



(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)



1-0035021

C07D 401/04; A01N 43/90; A01P 5/00; (13) B

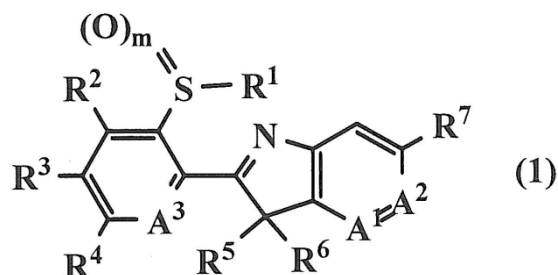
(51)⁸ A01P 7/04; C07D 471/04; A61K
31/4439; A61P 33/00; A01N 43/40;
A61K 31/437

- (21) 1-2018-02812 (22) 30/11/2016
(86) PCT/JP2016/085483 30/11/2016 (87) WO/2017/094750 08/06/2017
(30) 2015-234665 01/12/2015 JP; 2016-172747 05/09/2016 JP
(45) 27/03/2023 420 (43) 25/02/2019 371A
(73) NIHON NOHYAKU CO., LTD. (JP)
19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386 (JP)
(72) YONEMURA, Ikki (JP); SANO, Yusuke (JP); SUWA, Akiyuki (JP); FUJIE,
Shunpei (JP).
(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) HỢP CHẤT 3H-PYROLOPYRIDIN, CHẤT PHÒNG TRỪ VẬT NGOẠI KÝ SINH HOẶC THUỐC TRỪ SÂU BAO GỒM HỢP CHẤT NÀY, PHƯƠNG PHÁP TẠO RA CHẤT PHÒNG TRỪ VẬT NGOẠI KÝ SINH HOẶC THUỐC TRỪ SÂU VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ VẬT NGOẠI KÝ SINH VÀ CÔN TRÙNG GÂY HẠI TRONG NÔNG NGHIỆP

(57) Trong quá trình sản xuất cây trồng trong lĩnh vực nông nghiệp, trồng trọt và tương tự, sự thiệt hại gây ra bởi các loài côn trùng gây hại v.v... vẫn còn rất lớn, và các loài côn trùng gây hại kháng cự lại thuốc trừ sâu hiện xuất hiện. Trong các trường hợp như vậy, sự phát triển của thuốc trừ sâu mới dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được mong muốn. Sáng chế đề xuất thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm, hợp chất 3H-pyrololopyridin có công thức chung (1) làm hoạt chất:

[Công thức hóa học 1]



(trong đó mỗi A¹, A², và A³ là nguyên tử nitơ hoặc nhóm CH, R¹ là nhóm etyl, mỗi R² và R⁴ là nguyên tử hydro, mỗi R³ và R⁷ là nhóm haloalkyl, mỗi R⁵ và R⁶ là nguyên tử flo, và m là 0 hoặc 2), N-oxit của nó hoặc muối của nó; và sáng chế còn đề cập đến phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm loại hợp chất 3H-pyrololopyridin nhất định, N-oxit của nó hoặc muối của nó làm hoạt chất, và sáng chế cũng đề cập đến phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các hợp chất khác nhau đã được xem xét về tiềm năng của chúng làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, và trong số chúng, một số loại nhất định của các hợp chất dị vòng ngưng tụ đã được báo cáo là có tác dụng làm thuốc trừ sâu (ví dụ, xem tài liệu sáng chế từ 1 đến 8). Không có tài liệu tham khảo nào trong số các tài liệu này bộc lộ hợp chất dị vòng ngưng tụ bất kỳ có vòng 3H-pyrololopyridin.

Danh sách tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: JP-A 2009-280574

Tài liệu sáng chế 2: JP-A 2010-275301

Tài liệu sáng chế 3: JP-A 2011-79774

Tài liệu sáng chế 4: JP-A 2012-131780

Tài liệu sáng chế 5: WO 2012/086848

Tài liệu sáng chế 6: WO 2013/018928

Tài liệu sáng chế 7: WO 2014/148451

Tài liệu sáng chế 8: WO 2014/157600

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề kỹ thuật

Trong quá trình sản xuất cây trồng trong lĩnh vực nông nghiệp, trồng trọt và các lĩnh vực tương tự, thiệt hại bởi các loài côn trùng gây hại gây ra v.v... vẫn còn rất lớn, và sự xuất hiện của các loài côn trùng gây hại kháng các thuốc trừ sâu hiện có là vấn đề ngày càng gia tăng. Ngoài ra, bảo vệ môi trường trên trái đất là thách thức toàn cầu nhắm đến mọi lĩnh vực, bao gồm lĩnh vực nông nghiệp và trồng trọt. Do đó, sự phát triển các hợp chất mới làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt mà có gánh nặng cho môi trường thấp được mong muốn.

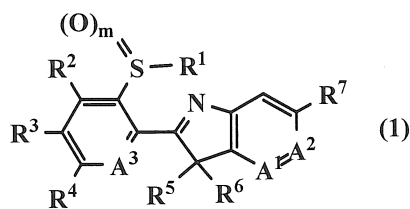
Giải pháp cho vấn đề

Các tác giả sáng chế đã thực hiện nghiên cứu chuyên sâu để giải quyết các vấn đề nêu trên. Do đó, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng hợp chất 3H-pyrololopyridin có công thức chung (1), N-oxit của nó và muối của nó có hiệu quả cao trong việc phòng trừ các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt và có gánh nặng môi trường thấp. Dựa trên phát hiện này, các tác giả sáng chế hoàn thành sáng chế.

Cụ thể là, sáng chế đề cập đến các mục sau sau.

[1] Hợp chất 3H-pyrololopyridin có công thức chung (1):

[Công thức hóa học 1]



trong đó

R^1 là

(a1) nhóm (C_1 - C_6) alkyl;

(a2) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;

(a3) nhóm (C_2 - C_6) alkenyl; hoặc

(a4) nhóm (C_2 - C_6) alkynyl,

R^2 và R^4 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^2 và R^4 này là

- (b1) nguyên tử hydro;
- (b2) nguyên tử halogen;
- (b3) nhóm hydroxyl;
- (b4) nhóm formyl;
- (b5) nhóm xyano;
- (b6) nhóm (C_1 - C_6) alkyl;
- (b7) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b8) nhóm (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b9) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl;
- (b10) nhóm halo (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b11) nhóm halo (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b12) nhóm (C_1 - C_6) alkylthio;
- (b13) nhóm (C_1 - C_6) alkylsulfinyl;
- (b14) nhóm (C_1 - C_6) alkylsulfonyl;
- (b15) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylthio;
- (b16) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfinyl;
- (b17) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfonyl;
- (b18) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b19) nhóm $R^9(R^{10})N$ (trong đó R^9 và R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^9 và R^{10} này là nguyên tử hydro, nhóm (C_1 - C_6) alkyl, nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkyl, nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl, nhóm (C_1 - C_6) alkylcacbonyl, nhóm (C_1 - C_6) alkoxycacbonyl hoặc nhóm phenylcacbonyl);
- (b20) nhóm mono- $(C_1$ - $C_6)$ alkylaminocacbonyl NH;
- (b21) nhóm mono- $(C_1$ - $C_6)$ alkylaminothiocacbonyl NH;
- (b22) nhóm $C(R^9)=NOR^{10}$ (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);

(b23) nhóm carboxyl;

(b24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl;

(b25) nhóm R⁹(R¹⁰)N carbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);

(b26) nhóm aryl;

(b27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;

(b29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b30) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy;

(b31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b32) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH;

(b33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b34) nhóm dị vòng; hoặc

(b35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R^3 và R^7 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^3 và R^7 này là

(c1) nguyên tử hydro;

(c2) nguyên tử halogen;

(c3) nhóm hydroxyl;

(c4) nhóm formyl;

(c5) nhóm xyano;

(c6) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(c7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(c8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;

(c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(c10) nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl;

(c11) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;

(c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(c13) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;

(c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;

(c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;

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

(c18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;

(c19) nhóm $R^9(R^{10})N$ (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);

- (c20) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminocarbonyl NH;
- (c21) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminothiocarbonyl NH;
- (c22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c23) nhóm carboxyl;
- (c24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl;
- (c25) nhóm R⁹(R¹⁰)N carbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c26) nhóm aryl;
- (c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;
- (c29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c30) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy;
- (c31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c32) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH;
- (c33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm

(C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c34) nhóm dị vòng; hoặc

(c35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R⁵ và R⁶ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁵ và R⁶ này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(d4) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(d5) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl; hoặc

(d6) nhóm (C₁-C₆) alkoxyacetyl, hoặc theo một cách khác

(d7) R⁵ và R⁶ được liên kết với nhau để tạo ra vòng béo có từ 3 đến 6 phần tử,

R³ và R⁴ có thể được kết hợp để tạo ra vòng thơm,

A¹, A² và A³ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A¹, A² và A³ này là nguyên tử nitơ, N-O hoặc nhóm C-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro; hoặc (e2) nguyên tử halogen), và

m là 0, 1 hoặc 2,

N-oxit của chúng hoặc muối của nó.

[2] Hợp chất 3H-pyrololopyridin theo mục [1] nêu trên, N-oxit của nó hoặc muối của nó, trong đó

R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R^2 và R^4 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^2 và R^4 này là

- (b1) nguyên tử hydro;
- (b2) nguyên tử halogen;
- (b3) nhóm hydroxyl;
- (b6) nhóm (C_1 - C_6) alkyl;
- (b7) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b8) nhóm (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b9) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl;
- (b11) nhóm halo (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b12) nhóm (C_1 - C_6) alkylthio;
- (b14) nhóm (C_1 - C_6) alkylsulfonyl;
- (b15) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylthio;
- (b16) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfinyl;
- (b18) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b19) nhóm $R^9(R^{10})N$ (trong đó R^9 và R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^9 và R^{10} này là nguyên tử hydro, nhóm (C_1 - C_6) alkyl, nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl (C_1 - C_6) alkyl, nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl, nhóm (C_1 - C_6) alkylcacbonyl, nhóm (C_1 - C_6) alkoxycacbonyl hoặc nhóm phenylcacbonyl);
- (b20) nhóm mono-(C_1 - C_6) alkylaminocacbonyl NH;
- (b21) nhóm mono-(C_1 - C_6) alkylaminothiocacbonyl NH;
- (b22) nhóm $C(R^9)=NOR^{10}$ (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);
- (b23) nhóm carboxyl;
- (b24) nhóm (C_1 - C_6) alkoxycacbonyl;
- (b25) nhóm $R^9(R^{10})N$ cacbonyl (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);
- (b26) nhóm aryl;
- (b27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác

nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;

(b29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b34) nhóm dị vòng; hoặc

(b35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R³ và R⁷ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R³ và R⁷ này là

- (c1) nguyên tử hydro;
- (c2) nguyên tử halogen;
- (c6) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (c7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (c8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c11) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;
- (c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (c18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;
- (c19) nhóm R⁹(R¹⁰)N (trong đó R⁹ và R¹⁰ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁹ và R¹⁰ này là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl hoặc nhóm phenylcarbonyl);
- (c20) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminocarbonyl NH;
- (c21) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminothiocarbonyl NH;
- (c22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c23) nhóm carboxyl;
- (c24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl;
- (c25) nhóm R⁹(R¹⁰)N carbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c26) nhóm aryl;
- (c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo

(C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;

(c29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c34) nhóm dị vòng; hoặc

(c35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R⁵ và R⁶ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁵ và R⁶ này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(d4) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(d5) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl; hoặc

(d6) nhóm (C₁-C₆) alkoxyacetyl, hoặc theo một cách khác

(d7) R⁵ và R⁶ được liên kết với nhau để tạo ra vòng béo có từ 3 đến 6 phần tử,

A¹, A² và A³ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A¹, A² và A³ này là nguyên tử nitơ, N-O hoặc nhóm C-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro), và

m là 0, 1 hoặc 2.

[3] Hợp chất 3H-pyrolopyridin theo mục [1] nêu trên hoặc [2], N-oxit của chúng hoặc muối của chúng, trong đó

R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² và R⁴ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R² và R⁴ này là

(b1) nguyên tử hydro; hoặc

(b34) nhóm dị vòng,

R³ và R⁷ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R³ và R⁷ này là

(c1) nguyên tử hydro;

(c2) nguyên tử halogen;

(c7) nhóm (C₃-C₆) cycloalkyl;

(c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(c22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);

(c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm cyano, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl; hoặc

(c34) nhóm dị vòng,

R⁵ và R⁶ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁵ và R⁶ này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C₁-C₆) alkyl; hoặc

(d6) nhóm (C₁-C₆) alkoxyacetyl,

A¹, A² và A³ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A¹, A² và A³ là nguyên tử nitơ, N-O hoặc nhóm C-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro), và

m là 1 hoặc 2.

[4] Việc sử dụng hợp chất 3H-pyrololopyridin theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên, N-oxit của chúng hoặc muối của chúng làm hoạt chất của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt.

[5] Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, phương pháp bao gồm việc áp dụng hoạt chất của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt được nêu trong mục [4] nêu trên lên thực vật và đất.

[6] Phương pháp phòng trừ loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt, bao gồm việc áp dụng hoạt chất của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt được nêu trong mục [4] nêu trên lên thực vật và đất.

[7] Chất phòng trừ loài ngoại ký sinh bao gồm hợp chất 3H-pyrololopyridin theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên, N-oxit của chúng hoặc muối của chúng làm hoạt chất.

[8] Phương pháp phòng trừ loài ngoại ký sinh, bao gồm việc áp dụng lượng hữu hiệu của chất phòng trừ loài ngoại ký sinh theo mục [7] nêu trên đối với loài ngoại ký sinh.

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo các định nghĩa liên quan đến công thức chung (1) mà là hợp chất 3H-pyrololopyridin của sáng chế, N-oxit của nó hoặc muối của nó, “halo” nhằm để chỉ “nguyên tử halogen” và bao gồm nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iot hoặc nguyên tử flo.

