSO: 7,45 (bs, 1H, NH ₂), 7,70 (bs, 1H, NH ₂)
193		2,92	619	DMSO: 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,18 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,56 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
194		3,25	613	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 1,72-2,01 (m, 6H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 3,10 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
195		3,26	628	DMSO: 1,05-1,81 (m, 11H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅), 3,62 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅)
196		3,28	625	DMSO: 0,18-0,41 (m, 8H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,92 (m, 2H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 3,02 (m, 1H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂)
197		3,47	596	CD ₃ CN: 1,30 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
198		3,10	604	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
199		3,88	658	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
200		3,32	630	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
201		3,59	632	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
202		3,14	623	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
203		3,48	649	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
204		3,24	650	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
205		3,52	652	DMSO: 1,06 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
206		3,88	666	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
207		2,57	595	DMSO: 3,52 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,88 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
208		2,31	570	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
209		2,40	589	DMSO: 3,18 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,27- 3,37 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)

Ví dụ số	Cấu trúc	logP	MH ⁺	NMR
210		3,01	620	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
211		2,99	603	DMSO: 1,05 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃), 3,27-3,40 (m, 6H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃)
212		4,09	678	DMSO: 1,08 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
213		3,05	595	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
214		3,26	621	DMSO: 0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,71 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
215		3,24	609	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

216		3,68	669	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,21 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
217				DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
218		4,50	738	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
219		4,36	690	DMSO: 1,28 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
220		3,30	614	DMSO: 0,42 (d, 6H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
221		3,88	630	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
222		3,34	624	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)

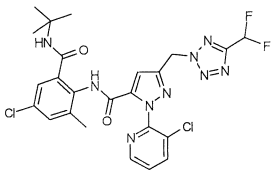
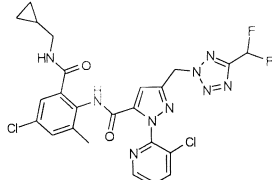
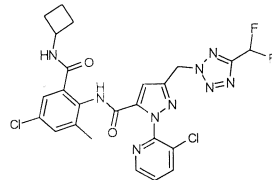
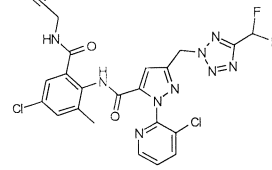
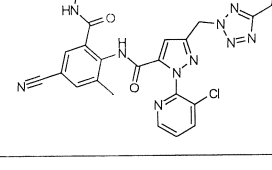
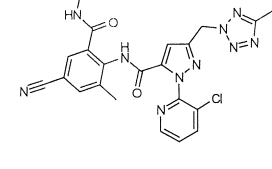
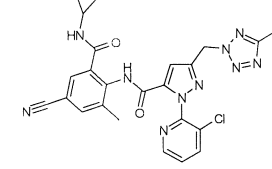
223		4,16	666	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
224		4,00	630	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
225		3,39	614	DMSO: 0,40-0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,62-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
226		3,16	588	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
227		3,64	616	DMSO: 0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
228		3,28	632	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
229		3,52	658	DMSO: 0,37-0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,62-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

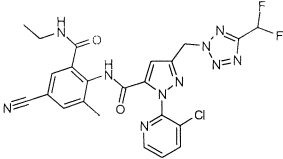
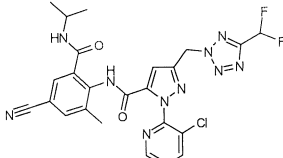
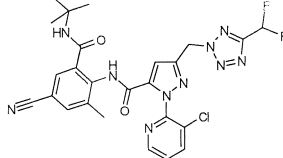
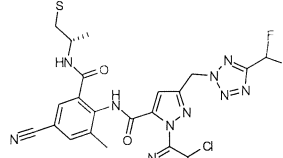
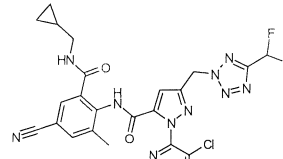
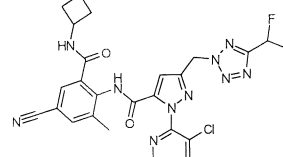
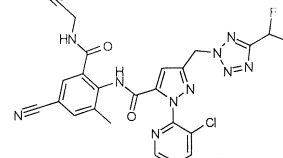
230		2,72	562	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
231		2,95	564	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,87 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
232		3,59	621	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
233		3,07	605	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
234		3,07	593	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
235		3,28	607	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,84-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
236		2,67	565	DMSO: 7,56 (bs, 1H, NH ₂), 7,85 (bs, 1H, NH ₂)

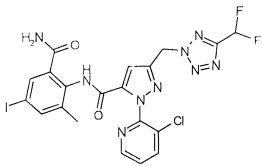
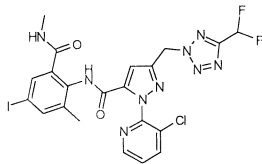
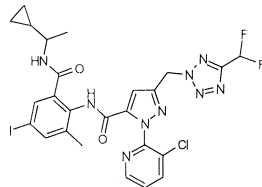
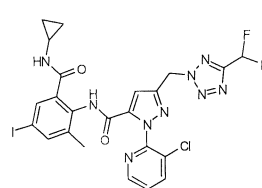
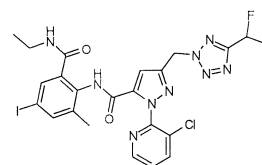
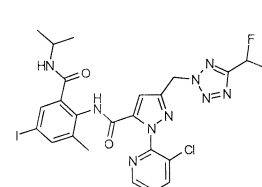
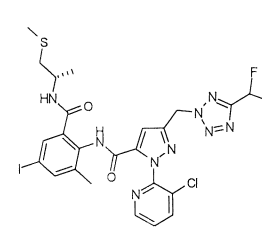
237		3,43	602	DMSO: 0,96 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
238		2,97	574	DMSO: 7,46 (bs, 1H, NH ₂), 7,70 (bs, 1H, NH ₂)
239		3,97	588	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
240			705	DMSO: 4,13 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
241			694	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
242		4,25	722	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
243		3,90	707	DMSO: 0,97 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,83-3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

244		3,52	647	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
245		4,13	675	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
246			706	DMSO: 0,40-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
247		3,40	680	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
248		3,21	657	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
249		3,76	660	0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,83-3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
250		3,16	666	DMSO: 7,33 (bs, 1H, NH ₂), 7,42 (bs, 1H, NH ₂)

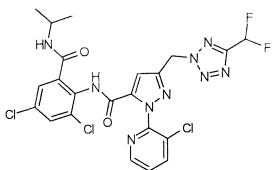
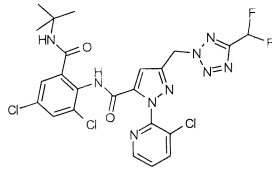
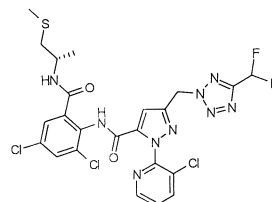
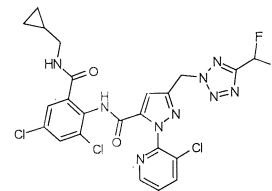
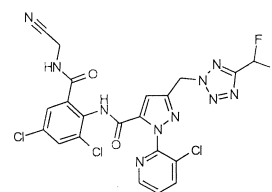
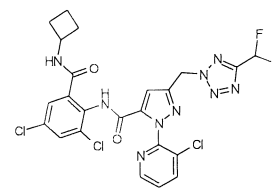
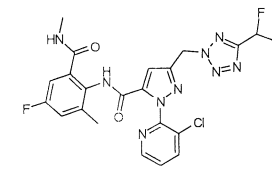
251		3,04	619	DMSO: 7,31 (bs, 1H, NH ₂), 7,54 (bs, 1H, NH ₂)
252		3,28	613	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
253		2,81	604	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
254		3,60	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
255		2,46	536	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
256		3,24	590	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
257		2,69	550	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

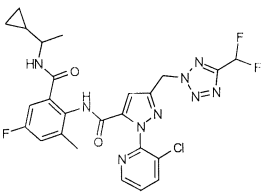
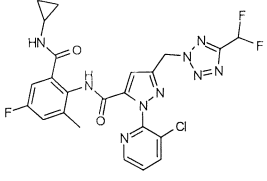
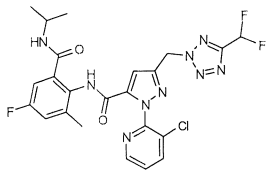
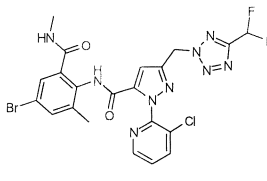
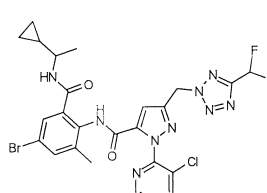
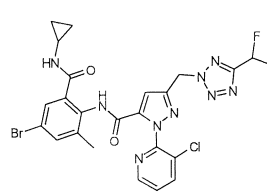
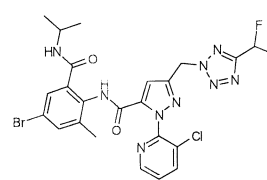
258		3,32	578	DMSO: 1,21 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
259		3,04	576	DMSO: 0,12 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,32 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,90 (m, 1H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,01 (t, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
260		3,09	576	DMSO: 1,62 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 1,93 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 2,11 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 4,23 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$)
261		2,50	561	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH_2CN)
262		2,17	527	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH_3)
263		2,86	581	DMSO: 0,12-0,38 (m, 4H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,84 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 1,07 (d, 3H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,39 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
264		2,39	553	DMSO: 0,42 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 0,58 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 2,67 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$)

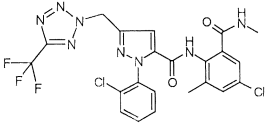
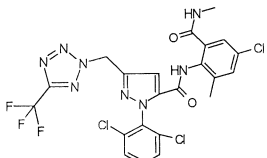
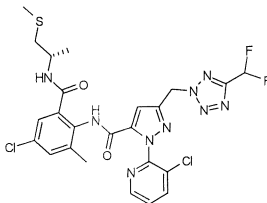
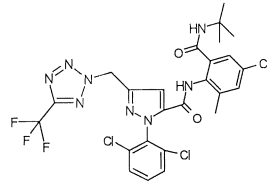
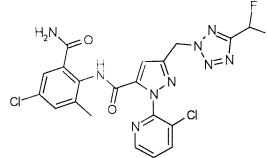
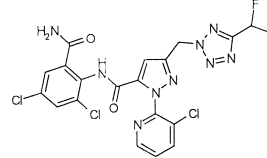
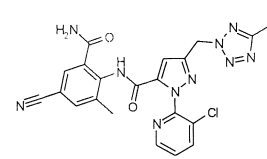
265		2,36	541	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
266		2,58	555	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
267		2,88	569	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
268		2,77	601	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,21 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,58 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
269		2,66	567	DMSO: 0,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,90 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,03 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
270		2,70	567	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,94 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
271		2,19	552	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