“Nhóm (C₁-C₆) alkyl” nhằm để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl,

nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm isobutyl, nhóm sec-butyl, nhóm tert-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm isopentyl, nhóm tert-pentyl, nhóm neopentyl, nhóm 2,3-dimethylpropyl, nhóm 1-ethylpropyl, nhóm 1-methylbutyl, nhóm 2-methylbutyl, nhóm n-hexyl, nhóm isohexyl, nhóm 2-hexyl, nhóm 3-hexyl, nhóm 2-methylpentyl, nhóm 3-methylpentyl, nhóm 1,1,2-trimethyl propyl, nhóm 3,3-dimethylbutyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2-C_6) alkenyl” nhằm để chỉ nhóm alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm vinyl, nhóm allyl, nhóm isopropenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 2-methyl-2-propenyl, nhóm 1-methyl-2-propenyl, nhóm 2-methyl-1-propenyl, nhóm pentenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 3,3-dimethyl-1-butenyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2-C_6) alkynyl” nhằm để chỉ nhóm alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butylnyl, nhóm 2-butylnyl, nhóm 3-butylnyl, nhóm 3-methyl-1-propynyl, nhóm 2-methyl-3-propynyl, nhóm pentynyl, nhóm 1-hexynyl, nhóm 3-methyl-1-butylnyl, nhóm 3,3-dimethyl-1-butylnyl hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl” nhằm để chỉ nhóm alkyl vòng gồm từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_1-C_6) alkoxy” nhằm để chỉ nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm isopropoxy, nhóm n-butoxy, nhóm sec-butoxy, nhóm tert-butoxy, nhóm n-pentyloxy, nhóm isopentyloxy, nhóm tert-pentyloxy, nhóm neopentyloxy, nhóm 2,3-dimethylpropyloxy, nhóm 1-ethylpropyloxy, nhóm 1-methylbutyloxy, nhóm n-hexyloxy, nhóm isohexyloxy, nhóm 1,1,2-trimethylpropyloxy hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2-C_6) alkenyloxy” nhằm để chỉ nhóm alkenyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenyloxy, nhóm butenyloxy, nhóm pentenyloxy, nhóm hexenyloxy hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2-C_6) alkynyloxy” nhằm để chỉ nhóm alkynyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynyloxy, nhóm butynyloxy, nhóm pentynyloxy, nhóm hexynyloxy hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C_1-C_6) alkylthio” nhằm để chỉ nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch

nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylthio, nhóm ethylthio, nhóm n-propylthio, nhóm isopropylthio, nhóm n-butylthio, nhóm sec-butylthio, nhóm tert-butylthio, nhóm n-pentylthio, nhóm isopentylthio, nhóm tert-pentylthio, nhóm neopentylthio, nhóm 2,3-dimethylpropylthio, nhóm 1-ethylpropylthio, nhóm 1-methylbutylthio, nhóm n-hexylthio, nhóm isohexylthio, nhóm 1,1,2-trimethylpropylthio hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_1 - C_6) alkylsulfanyl” nhằm để chỉ nhóm alkylsulfanyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylsulfanyl, nhóm ethylsulfanyl, nhóm n-propylsulfanyl, nhóm isopropylsulfanyl, nhóm n-butylsulfanyl, nhóm sec-butylsulfanyl, nhóm tert-butylsulfanyl, nhóm n-pentylsulfanyl, nhóm isopentylsulfanyl, nhóm tert-pentylsulfanyl, nhóm neopentylsulfanyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfanyl, nhóm 1-ethylpropylsulfanyl, nhóm 1-methylbutylsulfanyl, nhóm n-hexylsulfanyl, nhóm isohexylsulfanyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfanyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_1 - C_6) alkylsulfonyl” nhằm để chỉ nhóm alkylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylsulfonyl, nhóm ethylsulfonyl, nhóm n-propylsulfonyl, nhóm isopropylsulfonyl, nhóm n-butylsulfonyl, nhóm sec-butylsulfonyl, nhóm tert-butylsulfonyl, nhóm n-pentylsulfonyl, nhóm isopentylsulfonyl, nhóm tert-pentylsulfonyl, nhóm neopentylsulfonyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfonyl, nhóm 1-ethylpropylsulfonyl, nhóm 1-methylbutylsulfonyl, nhóm n-hexylsulfonyl, nhóm isohexylsulfonyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C_2 - C_6) alkenylthio” nhằm để chỉ nhóm alkenylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenylthio, nhóm butenylthio, nhóm pentenylthio, nhóm hexenylthio hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2 - C_6) alkynylthio” nhằm để chỉ nhóm alkynylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynylthio, nhóm butynylthio, nhóm pentynylthio, nhóm hexynylthio hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C_2 - C_6) alkenylsulfanyl” nhằm để chỉ nhóm alkenylsulfanyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenylsulfanyl, nhóm butenylsulfanyl, nhóm pentenylsulfanyl, nhóm hexenylsulfanyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C_2 - C_6) alkynylsulfanyl” nhằm để chỉ nhóm alkynylsulfanyl mạch

thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynylsulfinyl, nhóm butynylsulfinyl, nhóm pentynylsulfinyl, nhóm hexynylsulfinyl hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C₂-C₆) alkenylsulfonyl” nhằm để chỉ nhóm alkenylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenylsulfonyl, nhóm butenylsulfonyl, nhóm pentenylsulfonyl, nhóm hexenylsulfonyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C₂-C₆) alkynylsulfonyl” nhằm để chỉ nhóm alkynylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynylsulfonyl, nhóm butynylsulfonyl, nhóm pentynylsulfonyl, nhóm hexynylsulfonyl hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C₃-C₆) xycloalkoxy” nhằm để chỉ nhóm alkoxy vòng gồm từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropoxy, nhóm xyclobutoxy, nhóm xyclopentyloxy, nhóm xyclohexyloxy hoặc các nhóm tương tự, “Nhóm (C₃-C₆) xycloalkylthio” nhằm để chỉ nhóm alkylthio dạng vòng từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylthio, nhóm xyclobutylthio, nhóm xyclopentylthio, nhóm xyclohexylthio hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” nhằm để chỉ nhóm alkylsulfinyl vòng gồm từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylsulfinyl, nhóm xyclobutylsulfinyl, nhóm xyclopentylsulfinyl, nhóm xyclohexylsulfinyl hoặc các nhóm tương tự. “Nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl” nhằm để chỉ nhóm alkylsulfonyl vòng gồm từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylsulfonyl, nhóm xyclobutylsulfonyl, nhóm xyclopentylsulfonyl, nhóm xyclohexylsulfonyl hoặc các nhóm tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkyl”,

“nhóm (C₂-C₆) alkenyl”,

“nhóm (C₂-C₆) alkynyl”,

“nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl”,

“nhóm (C₃-C₆) xycloalkyloxy”,

“nhóm (C₁-C₆) alkoxy”,

“nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy”,

“nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy”,
 “nhóm (C₁-C₆) alkylthio”,
 “nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl”,
 “nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkenylthio”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkynylthio”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkenylsulfinyl”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkynylsulfinyl”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkenylsulfonyl”,
 “nhóm (C₂-C₆) alkynylsulfonyl”,
 “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylthio”,
 “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” và
 “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl” nêu trên

có thể được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen ở (các) vị trí thế, và trong trường hợp mà nhóm bất kỳ trong số các nhóm được liệt kê nêu trên được thế bằng hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen này có thể giống nhau hoặc khác nhau.

“Các nhóm được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen” nêu trên được biểu thị là

“nhóm halo (C₁-C₆) alkyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkynyl”,
 “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl”,
 “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyloxy”,
 “nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy”,

“nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy”,
 “nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio”,
 “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl”,
 “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylthio”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylthio”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylsulfinyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylsulfinyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkenylsulfonyl”,
 “nhóm halo (C₂-C₆) alkynylsulfonyl”,
 “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylthio”,
 “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” và
 “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl”.

Mỗi sự thể hiện “(C₁-C₆)”, “(C₂-C₆)”, “(C₃-C₆)”, v.v... nhằm để chỉ khoảng số nguyên tử cacbon trong mỗi nhóm. Định nghĩa tương tự cũng đúng đối với các nhóm mà trong đó hai hoặc nhiều nhóm nêu trên được tạo cặp với nhau, và ví dụ, “nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl” nghĩa là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon được liên kết với nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh gồm từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon.

“Vòng béo có từ 3 đến 6 phần tử” mà do R⁵ và R⁶ được liên kết với cùng một nguyên tử cacbon được liên kết với nhau tạo ra được minh họa bởi nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl và nhóm xyclohexyl. “Vòng thơm hoặc vòng dị vòng thơm” mà do R³ và R⁴ được kết hợp tạo ra được minh họa bởi nhóm quinolyl hoặc naphtyl có vòng phenyl được tạo ra từ R³ và R⁴.

“Nhóm aryl” nhằm để chỉ nhóm hydrocacbon thơm gồm từ 6 đến 10 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm phenyl, nhóm 1-naphtyl, nhóm 2-naphtyl hoặc các nhóm tương tự. Được ưu tiên đặc biệt là nhóm phenyl.

“Nhóm dị vòng” và “vòng dị vòng” nhằm để chỉ nhóm thơm đơn vòng có 5- hoặc

6 phần tử hoặc nhóm dị vòng không thơm đơn vòng có 4 đến 6 phần tử chứa, làm nguyên tử của vòng, một hoặc nhiều nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh và nguyên tử nitơ; và cũng nhằm để chỉ nhóm dị vòng thơm ngưng tụ được tạo ra bởi sự ngưng tụ dị vòng thơm đơn vòng này với vòng benzen hoặc nhóm dị vòng không thơm ngưng tụ được tạo ra bởi sự ngưng tụ dị vòng không thơm đơn vòng này với vòng benzen.

Các ví dụ về “nhóm dị vòng thơm” bao gồm nhóm dị vòng thơm đơn vòng như furyl, thienyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyreryl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl và triazinyl; và nhóm dị vòng thơm ngưng tụ như quinolyl, isoquinolyl, quinazolyl, quinoxalyl, benzofuranyl, benzothienyl, benzoxazolyl, benzisoxazolyl, benzothiazolyl, benzimidazolyl, benzotriazolyl, indolyl, indazolyl, pyrolopyrazinyl, imidazopyridinyl, imidazopyrazinyl, pyrazolopyridinyl, pyrazolothienyl và pyrazolotriazinyl.

Các ví dụ về “nhóm dị vòng không thơm” bao gồm nhóm dị vòng không thơm đơn vòng như oxetanyl, thietanyl, azetidiny, pyrrolidinyl, pyrrolidinyl-2-on, piperidinyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, piperazinyl, hexametyleniminyl, oxazolidinyl, thiazolidinyl, imidazolidinyl, oxazolinyl, thiazolinyl, isoxazolinyl, imidazolinyl, dioxolyl, dioxolanyl, dihydrooxadiazolyl, 2-oxo-pyrrolidin-1-yl, 2-oxo-1,3-oxazolidin-5-yl, 5-oxo-1,2,4-oxadiazolin-3-yl, 1,3-dioxolan-2-yl, 1,3-dioxan-2-yl, 1,3-dioxepan-2-yl, pyranly, tetrahydropyranly, thiopyranly, tetrahydrothiopyranly, 1-oxit tetrahydrothiopyranly, 1,1-dioxit tetrahydrothiopyranly, tetrahydrofuranyl, dioxanyl, pyrazolidinyl, pyrazolinyl, tetrahydropyrimidinyl, dihydrotriazolyl và tetrahydrotriazolyl.

Các ví dụ ưu tiên về “nhóm dị vòng” bao gồm isoxazolyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridyl, pyrazolyl, thiazolyl, thienyl, pyreryl, benzimidazolyl, benzofuranyl, benzothienyl, pyrrolidinyl-2-on.

Các ví dụ về muối của hợp chất 3H-pyrollopyridin có công thức chung (1) theo sáng chế và N-oxit của chúng bao gồm các muối của axit vô cơ như hydroclorua, sulfat, nitrat và photphat; các muối của axit hữu cơ như axetat, fumarat, maleat, oxalat,

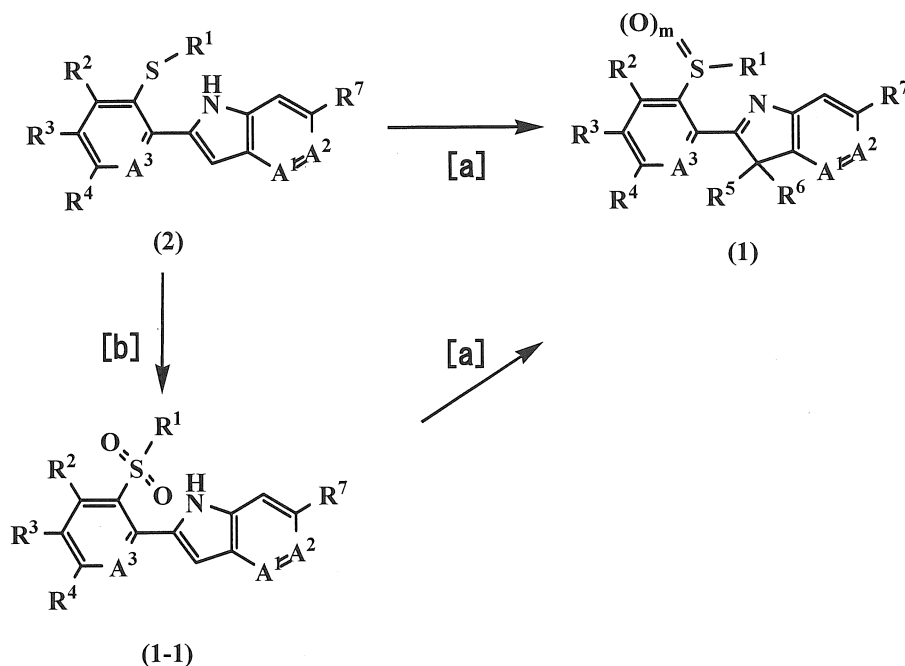
metansulfonat, benzensulfonat và p-toluensulfonat; và các muối với bazơ hữu cơ hoặc vô cơ như ion natri, ion kali, ion canxi và ion trimetylamoni.

Hợp chất 3H-pyrolopyridin có công thức chung (1) theo sáng chế, N-oxit của chúng và muối của chúng có thể có một hoặc nhiều tâm đối xứng trong công thức cấu tạo, và có thể tồn tại ở dạng hai hoặc nhiều chất đồng phân hoặc chất đồng phân không đối quang quang học. Tất cả chất đồng phân quang học và hỗn hợp của chất đồng phân này ở tỷ lệ bất kỳ cũng được bao gồm bởi sáng chế. Hơn nữa, hợp chất có công thức chung (1) theo sáng chế, N-oxit của chúng và muối của chúng có thể tồn tại ở dạng hai loại chất đồng phân hình học do liên kết đôi cacbon-cacbon hoặc liên kết đôi cacbon-nitơ trong công thức cấu tạo. Tất cả chất đồng phân hình học và hỗn hợp của chất đồng phân này ở tỷ lệ bất kỳ cũng được bao gồm bởi sáng chế.

Hợp chất 3H-pyrolopyridin theo sáng chế, oxit của nó hoặc muối của chúng có thể được điều chế theo, ví dụ, phương pháp điều chế được mô tả sau đây, mà là ví dụ không giới hạn theo sáng chế.

Phương pháp điều chế 1

[Công thức hóa học 2]



Trong công thức này, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, A², A³ và m là như được xác định ở trên.

Phương pháp điều chế tại [Bước a]

Hợp chất có công thức chung (1) có thể được điều chế từ hợp chất 1H-pyrololopyridin (2), mà được điều chế theo phương pháp được mô tả trong tài liệu WO 2014/157600, theo phương pháp được mô tả trong tài liệu sáng chế (Organic Letters, 13 (17), 4498-4501, 2011).

Ở bước này, thuốc thử flo hóa được sử dụng cho quá trình đưa nguyên tử flo làm R^5 hoặc R^6 , và các ví dụ về thuốc thử flo hóa mà có thể được sử dụng bao gồm N-flo-N'-(clometyl)triethylendiamin bis(tetrafloborat) (Selectfluor), $(PhSO_2)_2NF$ và N-flopyridin triflat. Được ưu tiên là Selectfluor. Lượng thuốc thử flo hóa được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol so với 1 mol hợp chất (2).

Bước này thường được thực hiện với sự có mặt của bazơ. Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, bari hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat và xesi cacbonat; và các amin như triethylamin, pyridin và piperidin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol so với 1 mol hợp chất (2).

Dung môi hữu cơ được sử dụng trong phản ứng này không được giới hạn cụ thể và có thể là dung môi bất kỳ trợ đối với phản ứng. Các ví dụ về dung môi hữu cơ bao gồm các dung môi nitril như axetonitril và benzonitril; nước; và dung môi trộn của hai hoặc nhiều loại trong số chúng.

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này thường là nằm trong khoảng từ $-20^{\circ}C$ đến nhiệt độ sôi của dung môi được sử dụng. Thời gian phản ứng thường là vài phút đến mười hai giờ. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất của sáng chế được tách ra từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần thiết, sự kết tinh lại, sắc ký cột, v.v... có thể được sử dụng để tinh chế hợp chất của sáng chế.

Phương pháp điều chế tại [Bước b]

Hợp chất có công thức chung (1-1) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất 1H-pyrololopyridin có công thức chung (2) với chất oxy hóa trong dung môi trơ và thực hiện quy trình được mô tả trong tài liệu sáng chế (Journal of Organic Chemistry, 18, 2784, 1964).

Các ví dụ về chất oxy hóa được sử dụng cho quá trình oxy hóa trong phản ứng

này bao gồm các peroxit như dung dịch hydro peroxit, axit perbenzoic và axit m-cloperoxybenzoic. Lượng chất oxy hóa được sử dụng được chọn thích hợp từ vùng nằm trong khoảng từ 2 đến 5 lần lượng mol so với hợp chất 1H-pyrololopyridin có công thức chung (2).

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ức chế đáng kể phản ứng, và các ví dụ bao gồm hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon được halogen hóa như metylen clorua và clorofom; hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; nitril như axetonitril; các este như etyl axetat; các axit hữu cơ như axit formic và axit axetic; và các dung môi phân cực như nước. Một trong số các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp.

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

Theo một cách khác, hợp chất sulfonyl thu được có thể được đưa vào bước khử mà không tinh chế để chuyển hóa thành hợp chất sulfinyl.

Các ví dụ về chất khử được sử dụng trong bước khử này bao gồm phospho triclorea. Lượng chất khử được sử dụng được chọn thích hợp từ khoảng từ 2 đến 10 lần lượng mol so với oxit.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ức chế đáng kể phản ứng, và các ví dụ bao gồm hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon được halogen hóa như metylen clorua và clorofom; hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các nitril như axetonitril; các este như etyl axetat; các axit hữu cơ như axit formic và axit axetic; và các dung môi phân cực như nước. Một trong số các dung môi trơ có thể được sử dụng

một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp.

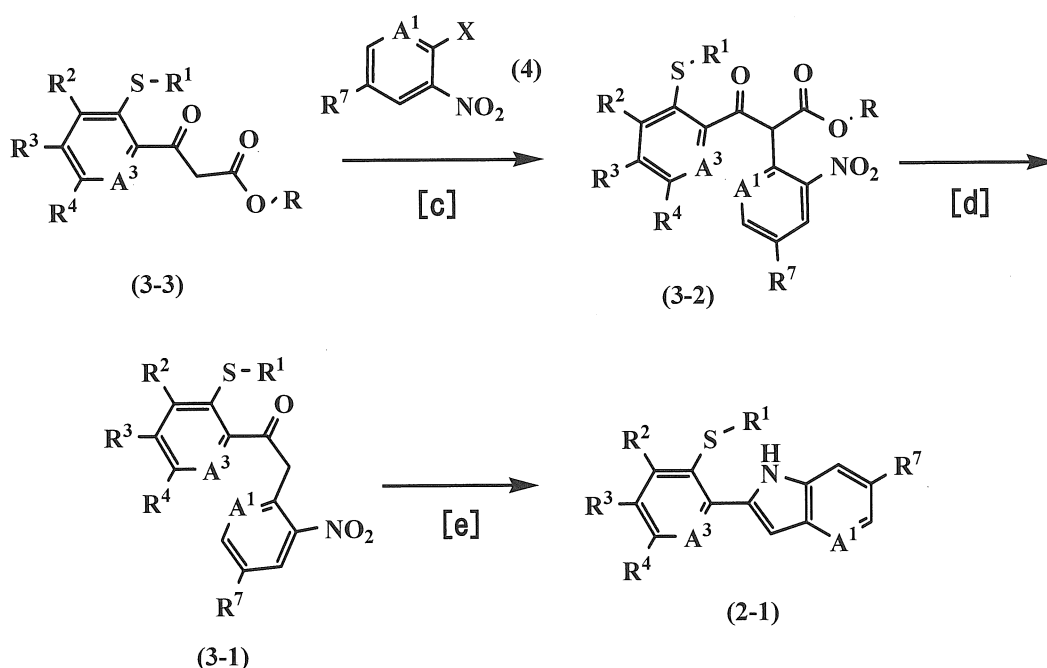
Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này được chọn thích hợp từ khoảng -10°C đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự không giống nhau trong mọi trường hợp, nhưng về cơ bản được chọn thích hợp từ khoảng vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất thu được 1H-pyrololopyridin có công thức chung (1-1) được tách ra từ hỗn hợp phản ứng sau bằng phương pháp thông thường. Khi cần thiết, sự kết tinh lại, sắc ký cột, v.v... có thể được sử dụng cho quá trình tinh chế hợp chất theo sáng chế.

Từ hợp chất 1H-pyrololopyridin có công thức chung (1-1), hợp chất 3H-pyrololopyridin có công thức chung (1) có thể được điều chế theo phương pháp tương tự như được mô tả trong bước [a] nêu trên.

Hợp chất trung gian có công thức chung (2-1) có thể được điều chế theo phương pháp sau.

Phương pháp điều chế hợp chất trung gian

[Công thức hóa học 3]



Trong công thức, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , A^1 và A^3 là như được xác định ở trên, X là nguyên tử halogen, và R là nhóm alkyl bậc ba như nhóm t-butyl và nhóm 1-phenyl-2-methylpropan-2-yl.

Phương pháp điều chế tại [Bước c]

Hợp chất β -ketoeste có công thức chung (3-3) được điều chế bằng quá trình ngưng tụ Claisen (Org. React. 1942, 1, 266) este của axit carboxylic thơm và este của axit axetic và /hoặc sự trao đổi este được phản ứng với hợp chất nitro được halogen hóa có công thức chung (4) với sự có mặt của bazơ trong dung môi trơ để tạo ra hợp chất có công thức chung (3-2).

Dung môi hữu cơ được sử dụng không được giới hạn cụ thể và có thể là dung môi bất kỳ trơ đối với phản ứng. Các ví dụ về dung môi hữu cơ bao gồm các dung môi ete như dioxan, 1,2-dimetoxyetan và tetrahydrofuran; các dung môi hydrocacbon thơm như dung môi toluen, benzen và xilen; amit như N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit và N-metylpyrrolidon; và dung môi trộn của hai hoặc nhiều loại trong số chúng.

Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, bari hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat và kali photphat; các alkoxit như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; các hydrua kim loại kiềm như natri hydrua và kali hydrua; và các amin như trietylamin, pyridin và piperidin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol so với 1 mol của hợp chất (3-3).

Do phản ứng này là phản ứng đẳng mol của hợp chất (3-3) và hợp chất (4), chúng về cơ bản là được sử dụng với lượng mol bằng nhau, nhưng trong số chúng có thể được sử dụng với lượng vượt quá.

Nhiệt độ phản ứng thường trong khoảng nhiệt độ phòng đến nhiệt độ sôi của dung môi được sử dụng. Thời gian phản ứng thường là vài phút đến mười hai giờ. Phản ứng về cơ bản là được thực hiện trong môi trường khí trơ. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất theo sáng chế được tách ra từ hỗn hợp phản ứng sau bằng phương pháp thông thường. Khi cần thiết, sự kết tinh lại, sắc ký cột, v.v... có thể được sử dụng cho quá trình tinh chế của hợp chất theo sáng chế.

Phương pháp điều chế tại [Bước d]

Hợp chất có công thức chung (3-2) được xử lý bằng axit với sự có mặt hoặc

không có mặt của dung môi để tạo ra hợp chất có công thức chung (3-1).

Các ví dụ về axit được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các axit vô cơ như axit clohydric, axit sulfuric và axit nitric; các axit hữu cơ như axit formic, axit axetic, axit propionic, axit trifloaxetic và axit benzoic; và các axit sulfonic như axit metansulfonic và trifloaxit metansulfonic. Lượng axit được sử dụng được chọn thích hợp từ khoảng là 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất este có công thức chung (3-2). Trong một số trường hợp, axit cũng có thể được sử dụng làm dung môi.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ức chế đáng kể quá trình phản ứng, và các ví dụ bao gồm hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylene; hydrocacbon được halogen hóa như metylen clorua, clorofom và cacbon tetrachlorua; hydrocacbon thơm được halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; các amit như dimetylformamit và dimetylaxetamit; các xeton như axeton và metyl etyl xeton; và các dung môi phân cực như 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Một trong số các dung môi trơ có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp. Trong trường hợp mà axit được sử dụng làm dung môi, thì không cần thiết phải sử dụng dung môi khác.

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

Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất theo sáng chế được tách ra từ hỗn hợp phản ứng sau bằng phương pháp thông thường. Khi cần thiết, sự kết tinh lại, sắc ký cột, v.v... có thể được sử dụng cho quá trình tinh chế của hợp chất theo sáng chế.

Phương pháp điều chế tại [Bước e]

Phản ứng ở bước này là quá trình khử và quá trình khử nước của hợp chất nitro có công thức chung (3-1) để điều chế hợp chất 1H-pyrololopyridin có công thức chung (2-1).

Đối với quá trình khử nêu trên, các điều kiện cho quá trình khử các nhóm nitro được mô tả trong tài liệu sáng chế đã biết (xem "New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza)", tập 15, Oxidation and Reduction II, 1977,

được biên tập bởi Chemical Society of Japan, được công bố bởi Maruzen) có thể được sử dụng.

Các ví dụ về dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các rượu như metanol và etanol; các ete như tetrahydrofuran và dioxan; các axit hữu cơ như axit formic và axit axetic; và nước. Một trong số các dung môi trơ có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp. Dung dịch chứa nước của axit được sử dụng làm chất khử trong phản ứng này cũng có thể được sử dụng làm dung môi trơ.

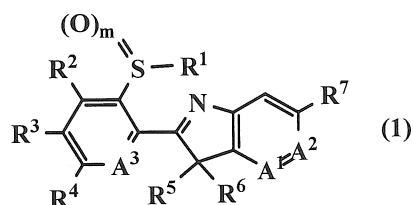
Các ví dụ về chất khử mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm kim loại-axit và kim loại-muối. Các ví dụ về kim loại bao gồm sắt, thiếc và kẽm, các ví dụ về axit bao gồm các axit vô cơ như axit clo hydric và axit sulfuric và các axit hữu cơ như axit axetic, và các ví dụ về muối bao gồm kẽm clorua và amoni clorua. Các kim loại này có thể được sử dụng kết hợp, các axit này có thể được sử dụng kết hợp, và các muối này có thể được sử dụng kết hợp. Đối với lượng chất khử được sử dụng, lượng kim loại được chọn thích hợp nằm trong khoảng từ 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất nitro có công thức chung (3-1), và lượng axit hoặc muối được chọn thích hợp nằm trong khoảng từ 0,05 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất nitro có công thức chung (3-1). Nhiệt độ phản ứng có thể được chọn nằm trong khoảng từ 0 đến 150°C. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự, nhưng về cơ bản được chọn thích hợp là từ khoảng vài phút đến khoảng 48 giờ. Quá trình khử ở bước này cũng có thể được thực hiện bởi sự hydro hóa xúc tác với sự có mặt của chất xúc tác. Các ví dụ về chất xúc tác bao gồm paladi cacbon. Sau khi phản ứng được hoàn thành, hợp chất theo sáng chế được tách ra từ hỗn hợp phản ứng sau bằng phương pháp thông thường. Khi cần thiết, sự kết tinh lại, sự chưng cất, sắc ký cột, v.v.. có thể được sử dụng cho quá trình tinh chế của hợp chất theo sáng chế. Hợp chất 1H-pyrololopyridin có công thức chung (2-1) được điều chế theo sơ đồ điều chế nêu trên được đưa vào phản ứng theo phương pháp điều chế 1 để tạo ra hợp chất 3H-pyrololopyridin có công thức chung (1).

Hợp chất trung gian cũng có thể được điều chế theo phương pháp điều chế được mô tả trong tài liệu WO 2014/157600.

Các ví dụ cụ thể về hợp chất theo sáng chế được thể hiện dưới đây. Trong các bảng dưới đây, Me là viết tắt của nhóm metyl, Et là viết tắt của nhóm etyl, n-Pr là viết tắt của nhóm n-propyl, i-Pr là viết tắt của nhóm isopropyl, c-Pr là viết tắt của nhóm xyclopropyl, t-Bu là viết tắt của nhóm tert-butyl, c-Pent là viết tắt của nhóm xyclopentyl, Ph là viết tắt của nhóm phenyl, Bn là viết tắt của nhóm benzyl, Py là viết tắt của nhóm pyridyl; Pyrazol là viết tắt của nhóm pyrazolyl, Pyrol là viết tắt của nhóm pyrolyl, Triazol là viết tắt của nhóm triazolyl, Pyrimidin là viết tắt của nhóm pyrimidyl, Thiazol là viết tắt của nhóm thiazolyl, Pyrolid là viết tắt của nhóm pyrolidiny, Isoxazol là viết tắt của nhóm isoxazolyl, Isoxazolin là viết tắt của nhóm isoxazolinyl, Thiophen là viết tắt của nhóm thienyl, Benzofuran là viết tắt của nhóm benzofuranyl, và Benzothiophen là viết tắt của nhóm benzothiienyl.