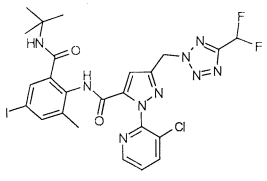
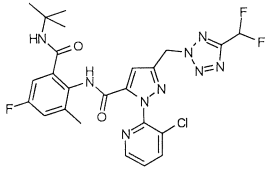
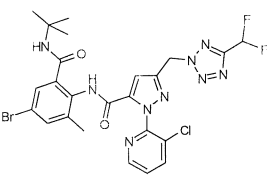
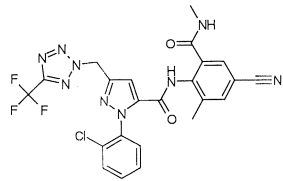
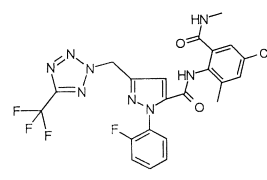
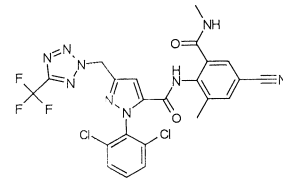
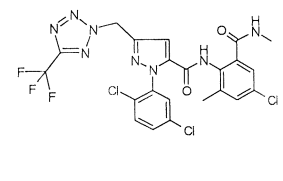
272		2,53	614	DMSO: 7,25-7,60 (bs, 2H, NH ₂)
273		2,73	628	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
274		3,52	682	DMSO: 0,09-0,41 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
275		2,96	654	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
276		2,98	642	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
277		3,20	656	DMSO: 1,07 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
278		3,41	702	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,12 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,56 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)

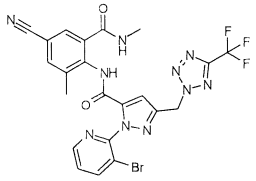
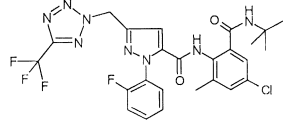
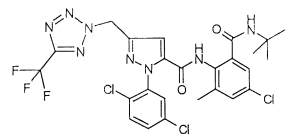
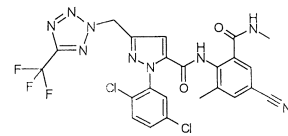
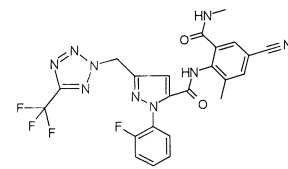
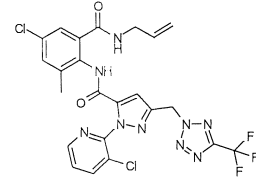
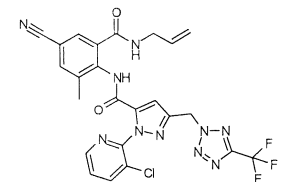
279		3,27	668	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,32 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,10 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
280		3,34	668	DMSO: 1,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,90 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
281		2,68	653	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
282		2,48	556	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
283		3,23	610	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
284		2,70	582	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
285		2,70	570	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

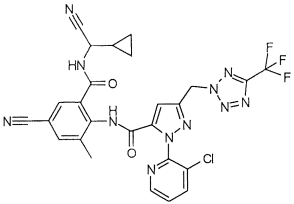
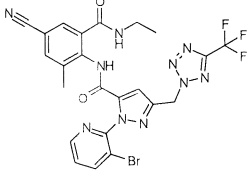
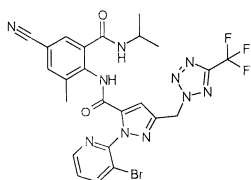
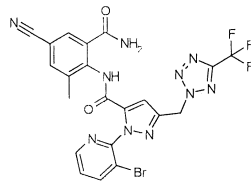
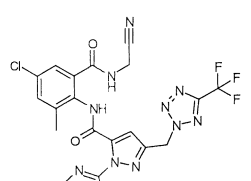
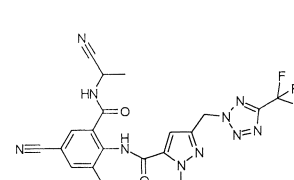
286		2,91	584	DMSO: 1,01 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,89 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
287		3,28	598	DMSO: 1,21 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
288		3,13	630	DMSO: 1,07 (d, 3H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$), 2,00 (s, 3H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$), 2,45 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$), 2,55 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$), 3,94 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$)
289		3,01	596	DMSO: 0,10 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,30 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,85 (m, 1H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 2,99 (t, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
290		2,48	581	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH_2CN)
291		3,06	596	DMSO: 1,62 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 1,89 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 2,13 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$), 4,20 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_3$)
292		2,21	520	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH_3)

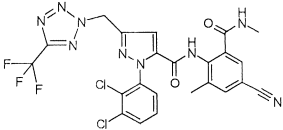
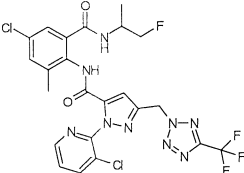
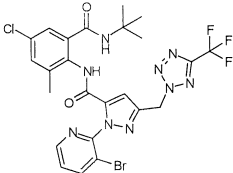
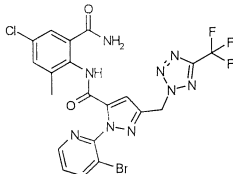
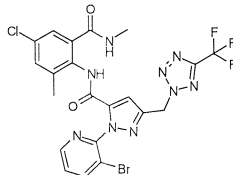
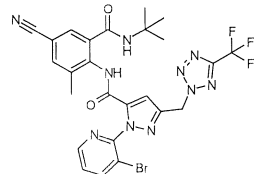
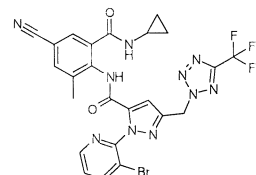
293		2,92	574	DMSO: 0,11-0,40 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
294		2,41	546	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
295		2,64	548	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
296		2,61	580	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
297		3,36	634	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
298		2,85	606	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
299		3,08	608	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

300		3,47	554	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
301		3,32	588	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
302		3,18	610	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,45 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
303		4,50	630	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
304		2,32	522	DMSO: 7,23-7,60 (bs, 2H, NH ₂)
305		2,31	542	DMSO: 7,34-7,60 (bs, 2H, NH ₂),
306		1,97	513	DMSO: 7,35-7,52 (bs, 1H, NH ₂), 7,60- 7,80 (bs, 1H, NH ₂)

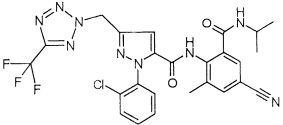
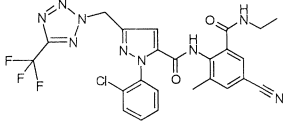
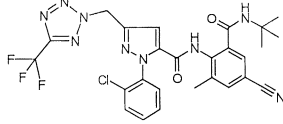
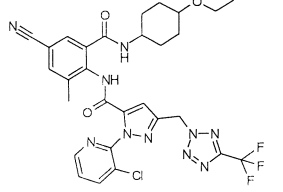
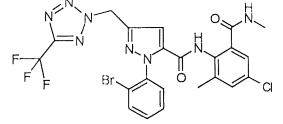
307		3,50	670	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
308		2,90	562	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
309		3,36	622	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
310		3,09	544	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
311		3,32	537	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
312		3,28	579	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
313		3,93	588	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

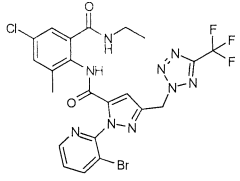
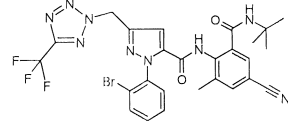
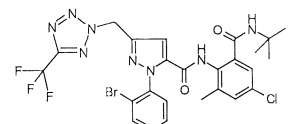
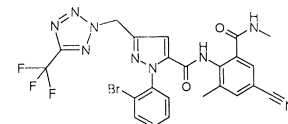
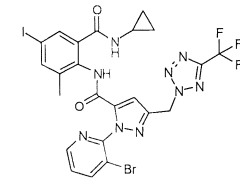
314		2,58	589	DMSO: 2,79 (d, 3H, NHCH ₃)
315		4,17	588	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
316		4,77	630	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
317		3,48	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
318		2,92	528	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
319		3,34	581	DMSO: 4,99 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,13 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,71-5,79 (m, 1H, NHCH ₂ CH=CH ₂)
320		2,97	572	DMSO: 5,01 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,13 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,71-5,80 (m, 1H, NHCH ₂ CH=CH ₂)

321		3,05	610	DMSO: 0,26-0,58 (m, 4H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂), 1,26 (m, 1H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂), 4,39 (m, 1H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂),
322		2,88	603	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
323		3,10	617	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89-3,95 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
324		2,46	575	DMSO: 7,45 (bs, 1H, NH ₂), 7,70 (bs, 1H, NH ₂)
325		2,72	623	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
326		2,76	584	DMSO: 1,37 (d, 3H, NHCH(CN)CH ₃), 4,78 (m, 1H, NHCH(CN)CH ₃)

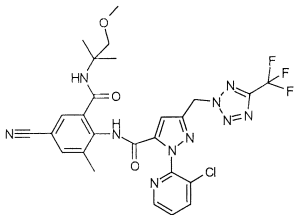
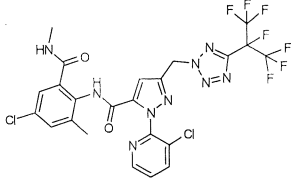
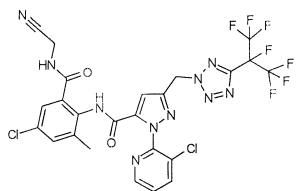
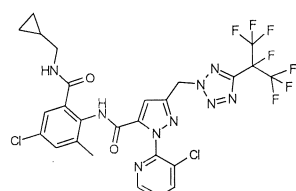
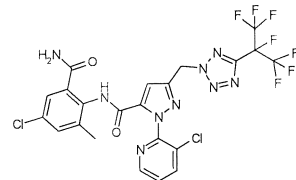
327		3,40	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
328		3,30	601	DMSO: 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ F), 4,06-4,36 (m, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ F)
329		3,88	640	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
330		2,76	584	DMSO: 7,30 (bs, 1H, NH ₂), 7,50 (bs, 1H, NH ₂)
331		3,01	598	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
332		3,43	631	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
333		2,85	616	DMSO: 0,40-0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,64-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