Được thể hiện trong cột “tính chất vật lý” là nhiệt độ sôi (°C) hoặc “NMR”. Dữ liệu NMR được thể hiện trong bảng 4.

[Công thức hóa học 4]



[Bảng 1]

Hợp chất số	A ¹	A ³	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-1	N	CH	CF ₃	F	F	CF ₃	2	120-122
1-2	N	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et	CF ₃	1	142-144
1-3	N	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et	CF ₃	2	165-167
1-4	N	CH	CF ₃	F	F	CF ₂ CF ₃	2	NMR
1-5	N	CH	CF ₃	F	CN	CF ₃	2	NMR
1-6	N	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me	CF ₃	2	NMR
1-7	N	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me	CF ₃	1	NMR
1-8	N	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me	CF ₃	1	NMR
1-9	N	N	CF ₃	F	F	CF ₃	1	NMR

1-10	N	N	CF ₃	F	F	CF ₃	2	NMR
1-11	N	N	I	F	F	CF ₃	2	156-158
1-12	N	N	I	F	F	CF ₃	1	170-172
1-13	N ⁺ -O ⁻	N	I	F	F	CF ₃	1	160-161
1-14	N	N	c-Pr	F	F	CF ₃	0	165-166
1-15	N	N	c-Pr	F	F	CF ₃	1	150-151
1-16	N	N	c-Pr	F	F	CF ₃	2	120-121
1-17	N	N	Ph	F	F	CF ₃	2	
1-18	N	N	3-F-Ph	F	F	CF ₃	2	186-187
1-19	N	N	4-F-Ph	F	F	CF ₃	2	179-180
1-20	N	N	3-CF ₃ -Ph	F	F	CF ₃	2	137-138
1-21	N	N	4-CF ₃ -Ph	F	F	CF ₃	2	163-164

A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và mỗi R² và R⁴ là nguyên tử hydro.

[Bảng 2]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-22	1-me-Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-23	1-CHF ₂ -Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-24	1-me-5-OMe-Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-25	1-me-5-OCHF ₂ -Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-26	3-OCHF ₂ -Pyrazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-27	3-Br-Pyrol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-28	1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-29	3-me-1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-30	3-CF ₃ -1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-31	CH=NOH	F	F	CF ₃	2	
1-32	CH=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-33	CH=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-34	CH=NOCH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	136-137
1-35	CH=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-36	C(Me)=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-37	C(Me)=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-38	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-39	C(Me)=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-40	C(CF ₃)=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-41	C(CF ₃)=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	

1-42	C(CF ₃)=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-43	5-CF ₃ -Py-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-44	Pyrimidin-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-45	CO ₂ H	F	F	CF ₃	2	
1-46	CO ₂ Et	F	F	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và mỗi R² và R⁴ là nguyên tử hydro.

[Bảng 3]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-47	CO ₂ -i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-48	CO ₂ -t-Bu	F	F	CF ₃	2	
1-49	CONH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-50	CONH-CH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-51	CON(Me)Et	F	F	CF ₃	2	
1-52	NH ₂	F	F	CF ₃	2	
1-53	NHCOMe	F	F	CF ₃	2	
1-54	NHCO-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-55	NHCOPh	F	F	CF ₃	2	
1-56	NHCO ₂ Me	F	F	CF ₃	2	
1-57	NHCO ₂ -i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-58	NHCO ₂ -t-Bu	F	F	CF ₃	2	
1-59	NHCONHMe	F	F	CF ₃	2	
1-60	NHCONH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-61	NHCONH-t-Bu	F	F	CF ₃	2	
1-62	i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-63	SMe	F	F	CF ₃	2	
1-64	SO ₂ Me	F	F	CF ₃	2	
1-65	SEt	F	F	CF ₃	2	
1-66	SO ₂ Et	F	F	CF ₃	2	
1-67	SCF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-68	SOCF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-69	OCHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-70	OH	F	F	CF ₃	2	
1-71	OEt	F	F	CF ₃	2	165-167

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và mỗi R² và R⁴ là nguyên tử hydro.

[Bảng 4]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-72	OCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-73	NHCSNH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-74	NHCSNH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-75	5-me-Thiazol-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-76	5-me-Isoxazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-77	Bn	F	F	CF ₃	2	
1-78	4-F-Bn	F	F	CF ₃	2	
1-79	4-CF ₃ -Bn	F	F	CF ₃	2	
1-80	4-F-BnO	F	F	CF ₃	2	
1-81	4-CF ₃ -BnO	F	F	CF ₃	2	199-201
1-82	4-F-BnNH	F	F	CF ₃	2	
1-83	4-CF ₃ -BnNH	F	F	CF ₃	2	
1-84	Pyrolid-2-on-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-85	5,5-me ₂ -Isoxazolin-3-yl	F	F	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nito, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và mỗi R² và R⁴ là nguyên tử hydro.

[Bảng 5]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-86	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	2	
1-87	CF ₃	H	F	F	OCH ₂ CF ₃	2	
1-88	CF ₃	H	F	F	SCF ₃	2	
1-89	CF ₃	H	F	F	N(Me)CH ₂ CF ₃	2	
1-90	CF ₃	H	F	F	Br	2	
1-91	CF ₃	H	c-Pr		CF ₃	2	
1-92	CF ₃	H	c-Pent		CF ₃	2	
1-93	CF ₃	H	SMe	SMe	CF ₃	2	
1-94	CF ₃	H	F	SO ₂ Me	CF ₃	2	
1-95	H	CF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-96	H	I	F	F	CF ₃	2	
1-97	H	c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-98	H	Ph	F	F	CF ₃	2	

1-99	H	3-F-Ph	F	F	CF ₃	2	189-190
1-100	H	4-F-Ph	F	F	CF ₃	2	217-218
1-101	H	3-CF ₃ -Ph	F	F	CF ₃	2	
1-102	H	4-CF ₃ -Ph	F	F	CF ₃	2	
1-103	H	1-me-Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-104	H	1-CHF ₂ -Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-105	H	1-me-5-OMe-Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-106	H	1-me-5-OCHF ₂ -Pyrazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-107	H	3-OCHF ₂ -Pyrazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-108	H	3-Br-Pyrol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-109	H	1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	223-224
1-110	H	3-me-1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-111	H	3-CF ₃ -1,2,4-triazol-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-112	H	CH=NOH	F	F	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 6]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-113	H	CH=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-114	H	CH=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-115	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-116	H	CH=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-117	H	C(Me)=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-118	H	C(Me)=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-119	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-120	H	C(Me)=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-121	H	C(CF ₃)=NOEt	F	F	CF ₃	2	
1-122	H	C(CF ₃)=NOCH ₂ CHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-123	H	C(CF ₃)=NOCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-124	H	5-CF ₃ -Py-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-125	H	Pyrimidin-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-126	H	CO ₂ H	F	F	CF ₃	2	
1-127	H	CO ₂ Et	F	F	CF ₃	2	
1-128	H	CO ₂ -i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-129	H	CO ₂ -t-Bu	F	F	CF ₃	2	
1-130	H	CONH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-131	H	CONH-CH ₂ CF ₃	F	F	CF ₃	2	

1-132	H	CON(Me)Et	F	F	CF ₃	2	
1-133	H	NH ₂	F	F	CF ₃	2	
1-134	H	NHCOMe	F	F	CF ₃	2	
1-135	H	NHCO-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-136	H	NHCOPh	F	F	CF ₃	2	
1-137	H	NHCO ₂ Me	F	F	CF ₃	2	
1-138	H	NHCO ₂ -i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-139	H	NHCO ₂ -t-Bu	F	F	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 7]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ₃	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-140	H	NHCONHMe	F	F	CF ₃	2	
1-141	H	NHCONH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-142	H	NHCONH-t-Bu	F	F	CF ₃	2	
1-143	H	i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-144	H	SMe	F	F	CF ₃	2	
1-145	H	SO ₂ Me	F	F	CF ₃	2	
1-146	H	SEt	F	F	CF ₃	2	
1-147	H	SO ₂ Et	F	F	CF ₃	2	
1-148	H	SCF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-149	H	SOCF ₃	F	F	CF ₃	2	
1-150	H	OCHF ₂	F	F	CF ₃	2	
1-151	H	OH	F	F	CF ₃	2	
1-152	H	OEt	F	F	CF ₃	2	
1-153	H	OCH ₂ -c-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-154	H	NHCSNH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-155	H	NHCSNH-i-Pr	F	F	CF ₃	2	
1-156	H	5-me-Thiazol-2-yl	F	F	CF ₃	2	
1-157	H	5-me-Isoxazol-3-yl	F	F	CF ₃	2	
1-158	H	Bn	F	F	CF ₃	2	
1-159	H	4-F-Bn	F	F	CF ₃	2	
1-160	H	4-CF ₃ -Bn	F	F	CF ₃	2	
1-161	H	4-F-BnO	F	F	CF ₃	2	
1-162	H	4-CF ₃ -BnO	F	F	CF ₃	2	
1-163	H	4-F-BnNH	F	F	CF ₃	2	
1-164	H	4-CF ₃ -BnNH	F	F	CF ₃	2	

1-165	H	Pyrolid-2-on-1-yl	F	F	CF ₃	2	
1-166	H	5,5-me ₂ -Isoxazolin-3-yl	F	F	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 8]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-167	3-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-168	3-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-169	4-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	185-186
1-170	4-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-171	3-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	80-81
1-172	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-173	4-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-174	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	164-165
1-175	CF ₃	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-176	CF ₃	H	Cl	Cl	CF ₃	2	174-175
1-177	CF ₃	H	F	Me	CF ₃	2	191-192
1-178	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	2	
1-179	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	2	
1-180	I	H	F	Cl	CF ₃	2	90-91
1-181	I	H	Cl	Cl	CF ₃	2	196-197
1-182	c-Pr	H	F	Cl	CF ₃	2	158-159
1-183	c-Pr	H	Cl	Cl	CF ₃	2	181-182
1-184	4-Cl-Ph	H	F	F	CF ₃	2	194-195
1-185	4-Cl-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-186	4-Cl-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-187	4-Br-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-188	4-Br-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-189	4-Br-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-190	H	3-F-Ph	F	Cl	CF ₃	2	
1-191	H	3-F-Ph	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-192	H	4-F-Ph	F	Cl	CF ₃	2	
1-193	H	4-F-Ph	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-194	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	F	CF ₃	2	92-94
1-195	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-196	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 9]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-197	4-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-198	4-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-199	4-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-200	Py-3-yl	H	F	F	CF ₃	2	120-121
1-201	Py-3-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-202	Py-3-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	96-97
1-203	2,3-F ₂ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-204	2,3-F ₂ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-205	2,3-F ₂ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-206	2,5-F ₂ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-207	2,5-F ₂ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-208	2,5-F ₂ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-209	3,5-F ₂ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	134-135
1-210	3,5-F ₂ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	200-201
1-211	3,5-F ₂ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	209-210
1-212	Thiophen-3-yl	H	F	F	CF ₃	2	203-204
1-213	Thiophen-3-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-214	Thiophen-3-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-215	2,4-F ₂ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-216	2,4-F ₂ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-217	2,4-F ₂ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-218	3,4-F ₂ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-219	3,4-F ₂ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-220	3,4-F ₂ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-221	Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-222	Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-223	Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-224	2-CF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	123-124
1-225	2-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-226	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	133-134

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 10]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-227	2-F-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-228	2-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-229	2-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-230	2-OCF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-231	2-OCF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-232	2-OCF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-233	3-OCF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-234	3-OCF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-235	3-OCF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-236	4-OCF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-237	4-OCF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-238	4-OCF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-239	3-Cl-Ph	H	F	F	CF ₃	2	152-153
1-240	3-Cl-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-241	3-Cl-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	145-146
1-242	2-Cl-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-243	2-Cl-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-244	2-Cl-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-245	2-SMe-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-246	2-SMe-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-247	2-SMe-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-248	3-SMe-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-249	3-SMe-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-250	3-SMe-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-251	4-SMe-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-252	4-SMe-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-253	4-SMe-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-254	2-CN-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-255	2-CN-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-256	2-CN-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 11]

Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-257	3-CN-Ph	H	F	F	CF ₃	2	196-197

1-258	3-CN-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-259	3-CN-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-260	4-CN-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
1-261	4-CN-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-262	4-CN-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-263	Py-4-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-264	Py-4-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-265	Py-4-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-266	Py-2-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-267	Py-2-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-268	Py-2-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-269	Thiophen-2-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-270	Thiophen-2-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-271	Thiophen-2-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-272	1-me-Pyrazol-5-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-273	1-me-Pyrazol-5-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-274	1-me-Pyrazol-5-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-275	Pyrimidin-5-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-276	Pyrimidin-5-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-277	Pyrimidin-5-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-278	Benzofuran-2-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-279	Benzofuran-2-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-280	Benzofuran-2-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-281	Benzothiophen-2-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-282	Benzothiophen-2-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-283	Benzothiophen-2-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-284	2-me-Thiazol-4-yl	H	F	F	CF ₃	2	
1-285	2-me-Thiazol-4-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-286	2-me-Thiazol-4-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 12]

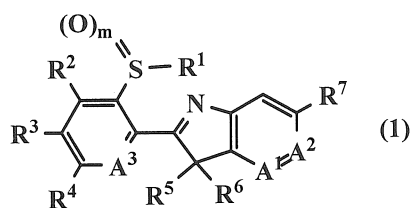
Bảng 1 (Tiếp theo)

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
1-287	OCH ₂ CF ₃	H	F	F	CF ₃	2	149-150
1-288	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-289	OCH ₂ CF ₃	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-290	OE _t	H	Cl	Cl	CF ₃	2	215-217
1-291	OE _t	H	F	Cl	CF ₃	2	

1-292	O-i-Pr	H	F	Cl	CF ₃	2	
1-293	4-CF ₃ -BnO	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-294	3-CF ₃ -BnO	H	F	F	CF ₃	2	
1-295	3-CF ₃ -BnO	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-296	3-Cl-BnO	H	F	F	CF ₃	2	
1-297	3-Cl-BnO	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-298	4-Cl-BnO	H	F	F	CF ₃	2	
1-299	4-Cl-BnO	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
1-300	2-Cl-BnO	H	F	F	CF ₃	2	
1-301	2-Cl-BnO	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

Mỗi A¹ và A³ là nguyên tử nitơ, A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Công thức hóa học 5]



[Bảng 13]

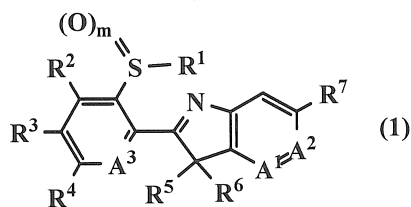
Bảng 2

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
2-1	CF ₃	H	F	F	CF ₃	2	135-136
2-2	CF ₃	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-3	CF ₃	H	Cl	Cl	CF ₃	2	NMR
2-4	I	H	F	F	CF ₃	2	
2-5	I	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-6	I	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-7	c-Pr	H	F	F	CF ₃	2	
2-8	c-Pr	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-9	c-Pr	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-10	3-F-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
2-11	3-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-12	3-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-13	4-F-Ph	H	F	F	CF ₃	2	218-219
2-14	4-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-15	4-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-16	3-CF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	170-171
2-17	3-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	

2-18	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-19	4-CF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
2-20	4-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-21	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
2-22	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	F	CF ₃	2	
2-23	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	F	Cl	CF ₃	2	
2-24	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

A³ là nguyên tử nitơ, mỗi A¹ và A² là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Công thức hóa học 6]



[Bảng 14]

Bảng 3

Hợp chất số	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Tính chất vật lý
3-1	I	H	F	F	CF ₃	2	
3-2	I	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-3	I	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
3-4	c-Pr	H	F	F	CF ₃	2	
3-5	c-Pr	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-6	c-Pr	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
3-7	3-F-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
3-8	3-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-9	3-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
3-10	4-F-Ph	H	F	F	CF ₃	2	
3-11	4-F-Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-12	4-F-Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
3-13	3-CF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
3-14	3-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-15	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	
3-16	4-CF ₃ -Ph	H	F	F	CF ₃	2	
3-17	4-CF ₃ -Ph	H	F	Cl	CF ₃	2	
3-18	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	Cl	CF ₃	2	

A¹ là nguyên tử nitơ, mỗi A² và A³ là CH, R¹ là nhóm etyl, và R² là nguyên tử hydro.

[Bảng 15]

Bảng 4: Dữ liệu $^1\text{H-NMR}$

Hợp chất số	Dữ liệu $^1\text{H-NMR}$
1-4	8,83(1H, s), 8,50(1H, s), 8,10(1H, s), 8,09(1H, d), 3,60(2H, dd), 1,38(3H, t)
1-5	9,36(1H, s), 8,98(1H, s), 8,87(1H, d), 8,26(1H, d), 3,95-3,83(2H, m), 1,44(3H, t)
1-6	9,17(1H, s), 8,90(1H, s), 8,85(1H, d), 8,21(1H, d), 4,07-3,87(2H, m), 3,83(3H, s), 1,45(3H, t)
1-7	9,08(1H, s), 8,90(1H, s), 8,85(1H, d), 8,25(1H, s), 3,84(3H, s), 3,37-3,31(1H, m), 2,94-2,89(1H, m), 1,37(3H, t)
1-8	9,08(1H, s), 8,90(1H, s), 8,85(1H, d), 8,21(1H, s), 3,84(3H, s), 3,50-3,45(1H, m), 3,02-2,97(1H, m), 1,46(3H, t)
1-9	9,20(1H, s), 8,92(1H, s), 8,19(1H, d), 8,26(1H, d), 3,42-3,34(1H, m), 2,99-2,90(1H, m), 1,41(3H, t)
1-10	9,29(1H, s), 8,92(1H, s), 8,80(1H, s), 8,14(1H, s), 3,80(2H, dd), 1,43(3H, t)
2-3	9,28(1H, d), 8,83(1H, d), 8,90(1H, s), 8,89(1H, d), 7,79(1H, d), 3,93(2H, q), 1,44(3H, t)

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức chung (1) theo sáng chế, oxit của nó hoặc muối của nó làm hoạt chất thích hợp để phòng trừ các loài gây hại khác nhau mà có thể gây hại đến lúa nước, cây ăn quả, rau, các cây trồng khác và hoặc cây cảnh. Loài gây hại đích, ví dụ, các loài gây hại trong nông nghiệp và lâm nghiệp, loài gây hại trong trồng trọt, loài gây hại trong hạt được tích trữ, loài gây hại vệ sinh, giun tròn, v.v...

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

Các loài thuộc bộ cánh vẩy như *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapulalis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *Trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta*

sinensis, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophera batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*,

Sesamia calamistis, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia bao gòmns*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes hoặc ana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyeloides pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, các loài thuộc họ bướm đêm (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, hoặc *gyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, và *raca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*,

Lymantria dispar, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, các loài thuộc họ Pieridae như *Pieris rapae crucivora* và *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes hoặc ana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*,

Illiberis pruni, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* và *Earias cupreoviridis*;

Các loài thuộc bộ cánh nửa như *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptopsaltria nigrofuscata*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*,

Aguriahana quercus, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, và *aspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidiotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticiellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geioica lucifuga*, *Numata muiri*, *Comstockaspis perniciosa*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederæ*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigradorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*,

Brevicoryne brassicae, *Aphis glycines*, *Leptocorisa* hoặc *atorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroecon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Buróchanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias*

subpunctatus, hoặc *thotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abieti*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*,

Eurydema rugosum, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoresopsis pyri*, *Brúchanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlerites debile*, *Laodelphax striatella*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovina punctata*, *Empoasca* sp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocoris acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*,

Aphrophora costalis, *Lygus disponi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraecola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, hoặc *ientus ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* và *Aphis gossypii*;

Các loài thuộc bộ cánh cứng như *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema* hoặc *yzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus* hoặc *yzophilus*,

Colasposoma dauricum, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotha hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus* hoặc *yzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*,

Diabrotica undecimpunctata howardi, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linaeidea aenea* và *Anthonomus grandis*;

Các loài thuộc bộ hai cánh như *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Clops* hoặc *yzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza* hoặc *yzae*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, các loài thuộc họ Phoridae như *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* Forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza*

sativae, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromuza nigriventris*, *Anastrepha ludens* và *Rhagoletis pomonella*;

Các loài thuộc bộ cánh màng như *Pristomyrmex pungens*, các loài thuộc họ bộ cánh lợp, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, các loài thuộc liên họ Vespinae, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* và *Ochetellus glaber*;

Các loài thuộc bộ cánh thẳng như *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* và *Teleogryllus emma*;

Các loài của bộ cánh tơ như *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* và *Liothrips vaneeckei*;

Các loài cái ghẻ như *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, các loài thuộc họ ve như *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanicus*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvairum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptrenyssnus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*,

Rhyzoglyphus robini và *Sancassania* sp.;

Các loài bộ cánh bằng theo phân loại như *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guangzhoensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* và *Reticulitermes speratus*;

Các loài Bộ gián như *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta* hoặc *ientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* và *Periplaneta americana*;

Các loài bộ chét như *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* và *Ceratophyllus gallinae*;

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

Các loài thân mềm như *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* và *Acusta despecta sieboldiana*.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế cũng có tác dụng trừ sâu mạnh đối với sâu *Tuta absoluta*.

Hơn nữa, bét và ve ký sinh trên động vật cũng được bao gồm trong loài gây hại đích, và các ví dụ bao gồm các loài thuộc họ ve như *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinosa*, *Dermacentor reticulatus* và *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; các loài thuộc chi *Ornithonyssus* như *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bursa*; các loài thuộc họ ve bét như *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* và *Helenicula miyagawai*; các

loài thuộc họ ve Cheyletidae như *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* và *Cheyletiella blakei*; các loài liên họ Sarcoptoidea như *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* và *Notoedres cati*; và các loài thuộc họ mò bao lông như *Demodex canis*.

Loài gây hại đích khác bao gồm con bọ chết bao gồm các loài gây hại ký sinh ngoài không có cánh thuộc bộ bọ chết theo phân loại, cụ thể hơn là, loài thuộc họ Pulicidae và Ceratophyllidae. Các ví dụ về loài thuộc họ Pulicidae bao gồm *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* và *Monopsyllus anisus*.

Loài gây hại đích khác bao gồm loài ngoại ký sinh, ví dụ, các loài thuộc phân bộ chí rận như *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* và *Pediculus capitis*; các loài thuộc phân bộ côn trùng phân cánh như *Trichodectes canis*; và các loài gây hại bộ hai cánh hút máu như *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* và *Simulium hoare natum*. Cũng được bao gồm là ký sinh trong, ví dụ, giun tròn như giun tròn ký sinh trong phổi, giun tóc, giun ký sinh, giun ký sinh trong dạ dày, giun đũa và giun chỉ; các sán dây như *Spirometra erinacei*, *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* và *Echinococcus multilocularis*; động vật nguyên sinh như *Schistosoma japonicum* và *Fasciola hepatica*; và protozoa như coccidia, *Plasmodium*, *Sarcocystis* trong ruột, *Toxoplasma* và *Cryptosporidium*.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của nó làm hoạt chất có hiệu quả phòng trừ đáng kể đối với loài gây hại nêu trên mà thiệt hại đến các cây trồng ở vùng đất thấp, cây trồng, cây ăn quả, rau, các cây trồng khác, hoặc cây cảnh, v.v... Hiệu quả mong muốn có thể thu được khi thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt được áp dụng đối với các phương tiện ươm hạt, cánh đồng lúa, đồng ruộng, cây ăn quả, rau, các cây trồng khác, hoặc cây cảnh, v.v... và các hạt của chúng, lúa nước, tán lá, môi trường trồng trọt như đất, hoặc tương tự quanh thời gian dự kiến tràn vào phá hoại của loài côn trùng, nghĩa là, trước khi tràn vào phá hoại hoặc khi nhận

thấy sự tràn vào phá hoại. Theo các phương án ưu tiên cụ thể, việc áp dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt sử dụng cũng được gọi là quá trình thâm nhập và sự di chuyển. Cụ thể là, đất ươm cây giống, đất trong lỗ cấy, rễ cây, nước tưới, nước canh tác trong thủy canh, hoặc tương tự được xử lý bằng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt cho phép cây trồng, hoặc cây cảnh, v.v... hấp thụ hợp chất theo sáng chế thông qua rễ qua đất hoặc theo một cách khác.

Các ví dụ về cây trồng có ích mà thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế có thể được áp dụng bao gồm, nhưng không bị giới hạn cụ thể đến, ngũ cốc (ví dụ, gạo, lúa mạch, lúa mỳ, lúa mạch đen, yến mạch, ngô, v.v..), các loại đậu (ví dụ, đậu nành, đậu azuki, đậu tằm, đậu xanh, đậu tây, đậu phộng, v.v..), cây ăn quả và trái cây (ví dụ, táo, trái cây họ cam quýt, lê, nho, đào, mận, anh đào, quả óc chó, hạt dẻ, hạnh nhân, chuối, v.v ..), rau lá và rau quả (ví dụ, bắp cải, cà chua, rau bina, bông cải xanh, rau diếp, hành tây, hành tím (hành lá và hành tây xứ Wales), ớt xanh, cà tím, dâu tây, cây tiêu, đậu bắp, họ Trung Quốc, v.v ..) rau củ (như cà rốt, khoai tây, khoai lang, khoai sọ, củ cải Nhật, củ cải, rễ sen, rễ cây ngưu bàng, tỏi, hành lá Trung Quốc, vv), cây trồng để chế biến (ví dụ: bông, cây gai dầu, củ cải đường, hoa bia, mía, củ cải đường, ô liu, cao su, cà phê, thuốc lá, trà, v.v..), trái bầu (ví dụ, bí ngô Nhật Bản, dưa chuột, dưa nước, dưa ngọt phương Đông, dưa hấu, vv), đồng cỏ (ví dụ, hoặc cỏ đại, lúa miến, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng v.v..), bãi cỏ (ví dụ, cỏ Hàn Quốc, cỏ dền, v.v..), gia vị và các loại cây có mùi thơm và cây cảnh (ví dụ, hoa oải hương, hương thảo, húng tây, rau mùi tây, tiêu, gừng, v.v..), hoặc cây cảnh (ví dụ, hoa cúc, hoa hồng, hoa cẩm chướng, hoặc hoa lan, hoa tulip, hoa lily, v.v..), cây vườn (ví dụ, cây bạch quả, cây anh đào, aucuba Nhật Bản, v.v..) và cây rừng (ví dụ, lãnh cây sam Sakhalin, cây vân sam Yezo, cây thông, cây tuyết tùng vàng, cây tuyết tùng Nhật Bản, cây bách hinoki, cây bạch đàn, v.v..).

“Các thực vật” nêu trên cũng bao gồm các thực vật có khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật chọn giống cổ điển hoặc kỹ thuật tái tổ hợp gen. Các ví dụ về khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ này bao gồm khả năng chống chịu chất ức chế HPPD, như isoxaflutol; chất ức chế ALS, như imazethapyr và thifensulfuron-metyl; các chất ức chế EPSP synthaza, như glyphosat; các chất ức chế glutamin synthetaza, như glufosinat; các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza, như setoxydim; hoặc các thuốc

diệt cỏ khác, như bromoxynil, dicamba và 2,4-D.

Các ví dụ về các thực vật có khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật chọn giống cổ điển bao gồm các loại dầu hạt nhỏ, lúa mì, cây hướng dương và cây lúa chịu được họ imidazolinon của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như imazethapyr, và các thực vật này được bán dưới tên thương mại là Clearfield (nhãn hiệu được đăng ký). Ngoài ra được bao gồm các loại đậu tương được tạo ra khả năng chống chịu đối với họ sunfonyl urê của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như thifensulfuron-metyl bằng kỹ thuật chọn giống cổ điển, và được bán dưới tên nhãn hiệu là đậu tương STS. Ngoài ra được bao gồm các thực vật có khả năng chống chịu đối với chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza như thuốc diệt cỏ trione oxim và thuốc diệt cỏ chứa axit aryloxy phenoxy propionic bằng kỹ thuật chọn giống cổ điển, ví dụ, ngô SR và các loại thực vật tương tự.