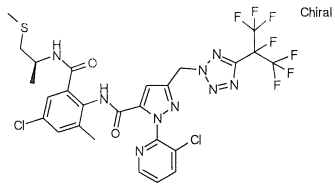
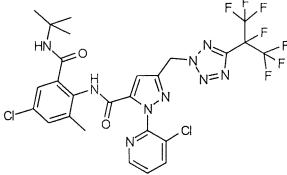
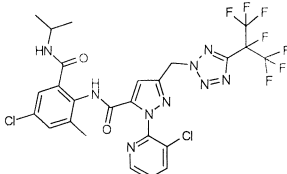
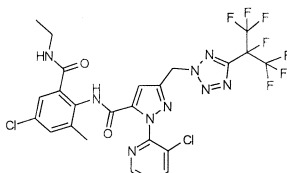
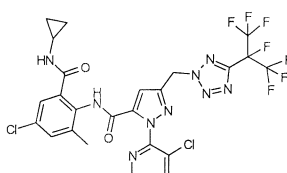
334		3,49	626	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88-3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
335		3,25	624	DMSO: 0,43-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,72 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
336		2,36	598	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
337		3,62	595	DMSO: 1,63 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 3,69 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 4,74 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)
338		3,21	585	DMSO: 1,64 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 3,70 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 4,76 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)
339		3,89	700	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
340		3,00	640	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

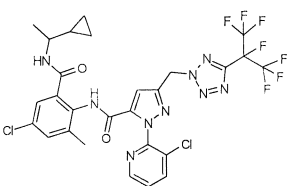
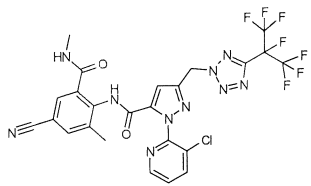
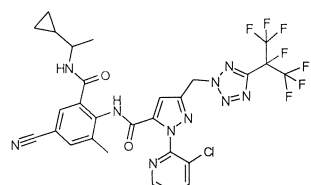
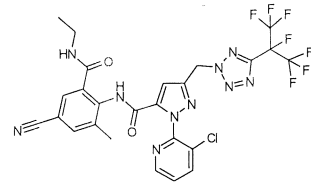
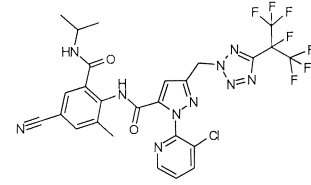
341		3,60	572	DMSO: 1,03-1,04 (m, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90-3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
342		3,36	558	DMSO: 1,01-1,02 (m, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,17-3,19 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
343		3,92	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
344		3,60	658	DMSO: 1,11 (t, 3H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 1,40-1,55 (m, 8H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 1,72-1,76 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 3,42 (q, 2H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 3,65-3,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃)
345		3,50	598	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

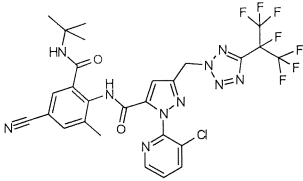
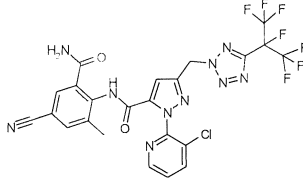
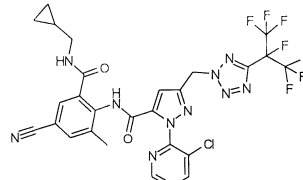
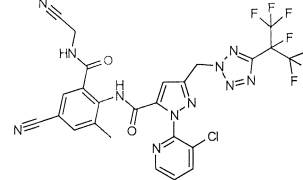
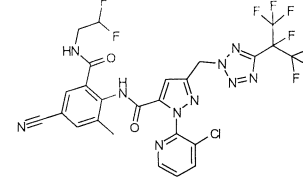
346		3,23	613	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,14 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
347		3,95	631	DMSO: 1,19 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
348		4,43	641	DMSO: 1,18 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
349		3,15	590	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH_3)
350		3,45	716	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 0,55-0,61 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 2,63-2,70 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$)

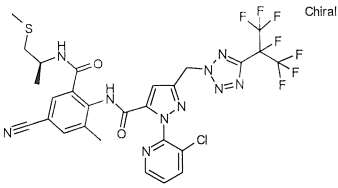
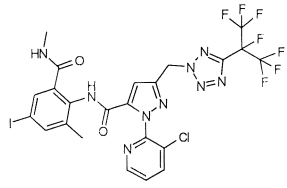
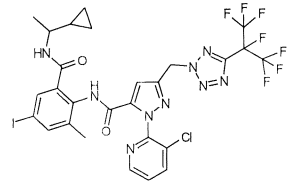
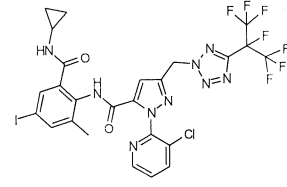
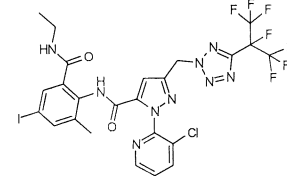
351		2,95	676	DMSO: 7,42 (bs, 1H, NH ₂), 7,70 (bs, 1H, NH ₂)
352		4,09	732	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
353		2,82	628	DMSO: 7,45 (bs, 1H, NH ₂), 7,72 (bs, 1H, NH ₂)
354		3,12	643	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
355		3,66	670	DMSO: 0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

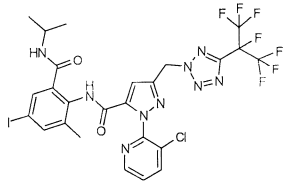
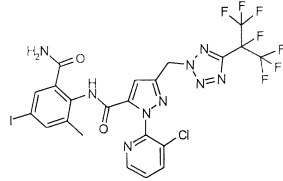
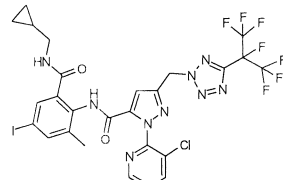
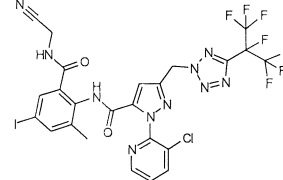
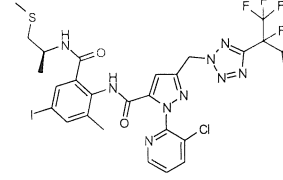
356		3,29	617	CD ₃ CN: 1,29 (s, 6H, NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,21 (s, 3H, , NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,38 (s, 2H, NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃)
357		3,72	654	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
358		3,62	679	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
359		4,26	694	DMSO: 0,10 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
360		3,46	640	CD ₃ CN: 6,20 (bs, 1H, NH ₂), 6,97 (bs, 1H, NH ₂)

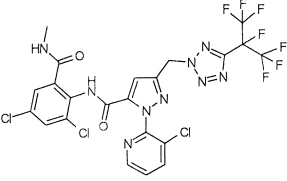
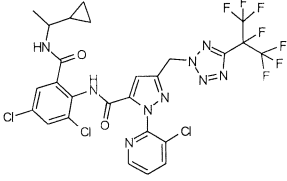
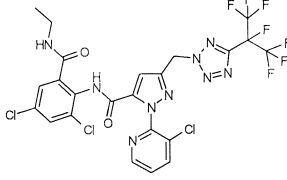
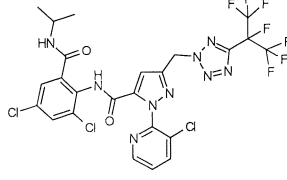
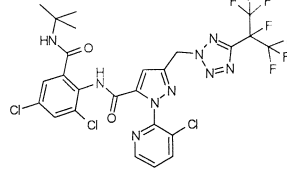
361		4,39	728	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
362		4,56	696	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
363		4,21	682	DMSO: 1,18 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
364		3,96	668	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
365		3,94	680	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

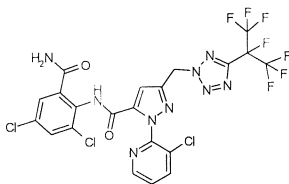
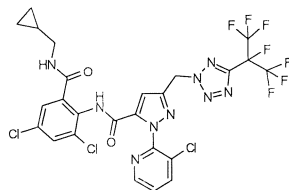
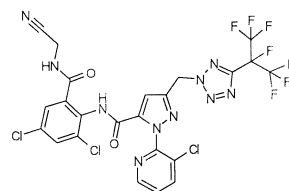
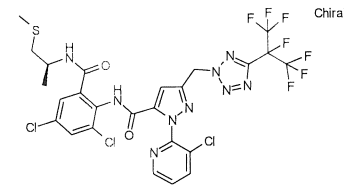
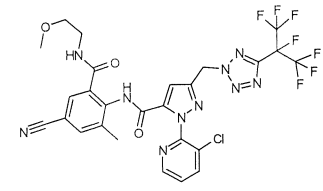
366		4,50	708	DMSO: 0,09-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
367		3,35	645	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
368		4,07	699	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,12 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
369		3,57	659	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
370		3,79	673	DMSO: 1,08 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

371		4,10	687	DMSO: 1,23 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
372		3,13	631	DMSO: 7,50-8,00 (bs, 2H, NH_2)
373		3,84	685	DMSO: 0,13 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,33 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,90 (m, 1H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,03 (t, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
374		3,29	670	DMSO: 4,17 (d, 2H, NHCH_2CN)
375		3,57	695	DMSO: 3,50 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CHF}_2$), 5,83 (tt, 1H, $\text{NHCH}_2\text{CHF}_2$)

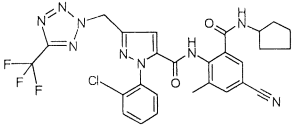
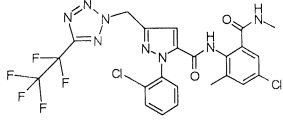
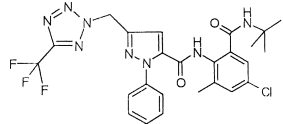
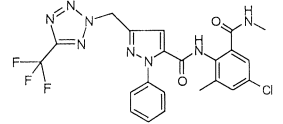
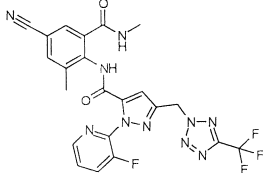
376		3,96	719	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
377		3,94	746	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
378		4,74	800	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
379		4,18	772	DMSO: 0,40 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,64 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
380		4,20	760	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

381		4,44	774	DMSO: 1,80 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
382		3,67	732	DMSO: 7,20-7,60 (bs, 2H, NH ₂)
383		4,51	786	DMSO: 0,02 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,22 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,77 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,91 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
384		3,82	771	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
385		4,63	820	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (d, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHC _H (CH ₃)CH ₂ SCH ₃)