Các thực vật có khả năng chống chịu đối với chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza được mô tả trong tài liệu Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), và các tài liệu tương tự. Hơn nữa, các thể đột biến axetyl-CoA carboxylaza có khả năng chống chịu các chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza được báo cáo trong tài liệu Weed Science, 53, 728-746 (2005), và các tài liệu tương tự, và bằng cách đưa gen của thể đột biến axetyl-CoA carboxylaza này vào thực vật bằng kỹ thuật tái tổ hợp gen, hoặc đưa đột biến mang lại khả năng chống chịu vào axetyl-CoA carboxylaza của thực vật, các thực vật chống chịu chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza có thể được thiết kế. Theo một cách khác, bằng cách đưa axit nucleic tạo ra đột biến thay thế bazơ vào các tế bào thực vật (ví dụ tiêu biểu về kỹ thuật này là kỹ thuật chimera-plasty (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318.)) để cho phép đột biến thay thế đặc hiệu vị trí trong các amino axit được mã hóa bởi gen axetyl-CoA carboxylaza, gen ALS hoặc tương tự của thực vật, các thực vật chống chịu chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza, chất ức chế ALS hoặc các chất tương tự có thể được tạo ra. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế cũng có thể được áp dụng cho các thực vật này.

Hơn nữa, các độc tố minh họa được thể hiện ở các thực vật biến đổi gen bao gồm các protein trừ sâu của *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; các δ -endotoxin của

Bacillus thuringiensis, như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 và Cry9C, và các protein trừ sâu khác, như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A; các protein trừ sâu từ giun tròn; các độc tố được sản xuất từ các động vật, như các độc tố từ bộ cạp, các độc tố từ nhện, các độc tố từ ong và các độc tố thần kinh riêng từ côn trùng; các độc tố của nấm dạng sợi; lectin từ thực vật; agglutinin; các chất ức chế proteaza, như chất ức chế trypsin, chất ức chế serin proteaza, patatin, chất ức chế xystatin và papain; protein bất hoạt ribosom (RIP), như rixin, RIP từ nhô, abrin, luffin, saporin và bryodin; các enzym chuyển hóa steroit, như 3-hydroxy steroit oxidaza, ecdysteroit-UDP-glucosyltransferaza và cholesterol oxidaza; chất ức chế ecdyson; HMG-CoA reductaza; chất ức chế kênh ion, như chất ức chế kênh natri và chất ức chế kênh canxi; hormon esteaza từ ấu trùng chưa trưởng thành; chất thụ cảm hormon lợi tiểu; stilben synthaza; bibenzyl synthaza; chitinaza; và glucanaza.

Ngoài ra cũng bao gồm các độc tố lai, các độc tố bị suy giảm một phần và các độc tố biến đổi được dẫn xuất từ các hợp chất sau: protein δ -endotoxin như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab và Cry35Ab, và các protein trừ sâu khác như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A. Độc tố lai có thể được điều chế bằng cách kết hợp với một số miền của các protein này mà khác so với sự kết hợp ban đầu trong tự nhiên bằng việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp. Như độc tố bị suy giảm một phần, độc tố Cry1Ab mà trong đó một phần trình tự axit amin bị xóa đã được biết đến. Trong độc tố biến đổi, một hoặc nhiều axit amin của độc tố xuất hiện tự nhiên được thế.

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

Do các độc tố được chứa trong các thực vật biến đổi gen như vậy, nên các thực vật này thể hiện tính kháng đối với các loài gây hại, cụ thể là, loài côn trùng gây hại thuộc Bộ cánh cứng, loài côn trùng gây hại thuộc Bộ cánh nửa, loài côn trùng gây hại thuộc Bộ hai cánh, loài côn trùng gây hại của bộ cánh vẩy và giun tròn. Các công nghệ nêu trên và thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt của sáng chế có thể được sử dụng kết hợp hoặc được sử dụng một cách có hệ thống.

Để phòng trừ loài gây hại đích, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế, có hoặc không có sự pha loãng hoặc tạo huyền phù thích hợp trong nước v.v., được áp dụng đối với các thực vật có nguy cơ bị phá hoại bởi các loài côn trùng gây hại đích hoặc giun tròn ở lượng hữu hiệu để phòng trừ các loài côn trùng gây hại hoặc giun tròn này. Ví dụ, để phòng trừ các loài côn trùng gây hại và giun tròn mà có thể gây hại cho cây trồng như cây ăn quả, cây ngũ cốc và rau, việc áp dụng qua lá và xử lý hạt như ngâm, phủ bụi và phủ canxi peroxit có thể được thực hiện. Hơn nữa, việc xử lý đất hoặc tương tự cũng có thể được thực hiện để cho phép các thực vật hấp thụ các chất hóa nông thông qua rễ của chúng. Các ví dụ về việc xử lý này bao gồm việc trộn với toàn bộ đất, xử lý trồng cây theo hàng, trộn với đất nền, xử lý giống, xử lý hố trồng, xử lý rễ cây, bón thúc, xử lý các hộp ươm lúa nước, và bón ngập. Ngoài ra, ứng dụng cho môi trường canh tác thủy canh, xử lý hun khói, tiêm thân cây và các phương pháp tương tự cũng có thể được thực hiện.

Hơn nữa, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế, có hoặc không có sự pha loãng hoặc tạo huyền phù thích hợp trong nước v.v., có thể được sử dụng đối với các vị trí có nguy cơ bị phá hoại bởi các loài gây hại với lượng hữu hiệu để phòng trừ các loài gây hại này. Ví dụ, nó có thể được áp dụng trực tiếp đối với các loài gây hại cho hạt tích trữ, các loài gây hại trong nhà, các loài gây hại vệ sinh môi trường, các loài gây hại rừng, v.v., và cũng được sử dụng để phủ vật liệu xây dựng nhà ở, để xử lý hun khói, hoặc làm chế phẩm môi.

Các phương pháp minh họa về việc xử lý hạt bao gồm phương pháp nhúng hạt trong dung dịch được pha loãng hoặc không được pha loãng của chế phẩm lỏng hoặc rắn dùng để tẩm các chất hóa nông vào các hạt; trộn hoặc phủ bụi lên các hạt bằng chế phẩm rắn hoặc lỏng nhằm tạo sự kết dính của chế phẩm lên bề mặt của hạt; phủ các hạt bằng hỗn hợp của chế phẩm rắn hoặc lỏng và chất mang kết dính như nhựa hoặc polyme; và việc sử dụng chế phẩm rắn hoặc lỏng lên vùng lân cận của hạt cùng thời điểm với việc gieo hạt.

Thuật ngữ “hạt” trong quá trình xử lý hạt nêu trên nhằm để chỉ thân cây mà ở giai đoạn đầu của việc canh tác và được sử dụng để nhân giống cây trồng. Các ví dụ bao gồm, ngoài cái được gọi là hạt giống, thân cây dùng cho quá trình nhân giống thực vật,

như hành, thân củ, khoai tây giống, hành con, cành giâm, thân cây hình đĩa và thân cây được sử dụng cho phương pháp cắt ghép.

Thuật ngữ “đất” hoặc “môi trường canh tác” theo phương án của sáng chế để sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt nhằm để chỉ môi trường hỗ trợ cho trồng trọt, cụ thể là môi trường hỗ trợ mà cho phép cây trồng lan rộng rễ của chúng ở đó, và các vật liệu này không bị giới hạn cụ thể miễn sao chúng cho phép thực vật mọc lên. Các ví dụ về môi trường hỗ trợ bao gồm những môi trường được gọi là đất, thậm chí cây con và nước, và các ví dụ cụ thể về vật liệu này bao gồm cát, đá bột, chất khoáng bón cây, diatomit, thạch aga, chất gelatin, các chất có trọng lượng phân tử cao, sợi len khoáng, sợi len thủy tinh, vỏ bào và vỏ cây.

Các phương pháp ví dụ về việc áp dụng đối với tán lá của cây trồng hoặc đối với sinh vật gây hại trong hạt tích trữ, các sinh vật gây hại trong nhà, các sinh vật gây hại vệ sinh môi trường, các sinh vật gây hại trong rừng, v.v... bao gồm việc áp dụng chế phẩm lỏng, như chất cô đặc có thể nhũ hóa được và có thể chảy được, hoặc chế phẩm rắn, như bột thấm ướt được và hạt có thể phân tán được trong nước, sau đó pha loãng thích hợp trong nước; áp dụng chế phẩm dạng bụi; và hun khói.

Các phương pháp ví dụ về áp dụng cho đất bao gồm việc áp dụng chế phẩm lỏng được pha loãng hoặc không được pha loãng bằng nước cho rễ cây, nền ươm cây giống, hoặc tương tự; việc áp dụng chế phẩm dạng hạt đối với rễ cây, nền ươm cây dùng cho cây giống, hoặc tương tự; áp dụng chế phẩm dạng bụi, bột có thể thấm ướt được, hạt có thể phân tán trong nước, hạt hoặc tương tự lên đất và sự kết hợp sau đó của chế phẩm vào đất toàn phần trước khi gieo hạt hoặc cấy ghép; và áp dụng chế phẩm dạng bụi, bột có thể thấm ướt được, hạt có thể phân tán trong nước, hạt hoặc tương tự đối với các hố trồng cây, các hàng trồng cây hoặc tương tự trước khi gieo hạt hoặc trồng cây.

Đối với hộp ươm lúa nước, ví dụ, chế phẩm dạng bụi, hạt có thể phân tán trong nước, hạt hoặc tương tự có thể áp dụng, mặc dù chế phẩm thích hợp có thể thay đổi phụ thuộc vào thời gian áp dụng, nói theo cách khác, phụ thuộc vào giai đoạn canh tác như thời gian gieo hạt, chu kỳ xanh của lá và thời gian trồng cây. Chế phẩm như chế phẩm dạng bụi, hạt có thể phân tán trong nước và hạt có thể được trộn với đất ươm cây

giống. Ví dụ, chế phẩm này được trộn với đất nền, che phủ đất hoặc đất toàn phần. Đơn giản là, đất ươm cây giống và chế phẩm này có thể được tạo lớp luân phiên nhau.

Trong ứng dụng đối với các ruộng lúa, chế phẩm rắn, như bao chứa cỡ lớn, bó, hạt và hạt có thể phân tán trong nước, hoặc chế phẩm lỏng, như chất cô đặc có thể chảy được và có thể nhũ tương hóa được, thường được áp dụng đối với cánh đồng lúa kiểu ngập. Trong khoảng thời gian trồng lúa, chế phẩm thích hợp, như chế phẩm nêu trên hoặc sau khi được trộn với phân bón hoặc tương tự, có thể được phủ lên đất hoặc được phun vào đất. Ngoài ra, chất cô đặc có thể nhũ tương hóa được, có thể chảy được hoặc tương tự có thể được áp dụng đối với nguồn nước cung cấp cho cánh đồng, như lõi nước vào và thiết bị tưới. Trong trường hợp này, việc xử lý có thể được hoàn thành bằng sự cung cấp nước và do đó thu được theo cách tiết kiệm lao động.

Trong trường hợp về các cây trồng trên cánh đồng, các hạt của chúng, môi trường canh tác trong vùng lân cận của các cây trồng của chúng, hoặc tương tự có thể được xử lý trong khoảng thời gian gieo hạt đến cấy cây con. Trong trường hợp các cây mà hạt được gieo trực tiếp trên đồng ruộng, ngoài việc xử lý hạt trực tiếp, xử lý rễ cây trong khi gieo trồng được ưu tiên. Cụ thể là, việc xử lý có thể được thực hiện bằng cách, ví dụ, áp dụng chế phẩm dạng hạt lên đất, hoặc đất ẩm với chế phẩm ở dạng lỏng được pha loãng hoặc không được pha loãng. Việc xử lý ưu tiên khác là sự kết hợp của hạt vào môi trường canh tác trước khi gieo hạt.

Trong trường hợp về các thực vật canh tác được cấy ghép, các ví dụ ưu tiên về việc xử lý trong khoảng thời gian gieo hạt đến cấy cây con bao gồm, ngoài việc xử lý hạt trực tiếp, việc xử lý thấm ướt của các nền đất ươm cây con bằng chế phẩm ở dạng lỏng; và việc áp dụng chế phẩm dạng hạt lên nền đất ươm cây con. Ngoài ra, việc xử lý các hố trồng cây bằng chế phẩm dạng hạt cũng được bao gồm; và việc đưa chế phẩm dạng hạt vào môi trường canh tác trong vùng lân cận của các điểm trồng cây tại thời điểm gieo trồng cố định.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế được sử dụng phổ biến là chế phẩm tiện cho việc áp dụng, mà được điều chế theo phương pháp thông thường để tạo ra chế phẩm hóa nông.

Cụ thể là, hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức chung (1) theo sáng chế hoặc

muối của chúng và chất mang không hoạt tính thích hợp, và nếu cần thiết, chất trợ, được pha trộn ở tỷ lệ thích hợp, và thông qua bước hòa tan, phân tách, tạo huyền phù, pha trộn, ngâm, hấp thụ và/hoặc kết dính, được bào chế thành dạng thích hợp để áp dụng, như dịch đặc dạng huyền phù, dịch đặc có thể nhũ tương hóa được, dịch đặc có thể hòa tan, bột có thể thấm ướt được, hạt có thể phân tán trong nước, hạt, chế phẩm dạng bụi, viên nén và chế phẩm dạng gói.

Chế phẩm (thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt hoặc chất phòng trừ ký sinh trùng ở động vật) theo sáng chế có thể tùy chọn là chứa chất phụ gia thường được sử dụng cho chế phẩm hóa nông hoặc các chất phòng trừ ký sinh trùng ở động vật ngoài hoạt chất. Các ví dụ về chất phụ gia bao gồm các chất mang như chất phụ gia lỏng hoặc rắn, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất làm ướt, chất liên kết, chất kết dính, chất làm đặc, thuốc nhuộm màu, chất rắc, chất dính/chất dán trải, chất đông lạnh, chất chống kết khối, chất làm tan rã và chất làm ổn định. Nếu cần thiết, chất bảo quản, các đoạn của thực vật, v.v... cũng có thể được sử dụng làm chất phụ gia. Một trong số các chất phụ gia này có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng kết hợp.

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

Các ví dụ về chất mang dạng lỏng bao gồm các rượu bao gồm các rượu đơn chức, như metanol, etanol, propanol, isopropanol và butanol, và rượu đa chức, như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, hexylen glycol, polyetylen glycol, polypropylen glycol và glyxerin; hợp chất polyol, như propylen glycol ete; xeton, như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton, diisobutyl xeton và xyclohexanon; các

ete, như etyl ete, dioxan, etylen glycol monoetyl ete, dipropyl ete và tetrahydrofuran; hydrocacbon béo, như parafin thông thường, naphten, isoparafin, kerosen và dầu khoáng; hydrocacbon thơm, như benzen, toluen, xylen, dung môi naphta và alkyl naphtalen; hydrocacbon được halogen hóa, như diclometan, clorofom và cacbon tetraclorea; este, như etyl axetat, diisopropyl phtalat, dibutyl phtalat, dioctyl phtalat và dimetyl adipat; lacton, như γ -butyrolacton; các amit, như dimetylformamit, dietylformamit, dimetylaxetamit và N-alkyl pyrolidinon; các nitril, như axetonitril; hợp chất lưu huỳnh, như dimetyl sulfoxit; dầu thực vật, như dầu đậu tương, dầu chiết xuất từ hạt nho, dầu hạt bông và dầu thầu dầu; và nước. Một trong số các chất mang lỏng này có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng kết hợp.