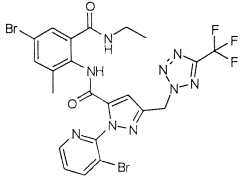
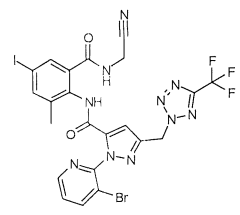
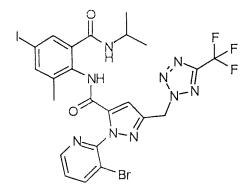
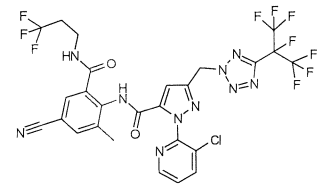
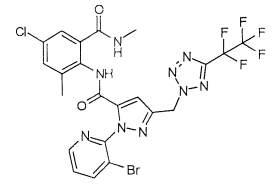
386		3,65	674	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
387		4,42	728	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
388		3,89	688	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
389		4,12	702	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
390		4,47	716	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

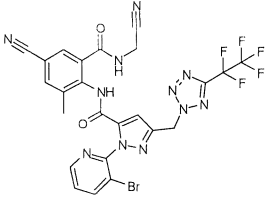
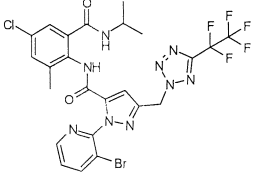
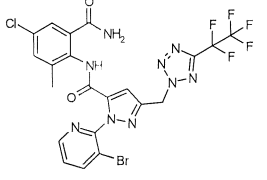
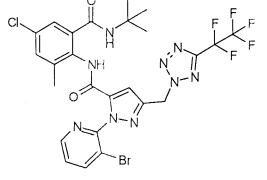
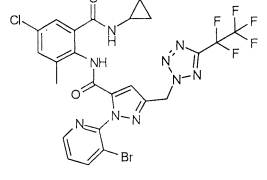
391		3,41	660	DMSO: 7,40 (bs, 1H, NH ₂), 7,77 (bs, 1H, NH ₂)
392		4,17	714	DMSO: 0,09 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,86 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,99 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
393		3,59	699	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
394		4,30	748	DMSO: 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,07 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,40 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
395		3,48	689	DMSO: 3,20 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,28-3,40 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)

396		3,89	724	DMSO: 3,50 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 5,86 (m, 1H, $\text{NHC}_\text{H}(\text{CH}_3)_2$)
397		2,96	601	DMSO: 0,23 (m, 2H, $\text{NHOCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,52 (m, 2H, $\text{NHOCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 1,07 (m, 1H, $\text{NHOCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,66 (d, 2H, $\text{NHOCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
398		2,88	589	DMSO: 1,16 (d, 6H, $\text{NHOCH}(\text{CH}_3)_2$), 4,08 (m, 1H, $\text{NHOCH}(\text{CH}_3)_2$)
399		3,37	599	DMSO: 1,34-1,77 (m, 8H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_4$), 4,04 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_4$)
400		3,63	613	DMSO: 1,04-1,80 (m, 10H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_5$), 3,56 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_5$)

401		3,84	598	DMSO: 1,40-1,77 (m, 8H, NHCH(CH ₂) ₄), 4,02-4,05 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄)
402		3,78	603	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
403		4,14	561	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
404		3,19	519	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH ₃)
405		2,46	529	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)

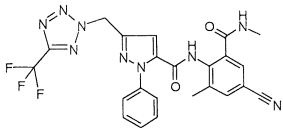
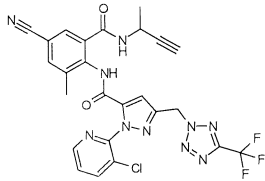
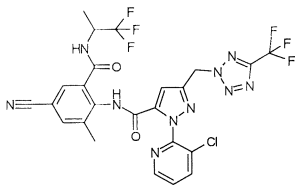
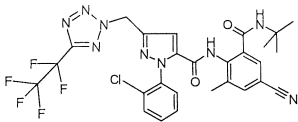
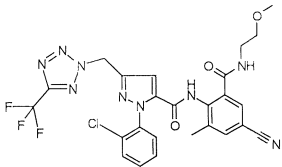
406		2,88	557	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
407		3,20	571	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
408		3,51	704	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
409		4,00	684	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
410		3,26	690	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)

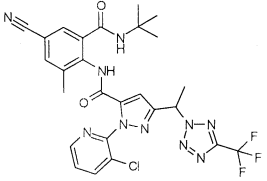
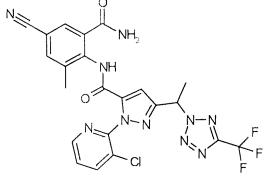
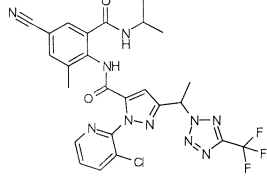
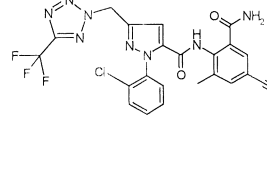
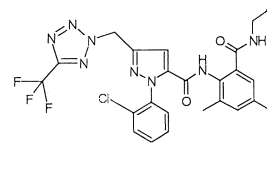
411		3,36	656	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,13 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
412		3,16	716	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH_2CN)
413		3,77	718	DMSO: 1,00 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
414		3,92	727	DMSO: 2,49 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$), 3,49 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$)
415		3,36	649	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH_3)

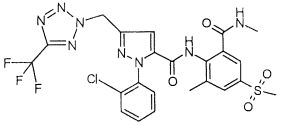
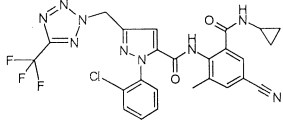
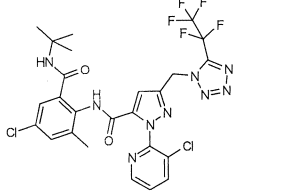
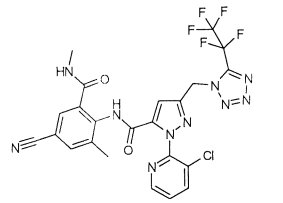
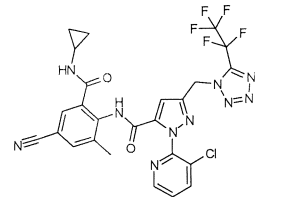
416		2,80	665	DMSO: 4,18 (d, 2H, NHCH_2CN)
417		3,87	677	DMSO: 1,00 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
418		3,13	635	DMSO: 7,45 (bs, 1H, NH_2), 7,71 (bs, 1H, NH_2)
419		4,23	691	DMSO: 1,19 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
420		3,62	677	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 0,55-0,61 (m, 2H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$), 2,64-2,70 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_2)_2$)

421		3,31	674	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
422		3,03	640	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
423		3,46	668	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
424		2,80	626	DMSO: 7,55 (bs, 1H, NH ₂), 7,86 (bs, 1H, NH ₂)
425		3,78	682	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

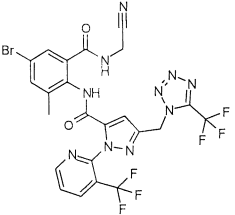
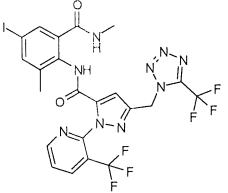
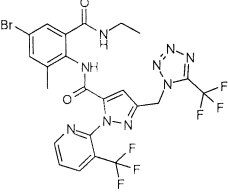
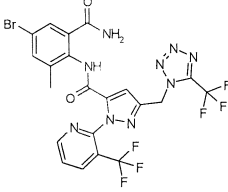
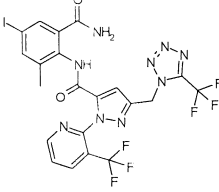
426		3,23	654	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,14 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
427		3,93	582	DMSO: 0,99-1,03 (m, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
428		3,72	552	DMSO: 1,25 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
429		3,11	574	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,13 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
430		3,43	594	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH_3)

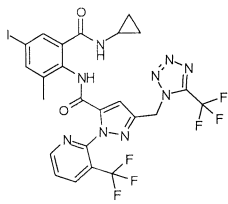
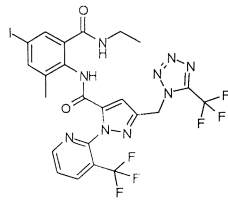
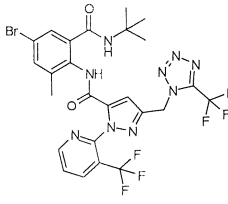
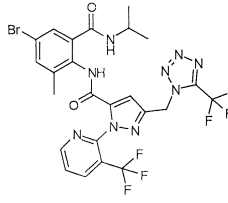
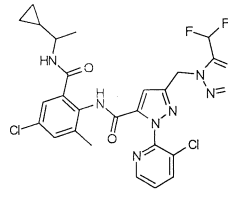
431		2,81	510	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH ₃)
432		2,97	584	DMSO: 1,21 (d, 3H, NHCH(CH ₃)C≡CH), 3,12 (s, 1H, NHCH(CH ₃)C≡CH), 4,61- 4,65 (m, 1H, NHCH(CH ₃)C≡CH)
433		3,25	628	DMSO: 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CF ₃), 4,52-4,58 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CF ₃)
434		4,25	636	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
435		3,18	588	DMSO: 2,20 (s, 3H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃), 3,26-3,30 (m, 4H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃)

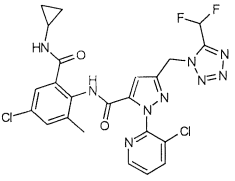
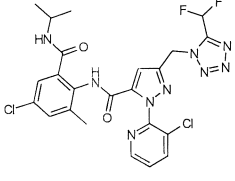
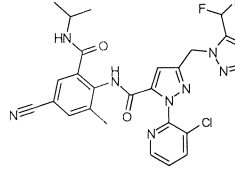
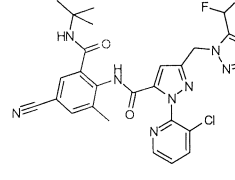
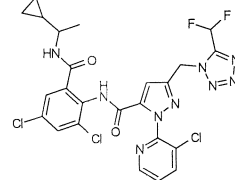
436		3,70	601	DMSO: 1,20 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
437		2,66	545	DMSO: 7,55 (bs, 1H, NH_2), 7,85 (bs, 1H, NH_2)
438		3,35	587	DMSO: 1,01 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,84-3,93 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
439		2,82	530	DMSO: 7,81-7,89 (m, 2H, NH_2)
440		3,61	584	DMSO: 0,04-0,11 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,27-0,31 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,80-0,84 (m, 1H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 2,97-2,99 (m, 2H, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)