Các chất hoạt động bề mặt mẫu được sử dụng làm chất phân tán hoặc chất làm ướt/chất dần trải bao gồm các chất hoạt động bề mặt không ion, như este của axit béo sorbitan, polyoxyetylen este của axit béo sorbitan, este của axit béo sucroza, este của axit béo polyoxyetylen, este của axit nhựa polyoxyetylen, dieste của axit béo polyoxyetylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkyl aryl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete, polyoxyetylen dialkyl phenyl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete-formaldehyt condensat, khối copolyme polyoxyetylen-polyoxypropylen, polystyren-polyoxyetylen khối polyme, khối copolyme ete alkyl polyoxyetylen-polypropylen, polyoxyetylen alkylamin, amit của axit béo polyoxyetylen, bis(phenyl ete) của axit béo polyoxyetylen, polyalkylen benzyl phenyl ete, polyoxyalkylen styryl phenyl ete, axetylen diol, axetylen diol được bổ sung polyoxyalkylen, polyoxyetylen ete-type silicon, este-type silicon, chất hoạt động bề mặt flo, dầu thầu dầu polyoxyetylen và dầu thầu dầu được hydroat hóa polyoxyetylen; chất hoạt động bề mặt anionic, như alkyl sulfat, polyoxyetylen alkyl ete sulfat, polyoxyetylen alkyl phenyl ete sulfat, polyoxyetylen styryl phenyl ete sulfat, alkylbenzen sulfonat, alkylaryl sulfonat, lignosulfonat, alkyl sulfosuccinat, naphtalen sulfonat, alkylnaphtalen sulfonat, các muối naphtalensulfonic axit-formaldehyt condensat, các muối của chất ngưng tụ alkylnaphtalensulfonic axit-formaldehyt, muối của axit béo, muối của axit polycarboxylic, polyacrylat, sarcosinat của axit béo N-metyl, resinat, polyoxyetylen alkyl ete photphat và polyoxyetylen alkyl phenyl ete

photphat; các chất hoạt động bề mặt cationic bao gồm các muối alkyl amin, như lauryl amin hydroclorua, stearyl amin hydroclorua, oleyl amin hydroclorua, stearyl amin axetat, stearyl aminopropyl amin axetat, alkyl trimetyl amoni clorua và alkyl dimetyl benzalkonium clorua; và chất hoạt động bề mặt amphoteric, như chất hoạt động bề mặt amphoteric loại amino axit hoặc loại betain. Một trong số chất hoạt động bề mặt này có thể được sử dụng một mình, hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng kết hợp.

Các ví dụ về chất kết dính hoặc chất dính bao gồm carboxymetyl xenluloza hoặc các muối của chúng, dextrin, tinh bột hòa tan, xanthan gum, guar gum, sucroza, polyvinyl pyrolidon, gum arabic, rượu polyvinyl, polyvinyl axetat, natri polyacrylat, polyetylen glycol với phân tử lượng trung bình từ 6.000 đến 20.000, polyetylen oxit với phân tử lượng trung bình từ 100.000 đến 5.000.000, phospholipit (ví dụ, xephalin, lecithin, v.v.), bột xenluloza, dextrin, tinh bột biến tính, axit polyaminocarboxylic hợp chất tạo phức, polyvinyl pyrolidon liên kết ngang, maleic axit-styren copolyme, copolyme của axit (met)acrylic, half este của polyhydric rượu polyme và dicarboxylic anhydrua, polystyren sulfonate có thể hòa tan nước, parafin, terpen, nhựa polyamit, polyacrylat, polyoxyetylen, sáp, polyvinyl alkyl ete, chất ngưng tụ alkylphenol-formaldehyt và nhũ tương nhựa tổng hợp.

Các ví dụ về chất làm đặc bao gồm nước polyme có thể hòa tan, như xanthan gum, guar gum, diutan gum, carboxymetyl xenluloza, polyvinyl pyrolidon, carboxyvinyl polyme, polyme acrylic, hợp chất tinh bột và polysaccarit; và bột mịn vô cơ, như bentonit hạng cao và silica được hun khói (cacbon trắng).

Các ví dụ về thuốc nhuộm màu bao gồm các chất màu vô cơ, như sắt oxit, titan oxit và xanh Phổ; và các thuốc nhuộm hữu cơ, như thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm phtaloxyanin kim loại.

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

Ví dụ về các tá dược đóng vai trò ngăn tạo cục hoặc chất làm tan rã dễ dàng bao gồm polysaccarit (tinh bột, axit alginic, mannoza, galactoza, v.v.), polyvinyl pyrolidon, silica được hun khói (cacbon trắng), este gum, nhựa petroleum, natri tripolyphosphat,

natri hexametaphosphat, stearate kim loại, bột xenluloza, dextrin, copolyme metacrylat, polyvinyl pyrolidon, các hợp chất tạo phức của axit polyaminocarboxylic, styren-isobutylen-maleic anhydrua copolyme được sunfonat hóa và copolyme ghép polyacrylonitril tinh bột.

Các ví dụ về chất làm ổn định bao gồm các chất làm khô, như zeolit, quicklim và magiê oxit; các chất chống oxi hóa, như hợp chất phenol, hợp chất amin, hợp chất lưu huỳnh và hợp chất axit phosphoric; và các chất hấp thụ tia cực tím, như hợp chất của axit salixylic và hợp chất benzophenon.

Các ví dụ về chất bảo quản bao gồm kali socbat và 1,2-benzothiazolin-3-on.

Hơn nữa, các tác dược khác bao gồm chất đàn trải chức năng, các chất tăng cường hoạt tính như chất ức chế chuyển hóa (piperonyl butoxit v.v.), chất chống đông lạnh (propylen glycol v.v.), các chất chống oxi hóa (BHT v.v.) và các chất hấp thụ tia cực tím cũng có thể được sử dụng nếu cần thiết.

Lượng hoạt chất hợp chất trong thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể được điều chỉnh khi cần thiết, và về cơ bản là, lượng hoạt chất hợp chất được chọn thích hợp nằm trong khoảng từ 0,01 đến 90 phần theo trọng lượng trong 100 phần theo trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt. Ví dụ, trong trường hợp mà thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt là chế phẩm dạng bụi, hạt, chất cô đặc có thể nhũ tương hóa được hoặc bột có thể thấm ướt được, thích hợp với lượng hoạt chất hợp chất nằm trong khoảng từ 0,01 đến 50 phần theo trọng lượng (nằm trong khoảng từ 0,01 đến 50% theo trọng lượng so với tổng trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt).

Tỷ lệ ứng dụng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể thay đổi với các yếu tố khác nhau, ví dụ, mục đích, loài sâu hại đích, các điều kiện tăng trưởng của thực vật trồng, xu hướng phá hoại của loài côn trùng, thời tiết, các điều kiện môi trường, dạng liều, phương pháp ứng dụng, vị trí ứng dụng, ứng dụng định thời, v.v., nhưng về cơ bản là, tỷ lệ ứng dụng của hoạt chất hợp chất được chọn thích hợp nằm trong khoảng từ 0,001 g đến 10 kg, và tốt hơn là từ 0,01 g đến 1 kg trên 10 phụ thuộc vào mục đích.

Hơn nữa, đối với sự mở rộng vùng của các loài sâu hại đích và thời gian thích

hợp để phòng trừ các loài côn trùng, hoặc đối với sự giảm bớt liều lượng, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể được sử dụng sau khi được trộn với thuốc trừ sâu khác dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt vi trùng, thuốc diệt loài gây hại sinh học và/hoặc tương tự. Hơn nữa, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt có thể được sử dụng sau khi được trộn với thuốc diệt cỏ, chất điều chỉnh sự tăng trưởng của thực vật, phân bón và/hoặc tương tự phụ thuộc vào vị trí.

Các ví dụ về thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bổ sung, acarixit và nematixit được sử dụng cho các mục đích nêu trên bao gồm 3,5-xylyl methylcarbamate (XMC), các độc tố protein tinh thể được điều chế bằng *Bacillus thuringiensis* như *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* và *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, BPMC, hợp chất trừ sâu được dẫn xuất từ độc tố Bt, clofenson (CPCBS), diclodiisopropyl ete (DCIP), 1,3-diclopropen (D-D), DDT, NAC, O-4-dimethylsulfamoylphenyl O,O-diethyl phosphorothioat (DSP), O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat (EPN), tripropylisoxyanurat (TPIC), acrinathrin, azadirachtin, azinphos-methyl, axequinocyl, axetamiprid, acetoprol, axephath, abamectin, avermectin-B, amidoflomet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, alpha-endosulfan, alpha-xypermethrin, albendazol, allethrin, isazofos, isamidofos, isoamidofos, isoxathion, isofenphos, isoprocarb (MIPC), ivermectin, imicyafos, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, esfenvalerat, ethiofencarb, ethion, ethiprol, etoxazol, ethofenprox, ethoprophos, etrimfos, emamectin, emamectin-benzoat, endosulfan, empenathrin,

oxamyl, oxydemeton-methyl, oxydeprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, kali oleat, natri oleat, cadusafos, cartap, carbaryl, carbosulfan, carbofuran, gamma-xyhalothrin, xylylcarb, quinalphos, kinopren, chinomethionat, cloethocarb, clothianidin, clofentezin, chromafenozit, cloantraniliprol, cloetoxifos, clodimeform, clodan, clopyrifos, clopyrifos-methyl, clophenapyr, clofenson, clofenvinphos, clofluazuron, clobenzilat, clobenzoat, kelthane (dicofol), salithion, xyanophos (CYAP), diafenthiuron, diamidafos, xyantraniliprol, theta-xypermethrin, dienoclo, xyenopyrafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-cypermethrin, dichlofenthion (ECP), xycloprothrin, diclofos

(DDVP), disulfoton, dinotefuran, xyhalothrin, xyphenothrin, xyfluthrin, diflubenzuron, xyflumetofen, diflovidazin, xyhexatin, xypermethrin, dimethylvinphos, dimetoat, dimefluthrin, silafluofen, xyromazin, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spirotetramat, spiromesifen, sulfluramid, sulprofos, sulfoxaflor, zeta-xypermethrin, diazinon, tau-fluvalinat, dazomet, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thioxycclam, thiosultap, thiosultap-natri, thionazin, thiometon, deet, dieldrin, tetraclovinphos, tetradifon, tetramethylfluthrin, tetramethrin, tebupirimfos, tebufenozit, tebufenpyrad, tefluthrin, teflubenzuron, demeton-S-metyl, temephos, deltamethrin, terbufos, tralopyril, tralomethrin, transfluthrin, triazamat, triazuron, trichlamit, triclophon (DEP), triflumuron, tolfenpyrad, naled (BRP), nithiazin, nitenpyram, novaluron, noviflumuron, hydropren, vaniliprol, vamidothion, parathion, parathion-metyl, halfenprox, halofenozit,

bistrifluron, bisultap, hydrametylnon, hydroxy propyl starch, binapacryl, bifenazat, bifenthrin, pymetrozin, pyraclofos, pyrafluprol, pyridafenthion, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprol, pyriproxyfen, pirimicarb, pyrimidifen, pirimiphos-metyl, pyrethrins, fipronil, fenazaquin, fenamiphos, bromopropylat, fenitrothion (MEP), fenoxycarb, fenothiocarb, phenothrin, fenobucarb, fensulfothion, fenthion (MPP), phenthoat (PAP), fenvalerat, fenpyroximat, fenpropathrin, fenbendazol, fosthiazat, formetanat, butathiofos, buprofezin, furathiocarb, prallethrin, fluacrypyrim, fluazinam, fluazuron, fluensulfon, fluxycloxuron, fluxythrinat, fluvalinat, flupyrazofos, flufenerim, flufenoxuron, flufenzin, flufenprox, fluproxyfen, flubrocycythrinat, flubendiamit, flumethrin, flurimfen, prothiofos, protrifenbut, flonicamid, propaphos, propargit (BPPS), profenofos, profluthrin, propoxur (PHC), bromopropylat,

beta-xyfluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, heptenophos, permethrin, benclothiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximat, benfuracarb, phoxim, phosalon, fosthiazat, fosthietan, phosphamidon, phosphocarb, phosmet (PMP), polynactin, formetanat, formothion, phorat,

dầu máy, malathion, milbemycin, milbemycin-A, milbemectin, mecarbam, mesulfenfos, methomyl, metaldehyt, metaflumizon, metamidophos, metam-amoni, metam-natri, methiocarb, methidathion (DMTP), methylisothioxyanat,

metylneodecanamit, metylparathion, metoxadiazon, metoxyclo, metoxyfenozit, metofluthrin, methopren, metolcarb, meperfluthrin, mevinphos, monocrotophos, monosultap, lambda-xyhalothrin, ryanodin, lufenuron, resmethrin, lepimectin, rotenon, levamisol hydroclorua, fenbutatin oxit, morantel tartarat, metyl bromit, trixyclohexyltin hydroxit (xyhexatin), canxi xyanamit, canxi polysulfit, lưu huỳnh và nicotin-sulfat.