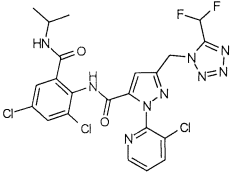
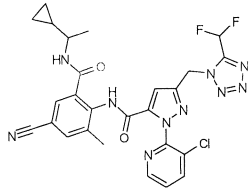
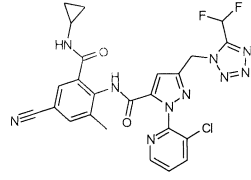
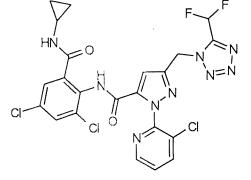
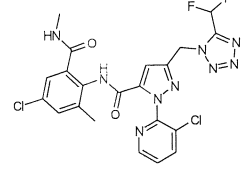
441		2,73	597	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
442		3,29	570	DMSO: 0,40-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
443		3,92	646	DMSO: 1,30 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
444		2,73	595	CD ₃ CN: 2,79 (d, 3H, NHCH ₃)
445		2,95	621	DMSO: 0,48 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

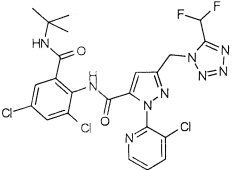
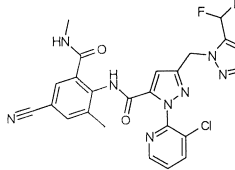
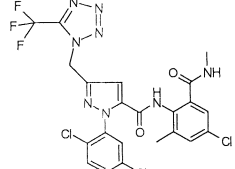
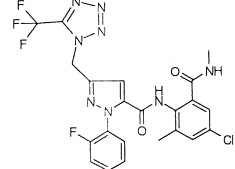
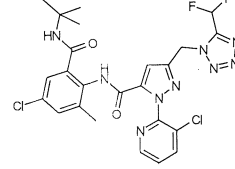
446		3,47	637	DMSO: 1,32 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
447		3,03	624	DMSO: 2,74 (d, 3H, NHCH_3)
448		3,81	678	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,81 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 1,04 (d, 3H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,29 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
449		3,64	589	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH_3)
450		3,54	707	DMSO: 0,96 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,83-3,88 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)

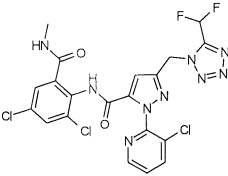
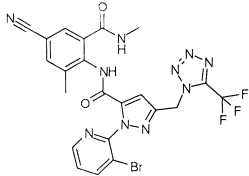
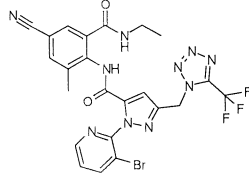
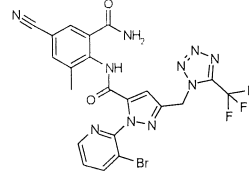
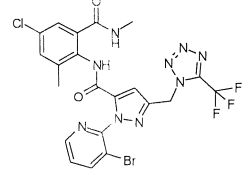
451		2,90	657	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH_2CN)
452		3,07	680	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH_3)
453		3,17	648	DMSO: 0,94 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,10 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
454		2,72	617	DMSO: 7,30 (bs, 1H, NH_2), 7,50 (bs, 1H, NH_2)
455		2,83	666	DMSO: 7,20 (bs, 1H, NH_2), 7,28 (bs, 1H, NH_2)

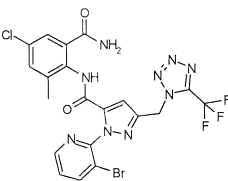
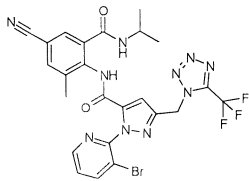
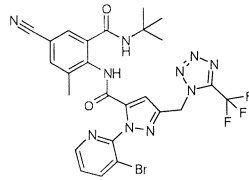
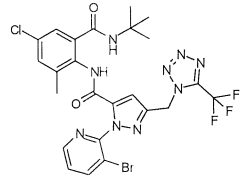
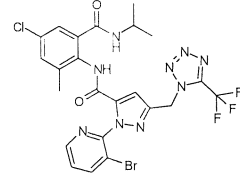
456		3,31	706	DMSO: 0,41-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
457		3,30	694	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
458		3,78	674	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
459		3,29	660	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88-3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
460		3,07	590	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

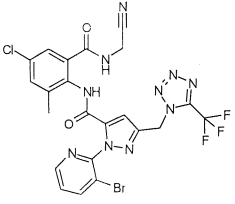
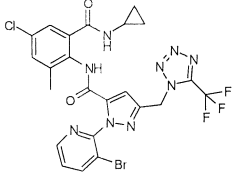
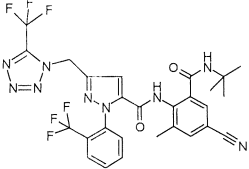
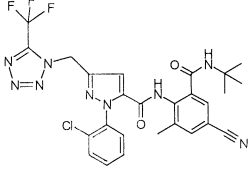
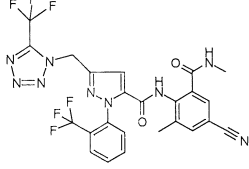
461		2,50	562	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
462		2,75	564	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
463		2,36	555	DMSO: 1,08 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
464		2,59	569	DMSO: 1,36 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
465		3,02	610	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

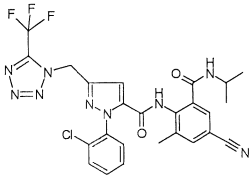
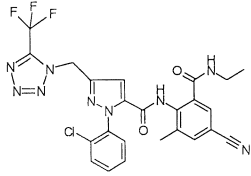
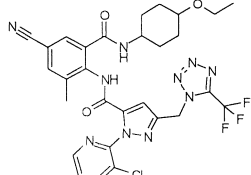
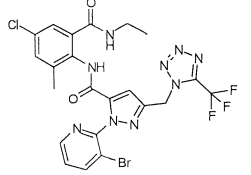
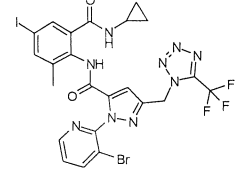
466		2,71	584	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
467		2,58	581	DMSO: 0,12-0,39 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
468		2,12	553	DMSO: 0,50 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
469		2,44	582	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
470		2,26	536	CD ₃ CN: 2,75 (d, 3H, NHCH ₃)

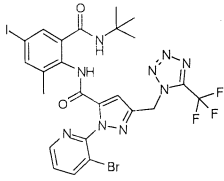
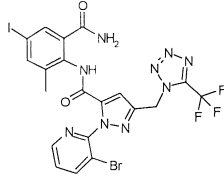
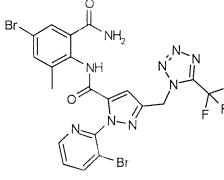
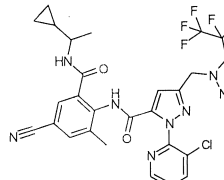
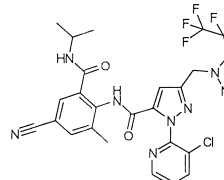
471		3,05	598	DMSO: 1,27 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
472		1,97	527	CD_3CN : 2,78 (d, 3H, NHCH_3)
473		3,52	589	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH_3)
474		2,94	537	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH_3)
475		3,09	578	CD_3CN : 1,30 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)

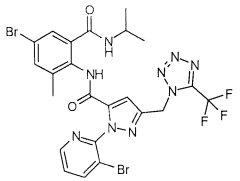
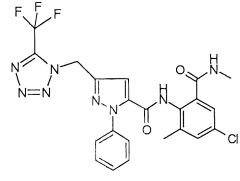
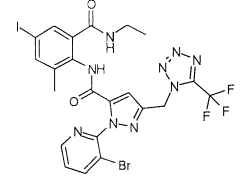
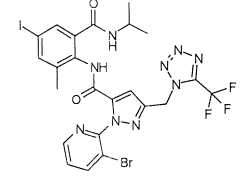
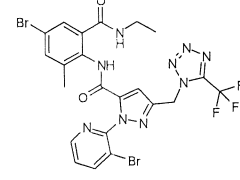
476		2,22	556	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
477		2,47	589	
478		2,66	603	
479		2,28	575	
480		2,79	598	

481		2,43	584	
482		2,74	617	
483		3,07	631	
484		3,52	640	
485		3,14	626	

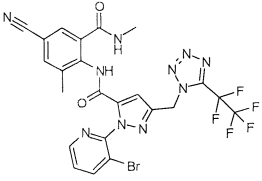
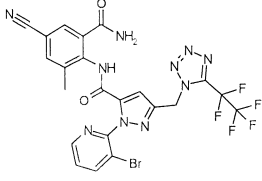
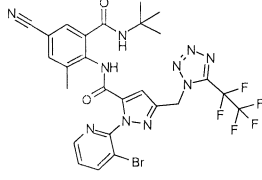
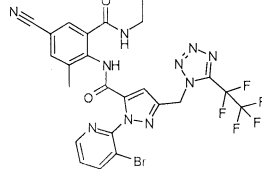
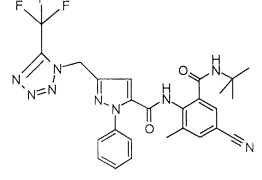
486		2,64	623	
487		2,90	624	
488		3,58	620	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
489		3,52	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
490		2,91	578	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

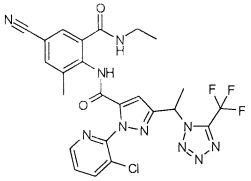
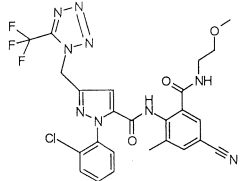
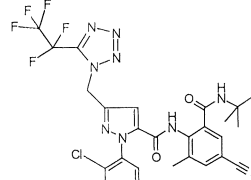
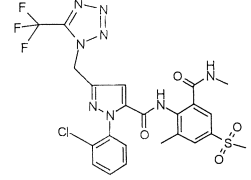
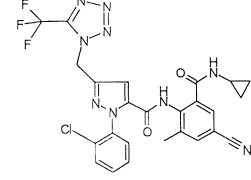
491		3,25	572	DMSO: 1,02-1,04 (m, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90-3,95 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
492		3,01	558	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,08 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
493		3,37	657	
494		2,88	612	
495		3,11	716	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

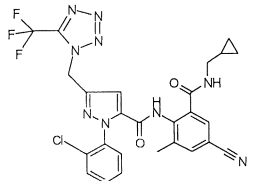
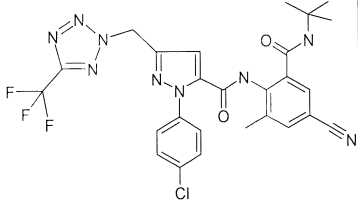
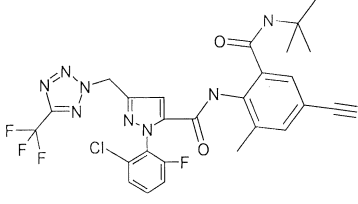
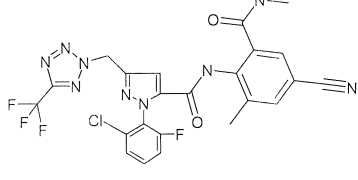
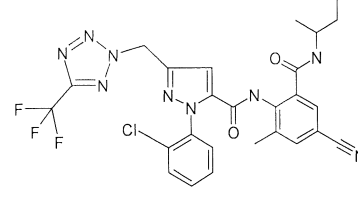
496		3,73	732	DMSO: 1,20 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
497		2,63	676	DMSO: 7,43 (bs, 1H, NH_2), 7,70 (bs, 1H, NH_2)
498		2,51	628	DMSO: 7,49 (bs, 1H, NH_2), 7,70 (bs, 1H, NH_2)
499		3,80	699	DMSO: 0,12-0,48 (m, 4H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 0,85 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 1,06 (d, 3H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$), 3,36 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_2)_2$)
500		3,50	673	DMSO: 1,04 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,92 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)

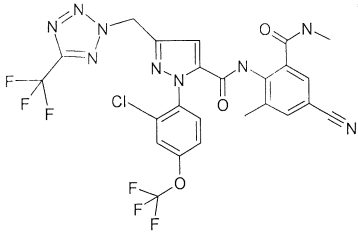
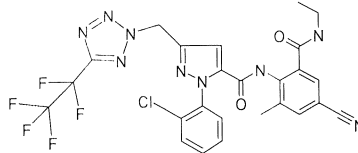
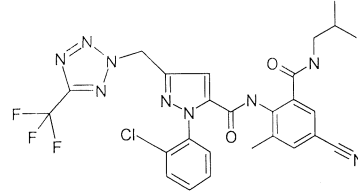
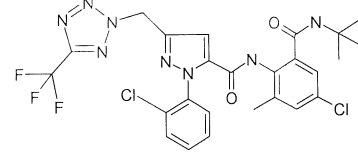
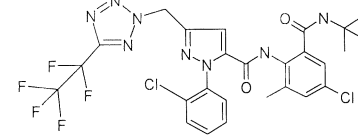
501		3,27	671	DMSO: 1,01 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
502		2,84	519	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH_3)
503		3,16	704	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,12 (q, 2H, NHCH_2CH_3)
504		3,41	718	DMSO: 1,00 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
505		3,02	656	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH_2CH_3), 3,13 (q, 2H, NHCH_2CH_3)

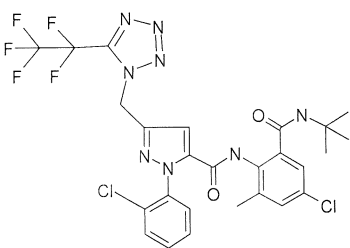
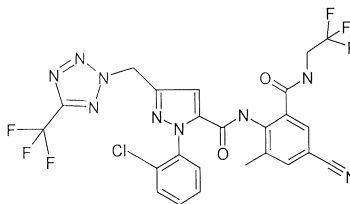
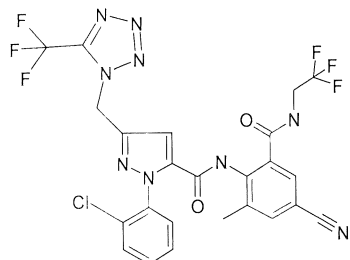
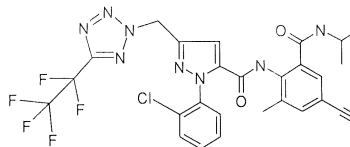
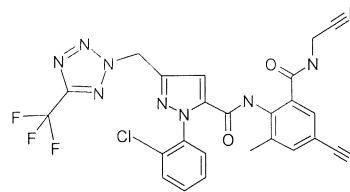
511		3,75	610	
512		2,53	558	
513		3,54	677	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,85-3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
514		3,91	691	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
515		3,29	675	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

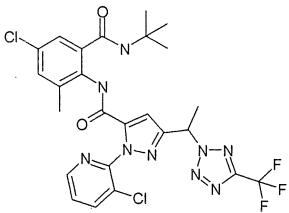
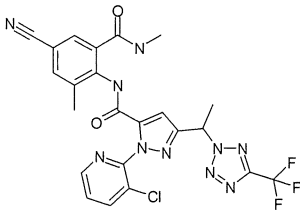
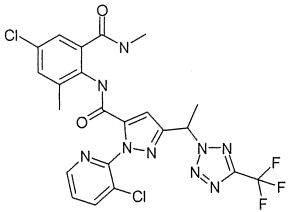
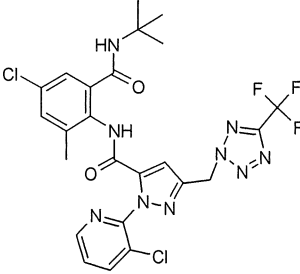
516		2,72	640	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
517		2,53	626	DMSO: 7,56 (bs, 1H, NH ₂), 7,86 (bs, 1H, NH ₂)
518		3,47	682	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
519		2,94	654	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
520		3,35	552	DMSO: 1,25 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

521		2,74	572	
522		2,80	598	DMSO: 2,33 (s, 3H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃), 3,26-3,29 (m, 4H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃)
523		3,92	636	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
524		2,43	597	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
525		2,95	570	DMSO: 0,39-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60-0,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

526		3,25	584	DMSO: 0,28-0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,38-0,39 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,84-0,91 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,97-3,00 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
527		4,16	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
528		3,88	604	DMSO: 1,18 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
529		3,13	562	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
530		3,81	586	DMSO: 0,76 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 0,97 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,33- 1,42 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,71-3,75 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)

531		3,82	628	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
532		3,87	608	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
533		3,84	586	DMSO: 0,81 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,64-1,71 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,91-2,94 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
534		4,36	595	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
535		4,73	646	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

536		4,41	646	DMSO: 1,18 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
537		3,48	612	DMSO: 3,84-3,93 (m, 2H, NHCH_2CF_3)
538		3,20	612	DMSO: 3,91-4,00 (m, 2H, NHCH_2CF_3)
539		3,91	622	DMSO: 1,05 (d, 6H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$), 3,86-3,91 (m, 1H, $\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$)
540		2,97	569	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH_2CN)

541		4,10	611	DMSO: 1,19 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)
542		2,86	559	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH_3)
543		3,26	569	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH_3)
544		3,85	595	DMSO: 1,22 (s, 9H, $\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$)

Phương pháp phân tích:

Xác định giá trị logP nêu trong bảng ở trên và ví dụ điều chế được thực hiện theo EEC Directive 79/831 Annex V.A8 bằng HPLC.

Sự chuẩn độ được thực hiện sử dụng alkan-2-on không phân nhánh (có từ 3 đến 16 nguyên tử cacbon), với các giá trị logP đã biết (xác định giá trị logP bằng thời gian duy trì sử dụng phép nội suy tuyến tính giữa hai alkanon liên tiếp).

Các phép đo được thực hiện sử dụng hệ Agilent 1100 LC với 50*4,6 Zorbax Eclipse C18 1,8 μ m cột (nhiệt độ lò 55°C, lưu lượng 2ml/phút).

Các pha động sau đây được sử dụng:

Pha động A: axetonitril + 1000 μ l axit formic / l

Pha động B: Nước millipore + 900 μ l axit formic / l

Gradien:

Thời gian/phút	Pha động A/%	Pha động B/%
0	10	90
4,25	95	5
5,50	95	5
5,55	10	90
5,70	10	90

Các tín hiệu MH^+ được xác định sử dụng hệ thống Agilent MSD với ESI và sự ion hóa dương hoặc âm.

Phổ NMR được xác định sử dụng Bruker Avance 400 có đầu dò lưu lượng (thể tích 60 μ l). Dung môi được sử dụng là CD_3CN hoặc d_6 -DMSO, với tetrametylsilan (0,00 ppm) được sử dụng làm tham khảo.

Sự phân tách tín hiệu được mô tả như sau: s (vạch đơn), bs (vạch đơn rộng), d (vạch đôi), t (vạch ba), q (vạch bốn), m (đa vạch).

Ví dụ sử dụng

Ví dụ A

Thử nghiệm Phaeton (xử lý phun PHAECO)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng ankylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần theo trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Đĩa chứa cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) được phun với dung dịch thấm của hợp chất hoạt tính có nồng độ mong muốn và, sau khi làm khô, ấu trùng bọ cánh cứng trên cây mù tạt được cho vào (*Phaedon cochleariae*).

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100 % nghĩa là tất cả các ấu trùng bọ cánh cứng đều bị giết; 0 % nghĩa là không ấu trùng bọ cánh cứng nào bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau của Ví dụ điều chế ở tỷ lệ áp dụng 100 g/ha, thể hiện hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ số

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 93, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 119, 120, 121, 122, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 191, 192, 194, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 277, 279, 280, 281, 282, 284, 286, 287, 289, 290, 291, 295, 296, 297, 298, 300, 301, 302, 304, 305, 308, 309, 310, 311, 312, 313, 314, 315, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 325, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 337, 338, 339, 340, 341, 342, 343, 344, 345, 346, 347, 348,

349, 350, 351, 352, 353, 354, 355, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 397, 398, 399, 400, 401, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 410, 411, 412, 413, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 453, 455, 456, 457, 459, 460, 461, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 473, 474, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 482, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 490, 491, 492, 494, 495, 496, 497, 498, 499, 500, 501, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 512, 513, 514, 515, 516, 517, 518, 519, 520, 521, 525, 526, 527, 528, 529, 530, 531, 532, 533, 535, 537, 538, 539, 540, 541, 542, 543, 544

Ví dụ B

Thử nghiệm Spodoptera frugiperda (xử lý phun SPODFR)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng ankylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được làm loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Các đĩa lá ngô (*Zea mays*) được phun chế phẩm hợp chất hoạt tính với nồng độ mong muốn và, sau khi sấy khô, được đưa vào các con sâu bướm ký sinh hại cây (*Spodoptera frugiperda*).

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả các con sâu bướm đều bị giết; 0% nghĩa là không con sâu bướm nào bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau của Ví dụ điều chế ở tỷ lệ áp dụng 100 g/ha, thể hiện hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ số

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 189, 190, 191, 192, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 277, 278, 279, 280, 281, 282, 284, 285, 286, 287, 288, 289, 290, 291, 292, 293, 294, 295, 296, 297, 298, 299, 300, 301, 302, 303, 304, 305, 306, 307, 308, 309, 310, 311, 312, 313, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 324, 325, 326, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 337, 338, 339, 340, 341, 342, 343, 345, 346, 347, 348, 349, 350, 351, 352, 353, 354, 355, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 397, 398, 399, 400, 401, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 410, 411, 412, 413, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 453, 455, 456, 457, 458, 459, 460, 461, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 473, 474, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 482, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 489, 490, 491, 492, 494, 495, 496, 497, 498, 499, 500, 501, 502, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 513, 514, 515, 516, 518, 519, 520, 521, 522, 523, 525, 526, 527, 528, 529, 530, 531, 532, 533, 534, 535, 536, 537, 538, 539, 540, 541, 542, 543, 544

Ví dụ C

Thử nghiệm rệp (xử lý phun Rệp)

Dung môi: 78 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng ankylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần theo trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Đĩa cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) bị phá hoại bởi tất cả các giai đoạn của rệp ăn cây đào xanh (*Myzus persicae*) được phun chế phẩm hợp chất hoạt tính ở nồng độ mong muốn.

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là toàn bộ rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có rệp bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau của Ví dụ điều chế ở tỷ lệ áp dụng 100 g/ha, thể hiện hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ Số 2, 5, 7, 8, 11, 13, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 31, 32, 41, 42, 43, 44, 45, 52, 53, 54, 55, 59, 60, 64, 65, 67, 70, 74, 76, 77, 78, 80, 81, 82, 86, 89, 91, 92, 95, 96, 98, 102, 104, 105, 113, 114, 129, 134, 136, 153, 154, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 186, 188, 189, 191, 196, 200, 201, 203, 211, 214, 217, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 236, 238, 240, 241, 242, 246, 255, 259, 263, 264, 265, 266, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 280, 281, 284, 286, 289, 290, 295, 296, 298, 304, 305, 308, 309, 310, 312, 313, 314, 315, 316, 317, 318, 320, 322, 328, 330, 332, 333, 334, 335, 336, 337, 338, 339, 340, 340, 341, 342, 345, 346, 349, 351, 353, 354, 360, 361, 367, 372, 376, 377, 385, 391, 397, 398, 405, 406, 407, 410, 411, 412, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 432, 433, 434, 435, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 455, 459, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 470, 471, 472, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 491, 492, 494, 495,

497, 498, 500, 501, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 512, 513, 515, 516, 517, 518, 519, 521, 522, 525, 526, 528, 529, 530, 532, 533, 540, 542, 543, 544

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau của Ví dụ điều chế ở tỷ lệ áp dụng 20 g/ha, thể hiện hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ Số 97, 301, 329, 460, 461

Ví dụ D

Thí nghiệm Lucilia cuprina (LUCICU)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa hợp chất hoạt tính thích hợp, một phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn với lượng dung môi đã biết và chất cô đặc được pha loãng với nước tới nồng độ mong muốn.

Các bình chứa chứa thịt ngựa được xử lý với chế phẩm hợp chất hoạt tính ở nồng độ mong muốn được đưa vào với ấu trùng *Lucilia cuprina*.

Sau khoảng thời gian mong đợi, tỷ lệ tiêu diệt theo % được xác định. 100% có nghĩa là toàn bộ ấu trùng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có ấu trùng bị tiêu diệt.

Trong thí nghiệm này, ví dụ, các hợp chất của các Ví dụ điều chế cho thấy, ở một tỷ lệ sử dụng là 100ppm, cho hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ Số 2, 3, 5, 6, 7, 10, 11, 13, 218, 220, 222, 223, 229, 295

Ví dụ E

Thí nghiệm Boophilus microplus (tiêm BOOPMI)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để điều chế chế phẩm chứa hợp chất hoạt tính thích hợp, một phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn với lượng dung môi đã biết và chất cô đặc được pha loãng với nước tới nồng độ mong muốn.

Dung dịch chứa hợp chất hoạt tính được tiêm vào bụng (*Boophilus microplus*), các con vật được chuyển vào các đĩa và được giữ trong phòng có khí hậu thích hợp. Hoạt tính được đánh giá bởi sự đậu của trứng có khả năng sinh sản.

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là không một vật bám dính nào để được trứng tốt.

Trong thí nghiệm này, ví dụ, các hợp chất của các Ví dụ điều chế cho thấy, ở một tỷ lệ sử dụng là 20 µg/con, hiệu quả $\geq 80\%$

Ví dụ Số 2, 3, 5, 6, 7, 10, 11, 13, 218, 220, 222, 223, 229, 295

Ví dụ F

Thử nghiệm ruồi Musca domestica (MUSCDO)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để điều chế chế phẩm chứa hợp chất hoạt tính thích hợp, một phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn với lượng dung môi đã biết và chất cô đặc được pha loãng với nước tới nồng độ mong muốn.

Các bình chứa chứa bột biển được xử lý với chế phẩm hợp chất hoạt tính ở nồng độ mong muốn được đưa vào với *Musca domestica* trưởng thành.

Sau khoảng thời gian mong đợi, tỷ lệ tiêu diệt theo % được xác định. 100% có nghĩa là toàn bộ ruồi đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có ruồi bị tiêu diệt.

Trong thí nghiệm này, ví dụ, các hợp chất của các Ví dụ điều chế cho thấy, ở một tỷ lệ sử dụng là 100ppm, cho hiệu quả $\geq 80\%$:

Ví dụ Số 2, 3, 5, 7, 10, 11, 13, 133, 136, 137, 144, 151, 162, 175, 178, 218, 223

Ví dụ G

Thử nghiệm Phaeton (xử lý phun PHAECO)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
1,5 phần trọng lượng dimetylformamit

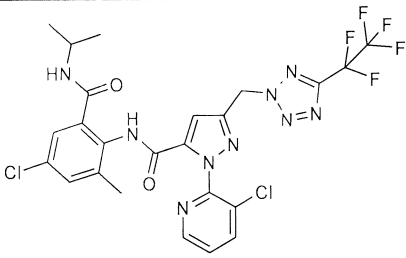
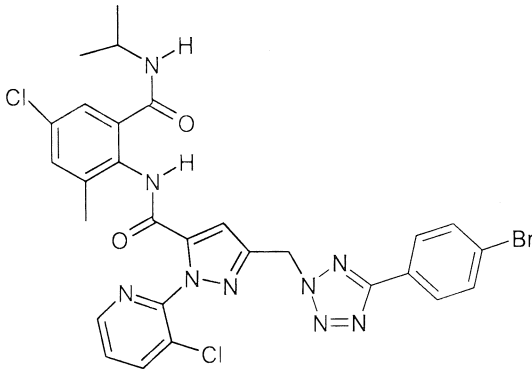
Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng ankylaryl polyglycol ete

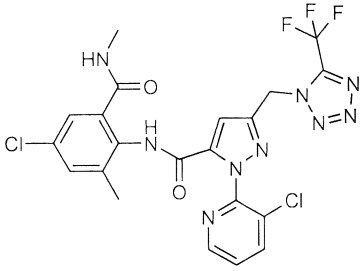
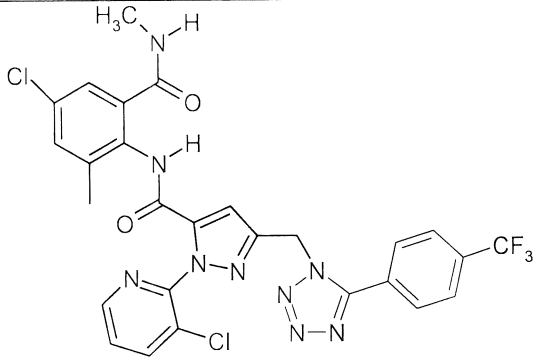
Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Đĩa chứa cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) được phun với dung dịch thấm của hợp chất hoạt tính có nồng độ mong muốn và, sau khi làm khô, ấu trùng bọ cánh cứng trên cây mù tạt được cho vào (*Phaedon cochleariae*).

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100 % nghĩa là tất cả các ấu trùng bọ cánh cứng đều bị giết; 0 % nghĩa là không ấu trùng bọ cánh cứng nào bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây của Ví dụ điều chế cho thấy hoạt tính tốt hơn tình trạng kỹ thuật: xem bảng

Hợp chất hoạt tính	Nồng độ g/ha	Tỷ lệ chết theo %/7 ngày
 theo sáng chế	0,8	100
 đã biết	0,8	0

Hợp chất hoạt tính	Nồng độ g/ha	Tỷ lệ chết theo %/7 ngày
 theo sáng chế	4	67
 đã biết	4	0

Ví dụ H

Thử nghiệm *Spodoptera frugiperda* (xử lý phun SPODFR)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
1,5 phần trọng lượng dimetylformamit

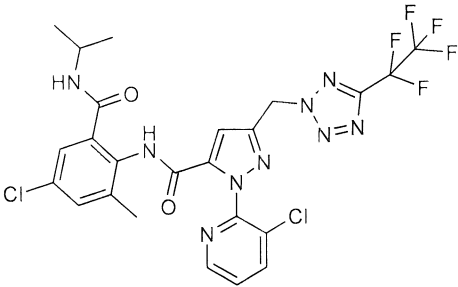
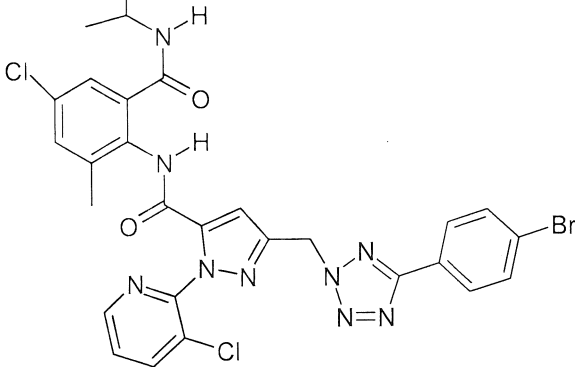
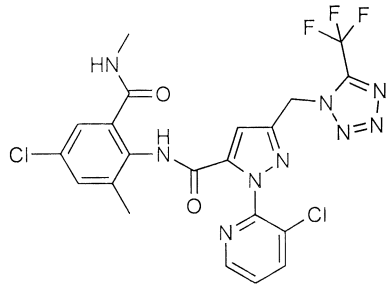
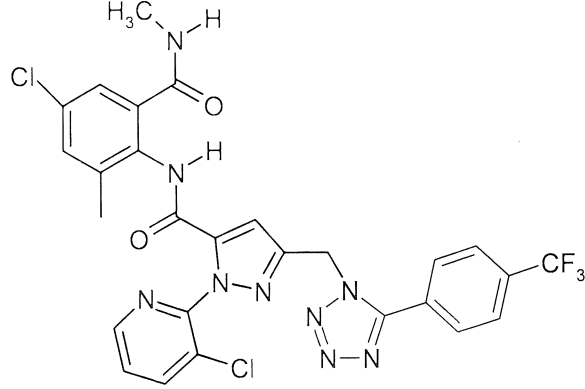
Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần theo trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Các đĩa lá ngô (*Zea mays*) được phun chế phẩm hợp chất hoạt tính với nồng độ mong muốn và, sau khi sấy khô, được đưa vào các con sâu bướm ký sinh hại cây (*Spodoptera frugiperda*).

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả các con sâu bướm đều bị giết; 0% nghĩa là không con sâu bướm nào bị giết.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây của Ví dụ điều chế cho thấy hoạt tính tốt hơn tình trạng kỹ thuật: xem bảng

Hợp chất hoạt tính	Nồng độ g/ha	Tỷ lệ chết theo ngày %/7
 theo sáng chế	0,8	100
 đã biết	0,8	0
 theo sáng chế	4	100
 đã biết	4	33

*Ví dụ 1**Thử nghiệm rệp (xử lý phun Rệp)*

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
 1,5 phần trọng lượng dimetylformamit

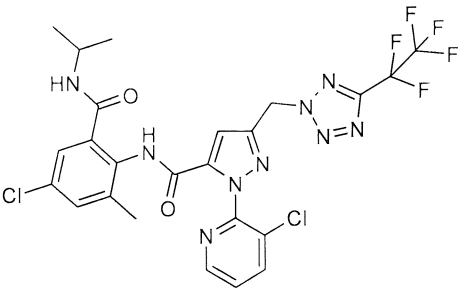
Chất nhũ hóa: 0,5 phần trọng lượng alkylaryl polyglycol ete

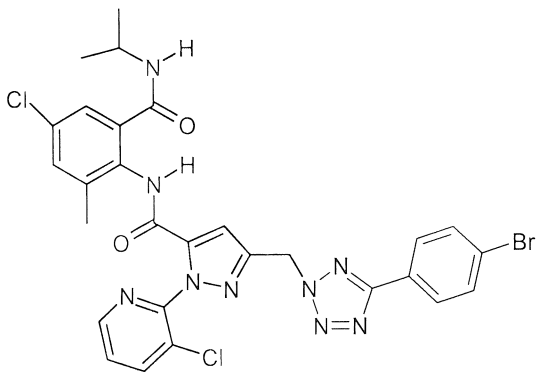
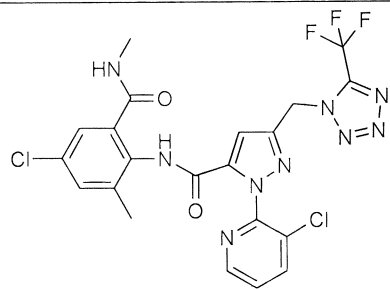
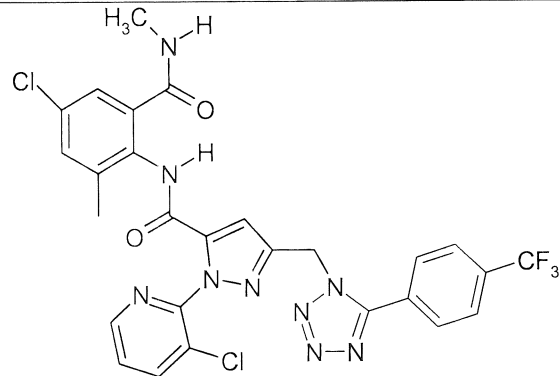
Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hợp chất hoạt tính, 1 phần theo trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn lẫn với các lượng dung môi và chất nhũ hóa đã nêu, và chất cô đặc được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn.

Đĩa cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) bị phá hoại bởi tất cả các giai đoạn của rệp ăn cây đào xanh (*Myzus persicae*) được phun chế phẩm hợp chất hoạt tính ở nồng độ mong muốn.

Sau khoảng thời gian mong đợi, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là toàn bộ rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có rệp bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây của Ví dụ điều chế cho thấy hoạt tính tốt hơn tình trạng kỹ thuật: xem bảng

Hợp chất hoạt tính	Nồng độ g/ha	Tỷ lệ chết theo ngày %/7
 theo sáng chế	100	70

Hợp chất hoạt tính	Nồng độ g/ha	Tỷ lệ chết theo ngày %/7
 đã biết	100	0
 theo sáng chế	100	100
 đã biết	100	80

Ví dụ J

Thí nghiệm với loại nhện đỏ, kháng OP (xử lý phun TETRUR)

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton

1,5 phần trọng lượng dimetylforamit

Chất nhũ hóa 0,5 phần trọng lượng alkylaryl polyglycol etc

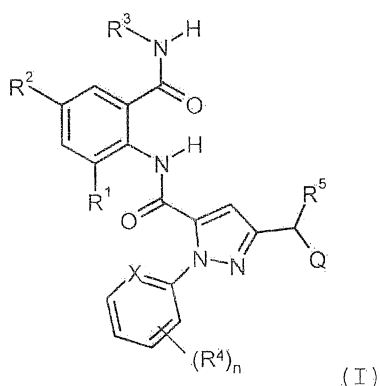
Để điều chế chế phẩm chứa hợp chất hoạt tính phù hợp, 1 phần trọng lượng của hợp chất hoạt tính được trộn với lượng dung môi và chất nhũ hóa nêu trên, và nồng độ được làm loãng với nước chứa chất nhũ hóa tới nồng độ mong muốn. Đậu Pháp (*Phaseolus vulgaris*) mà bị phá hoại nặng bởi tất cả các giai đoạn của nhện đỏ hai chấu (*Tetranychus urticae*) được phun chế phẩm chứa hợp chất hoạt tính ở nồng độ thích hợp.

Sau khoảng thời gian cụ thể, tỷ lệ chết theo tỷ lệ % được xác định. 100% nghĩa là tất cả các con ve nhện bị tiêu diệt, và 0% nghĩa là không một con ve nhện nào bị tiêu diệt.

Trong thí nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các Ví dụ điều chế cho thấy hiệu quả tốt $\geq 80\%$ ở tỷ lệ áp dụng 20g/ha: 363, 449.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất anthranilamit được thế tetrazol có công thức (I)



trong đó

R^1 là metyl hoặc clo,

R^2 là halogen, xyano, metyl hoặc C_1 - C_4 -alkylsulphonyl,

R^3 là hydro hoặc là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng được thế đơn hoặc đa bằng các phần tử thế giống hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, amino, xyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_2 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -xycloalkylamino và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần,

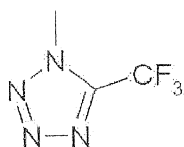
n là 1, 2, 3 hoặc 4,

X là N, CH, CF, CCl, CBr,

R^4 độc lập với nhau là hydro, xyano, halo- C_1 - C_6 -alkyl, halogen hoặc halo- C_1 - C_4 -alkoxy,

R^5 là hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl,

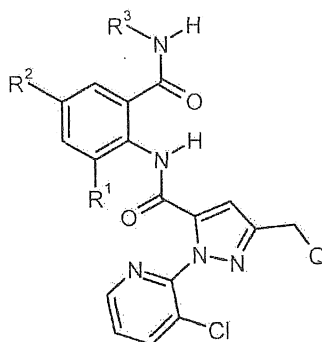
Q là gốc tetrazol được thế một lần Q-6,



Q-6

hoặc muối của hợp chất có công thức (I).

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này là hợp chất có công thức (I-1)



(I-1)

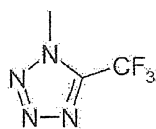
trong đó

R^1 là metyl hoặc clo,

R^2 là halogen, xyano hoặc metyl,

R^3 là hydro hoặc là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl, C_3 - C_{12} -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng được thể đơn hoặc đa bằng các phần tử thể giống hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, amino, xyano, nitro, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_2 - C_6 -alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -xycloalkylamino và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần,

Q là gốc tetrazol được thế một lần Q-6,



Q-6

hoặc muối của hợp chất có công thức (I-1).

3. Hợp chất theo điểm 2, trong đó

R^1 là metyl,

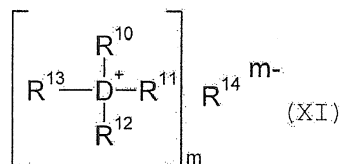
R^2 là halogen, xyano hoặc metyl,

R^3 là hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, mỗi chúng tùy ý được thể đơn hoặc thể đa bằng các phần tử thể giống hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể độc lập với nhau có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, amino, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_3 - C_6 -xycloalkyl và vòng dị thơm 5 hoặc 6 thành phần mà chứa 1 hoặc 2 dị nguyên tử từ nhóm gồm N, O và S, trong đó hai nguyên tử oxy không liền kề với nhau trong vòng,

Q là gốc Q-6,

hoặc muối của hợp chất có công thức (I).

4. Chế phẩm, gồm ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I-1) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 và ít nhất một muối có công thức (XI)



trong đó

D là nitơ hoặc phospho,

R^{10} , R^{11} , R^{12} , và R^{13} độc lập với nhau là hydro hoặc trong mỗi trường hợp là C_1 - C_8 -alkyl hoặc C_1 - C_8 -alkylen đơn hoặc đa bão hòa, tùy ý được thế, trong đó phần tử thế có thể được chọn từ nhóm gồm halogen, nitro và xyano,

m là 1, 2, 3 hoặc 4,

R^{14} là anion hữu cơ hoặc vô cơ.

5. Chế phẩm, gồm ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I-1) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 và ít nhất một chất thêm có công thức (XII)



trong đó

R là alkyl mạch thẳng hoặc phân nhánh có từ 4 đến 20 nguyên tử cacbon,

R' là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, n-pentyl hoặc n-hexyl,

AO là gốc etylen oxit, gốc propylen oxit, gốc butylen oxit hoặc là các hỗn hợp của metylen oxit và các gốc propylen oxit hoặc các gốc butylen oxit và

v là số từ 2 đến 30.

6. Phương pháp kiểm soát các động vật gây hại, trừ phương pháp điều trị bệnh cho cơ thể động vật hoặc người, khác biệt ở chỗ, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I-1) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 hoặc chế phẩm theo điểm 4 hoặc 5 được để hoạt động trên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng và/hoặc hạt giống và/hoặc vật liệu nhân giống cây và/hoặc các bộ phận của cây được tạo thành sau đó từ vật liệu nhân giống cây.

7. Quy trình điều chế các chế phẩm hoá nông, khác biệt ở chỗ, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I-1) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 hoặc chế phẩm theo điểm 4 hoặc 5 được trộn với chất độn và/hoặc các chất hoạt động bề mặt.

8. Hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I-1) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 để kiểm soát các động vật gây hại trong lĩnh vực bảo vệ mùa màng, trong bảo vệ nguyên liệu, trong lĩnh vực vệ sinh và/hoặc trong lĩnh vực thú y, trừ việc điều trị bệnh cho cơ thể động vật hoặc người.