Các ví dụ về các chất khử vi trùng dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được sử dụng cho các mục đích tương tự như bao gồm nêu trên aureofungin, azaconazol, azithiram, acypetac, acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, azoxystrobin, anilazin, amisulbrom, ampropylfos, ametotradin, rượu alyl, aldimorph, amobam, isotianil, isovaledion, isopyrazam, isoprothiolan, ipconazol, iprodion, iprovalicarb, iprobenfos, imazalil, iminoctadin, iminoctadine-albesilat, iminoctadine-triaxetat, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, echlomezol, edifenphos, etaconazol, ethaboxam, ethirimol, etem, etoxyquin, etridiazol, enestroburin, epoxiconazol, oxadixyl, oxycarboxin, đồng-8-quinolinolat, oxytetraxyclin, đồng-oxinat, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarat, axit oxolinic, othilinon, ofurace, hoặc ysastrobin,

metam-natri, kasugamycin, carbamorph, carpropamid, carbendazim, carboxin, carvon, quinazamid, quinacetol, quinoxifen, quinomethionat, captafol, captan, kiralaxyl, quinconazol, quintozen, guazatin, cufraneb, cuprobam, glyodin, griseofulvin, climbazol, cresol, kresoxim-metyl, chlozolinat, clotrimazol, chlobenthiazon, cloaniformetan, cloanil, cloquinox, clopicrin, clofenazol, clodinitronaphtalen, clothalonil, cloneb, zarilamid, salixylanilit, cyazofamid, dietyl pyrocacbonat, diethofencarb, cyclafuramid, diclocymet, dichlozoline, diclobutrazol, dichlofluanid, xycloheximit, diclomezin, dicloran, diclophen, dichlon, disulfiram, ditalimfos, dithianon, diniconazol, diniconazol-m, zineb, dinocap, dinocron, dinosulfon, dinoterbon, dinobuton, dinopenton, dipyrithion, diphenylamin, difenoconazol, xyflufenamid, diflumetorim, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, xypendazol, simeconazol, dimethirimol, dimethomorph, xymoxanil, dimoxystrobin, metyl bromit, ziram, silthiofam,

streptomycin, spiroxamin, sultropen, sedaxan, zoxamit, dazomet, thiadiazin, tiadinil,

thiadifluor, thiabendazol, tioxymid, thioclofenphim, thiophanat, thiophanat-metyl, thicyofen, thioquinox, chinomethionat, thifluzamit, thiram, decafentin, tecnazen, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, dehydroaxit axetic, tebuconazol, tebufloquin, dodixin, dodin, dodexyl benzensulfonat bis-etylen diamin đồng(II) (DBEDC), dodemorph, drazoxolon, triadimenol, triadimefon, triazbutil, triazoxit, triamiphos, triarimol, trichlamit, tricyclazol, triticonazol, tridemorph, tributyltin oxit, triflumizol, trifloxystrobin, triforin, tolylfluanid, tolclofos-metyl, natamyxin, nabam, nitrothal-isopropyl, nitrostyren, nuarimol, đồng nonylphenol sulfonat, halacrinat, validamyxin, valifenalat, harpin protein,

bixafen, picoxystrobin, picobenzamit, bithionol, bitertanol, hydroxyisoxazol, hydroxyisoxazol-kali, binapacryl, biphenyl, piperalin, hymexazol, pyraoxystrobin, pyracarbolid, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrametostrobin, pyriofenon, pyridinitril, pyrifenox, pyribencarb, pyrimetani, pyroxylo, pyroxyfur, pyroquilon, vinclozolin,

famoxadon, fenapanil, fenamidon, fenaminosulf, fenarimol, fenitropan, fenoxanil, ferimzone, ferbam, fentin, fenpiclonil, fenpyrazamin, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fenhexamid, phthalit, buthiobat, butylamin, bupirimat, fuberidazol, blasticidin-S, furametpyr, furalaxyl, fluacrypyrim, fluazinam, fluoxastrobil, fluotrimazol, fluopicolit, fluopyram, floimit, furcarbanil, fluxapyroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonil, flusilazol, flusulfamit, flutianil, flutolanil, flutriafol, furfural, furmexyclo, flumetover, flumorph, proquinazid, procloaz, procymidon, prothiocarb, prothioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furophanat, probenazol, bromuconazol,

hexaclobutadien, hexaconazol, hexylthiofos, bethoxazin, benalaxyl, benalaxyl-m, benodanil, benomyl, pefurazoat, benquinox, penconazol, benzamorf, pencycuron, axit benzohydroxamic, bentaluron, benthiazol, benthiavalicarb-isopropyl, penthiopyrad, penflufen, boscalid, phosdiphen, fosetyl, fosetyl-Al, polyoxins, polyoxorim, polycarbamate, folpet, formaldehyt, dầu máy, maneb, mancozeb, mandipropamid, myclozolin, myclobutanil, mildiomyxin, milneb, mecarbinzid, metasulfocarb, metazoxolon, metam, metam-natri, metalaxyl, metalaxyl-m, metiram, metyl isothioxyanat, meptyldinocap, metconazol, metsulfovax, methfuroxam,

metominostrobin, metrafenon, mepanipirim, mefenoxam, meptyldinocap, mepronil, mebenil, iodometan, rabenzazol, benzalkonium clorua, đồng clorua cơ bản, đồng sulfat cơ bản, các chất khử vi trùng vô cơ như bạc, natri hypocloit, đồng hydroxit, lưu huỳnh có thể làm ướt, canxi polysulfit, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, lưu huỳnh, đồng sulfat anhydrua, niken dimetyldithiocarbamat, các hợp chất đồng như đồng-8-quinolinolat (đồng oxin), kẽm sulfat và đồng sulfat pentahydrat.

Hơn nữa, các ví dụ về thuốc diệt cỏ bao gồm 1-naphtylaxetamit, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-thioetyl, MCPB, ioxynil, aclonifen, azafenidin, acifluorfen, aziprotryn, azimsulfuron, asulam, axetoclo, atrazin, atraton, anisuron, anilofos, aviglyxin, axit abscisic, amicarbazon, amidosulfuron, amitrol, aminoxyclopyraclo, aminopyralid, amibuzin, amiprofos-metyl, ametridion, ametryn, alaclo, allidoclo, alloxydim, alorac, isouron, isocarbamid, isoxaclotol, isoxapyrifop, isoxaflutol, isoxaben, isocil, isonoruron, isoproturon, isopropalin, isopolinat, isomethiozin, inabenfit, ipazin, ipfencarbazon, iprymidam, imazaquin, imazapic, imazapyr, imazametapyr, imazametabenz, imazametabenz-metyl, imazamox, imazethapyr, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, axit indolebutyric, uniconazol-P, eglinazin, esprocarb, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethalfluralin, ethiolat, etychlozat-etyl, ethidimuron, etinofen, ethephon, etoxysulfuron, etoxyfen, etnipromid, ethofumesat, etobenzanid, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargyl, oxaziclomefon, oxasulfuron, oxapyrazon, oxyfluorfen, hoặc yzalin, hoặc thosulfamuron, hoặc bencarb,

cafenstrol, cambendiclo, carbasulam, carfentrazon, carfentrazone-etyl, karbutilat, carbetamit, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etyl, xylaclo, quinoclamin, quinonamid, quinclorac, quinmerac, cumyluron, cliodinat, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P, credazin, clethodim, cloxyfonac, clodinafop, clodinafop-propargyl, clotoluron, clopyralid, cloproxydim, cloprop, clobromuron, clofop, clomazon, clometoxynil, chlometoxyfen, clomeprop, cloazifop, cloazin, cloransulam, cloanocryl, cloamben, cloransulam-metyl, clodiazon, cloimuron, cloimuron-etyl, closulfuron, clothal, clothiamid, clotoluron, clonitrofen, clofenac, clofenprop, clobufam, cloflurazol, cloflurenol, cloprocarb, clopropham, clomequat,

cloeturon, cloxynil, cloxuron, clopon,

saflufenacil, xyanazin, xyanatryn, di-allat, diuron, diethamquat, dicamba, xycluron, xycloa, xycloxydim, diclosulam, xyclosulfamuron, dicloprop, dicloprop-P, dichlobenil, diclofop, diclofop-metyl, diclomat, dicloalurea, diquat, cisanilit, disul, siduron, dithiopyr, dinitramin, cinidon-etyl, dinosam, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenat, dinoprop, xyhalofop-butyl, diphenamid, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, xybutryn, xyprazin, xyprazol, diflufenican, diflufenzopyr, dipropetryn, xypromid, xyperquat, gibberellin, simazin, dimexano, dimetaclo, dimidazon, dimetametryn, dimethenamid, simetryn, simeton, dimepiperat, dimefuron, xinmetylin, swep, sulglycapin, sulcotrion, sulfallat, sulfentrazon, sulfosulfuron, sulfometuron, sulfometuron-metyl, sebumeton, setoxydim, sebuthylazin,

terbacil, daimuron, dazomet, dalapon, thiazafluron, thiazopyr, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, tiocarbazil, tioclorim, thiobencarb, thidiazimin, thidiazuron, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, desmedipham, desmetryn, tetrafluron, thenylclo, tebutam, tebuthiuron, terbumeton, tepraloxydim, tefuryltrion, tembotrion, delaclo, terbacil, terbucarb, terbuclo, terbuthylazin, terbutryn, topramezon, tralkoxydim, triaziflam, triasulfuron, tri-allat, trietazin, tricamba, triclopyr, tridiphan, tritac, tritosulfuron, triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, trifluralin, trifloxysulfuron, tripropindan, tribenuron-metyl, tribenuron, trifop, trifopsim, trimeturon, naptalam, naproanilit, napropamit, nicosulfuron, nitralin, nitrofen, nitrofluorfen, nipyraclufen, neburon, norflurazon, noruron,

barban, paclobutrazol, paraquat, parafluron, haloxydin, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-metyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, picloram, picolinafen, bixyclopyron, bispyribac, bispyribac-natri, pydanon, pinoxaden, bifenox, piperophos, hymexazol, pyraclonil, pyrasulfotol, pyrazoxyfen, pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazolate, bilanafos, pyraflufen-etyl, pyriclor, pyridafol, pyriothiobac, pyriothiobac-natri, pyridate, pyriftalid, pyributicarb, pyribenzoxim, pyrimisulfan, primisulfuron, pyriminobac-metyl, pyroxasulfon, pyroxsulam,

fenasulam, phenisopham, fenuron, fenoxasulfon, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, phenothiol, fenoprop, phenobenzuron, fenthiaaprop, fenteracol,

fentrazamit, phenmedipham, phenmedipham-etyl, butaclo, butafenacil, butamifos, buthiuron, buthidazol, butylat, buturon, butenaclo, butroxydim, butralin, flazasulfuron, flamprop, furyloxyfen, prynaclo, primisulfuron-metyl, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazolat, fluroxypyr, fluothiuron, fluometuron, floglycofen, flurocloidon, flodifen, flonitrofen, flomidin, flucarbazon, flucarbazon-natri, flucloalin, flucetosulfuron, fluthiacet, fluthiacet-metyl, flupyrasulfuron, flufenacet, flufenican, flufenpyr, flupropacil, flupropanat, flupoxam, flumioxazin, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumipropyn, flumezin, fluometuron, flumetsulam, fluridon, flurtamon, fluroxypyr,

pretilaclo, proxan, proglinazin, procyazin, prodiamin, prosulfalin, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclo, propazin, propanil, propyzamit, propisoclo, prohydrojasmon, propyrisulfuron, propham, profluazol, profluralin, prohexadione-canxi, propoxycarbazon, propoxycarbazon-natri, profoxydim, bromacil, brompyrazon, prometryn, prometon, bromoxynil, bromofenoxim, bromobutit, bromobonil, florasulam,

hexacloaxeton, hexazinon, pethoxamid, benazolin, penoxsulam, pebulat, beflubutamid, vernolat, perfluidon, bencarbazon, benzadox, benzipram, benzylaminopurin, benzthiazuron, benzfendizon, bensulit, bensulfuron-metyl, benzoylprop, benzobixyclon, benzofenap, benzofluor, bentazon, pentanoclo, benthicarb, pendimetalin, pentoxazon, benfluralin, benfuresat, fosamin, fomesafen, foramsulfuron, forclofenuron, maleic hydrazit, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, mesoprazin, methoprotryn, metazaclo, metazol, metazosulfuron, metabenzthiazuron, metamitron, metamifop, metam, metalpropalin, methiuron, methiozolin, methiobencarb, metyldymron, metoxuron, metosulam, metsulfuron, metsulfuron-metyl, metflurazon, metobromuron, metobenzuron, methometon, metolaclo, metribuzin, mepiquat-clorua, mefenacet, mefluidit, monalit, monisouron, monuron, monocloaxit axetic, monolinuron, molinat, morfamquat, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, iodobonil, iodometan, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenacil, rhodetanil, canxi peroxit và metyl bromit.

Các ví dụ về thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm các chế phẩm từ virus

như virus nhân đa diện (nuclear polyhedrosis viruses - NPV), virus hạt (granulosis viruses - GV), virus đa diện tế bào chất (cytoplasmic polyhedrosis viruses - CPV) và virus entomopox (entomopox viruses - EPV); các thuốc diệt vi khuẩn được sử dụng làm thuốc trừ sâu hoặc nematixit, như *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* và *Pasteuria penetrans*; các thuốc diệt loài gây hại vi khuẩn được sử dụng làm chất khử vi trùng, như *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, avirulent *Erwinia carotovora* và *Bacillus subtilis*; và các thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học được sử dụng làm herbixit, như *Xanthomonas campestris*. Việc sử dụng kết hợp thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế với thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học nêu trên làm hỗn hợp có thể được mong đợi tạo ra cùng tác dụng như nêu trên.

Các ví dụ khác về thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm các côn trùng ăn môi sống tự nhiên như *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* và hoặc *ius sauteri*; các thuốc diệt loài gây hại vi khuẩn như *Beauveria brongniartii*; và pheromon như (Z)-10-tetradecenyl axetat, (E,Z)-4,10-tetradecadienyl axetat, (Z)-8-dodecenyl axetat, (Z)-11-tetradecenyl axetat, (Z)-13-icosen-10-on và 14-metyl-1-octadexen.

Các hợp chất theo sáng chế có các đặc tính sinh học ưu việt như nêu trên, và ngoài ra, có gánh nặng chi phí môi trường thấp, ví dụ như dễ dàng phân hủy trong môi trường và có ít tác động đến các sinh vật hữu ích như ong mật.

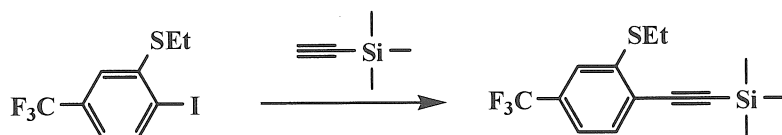
Ở đây, các ví dụ điều chế các hợp chất đại diện theo sáng chế và các hợp chất trung gian của chúng sẽ được mô tả cụ thể, nhưng sáng chế không chỉ giới hạn đến các ví dụ này.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ mẫu 1

Phương pháp điều chế 1-trimethylsilyl-2-(2-ethylthio-4-triflormetylphenyl)etyn

[Công thức hóa học 7]



2-ethylthio-4-triflometyl iodobenzen (3 g) được trộn với tetrahydrofuran (5 mL), trietylamin (2 mL), trimetylsilylaxetylen (1,3 g), bistrphenylphosphin diclopaladi (315 mg), đồng iốtua (171 mg) và triphenylphosphin (118 mg), và hỗn hợp được gia nhiệt dưới điều kiện khí agon tại nhiệt độ 40°C và khuấy trong khoảng 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc trong chân không và phần còn sót lại thu được được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất mong muốn (3,2 g).

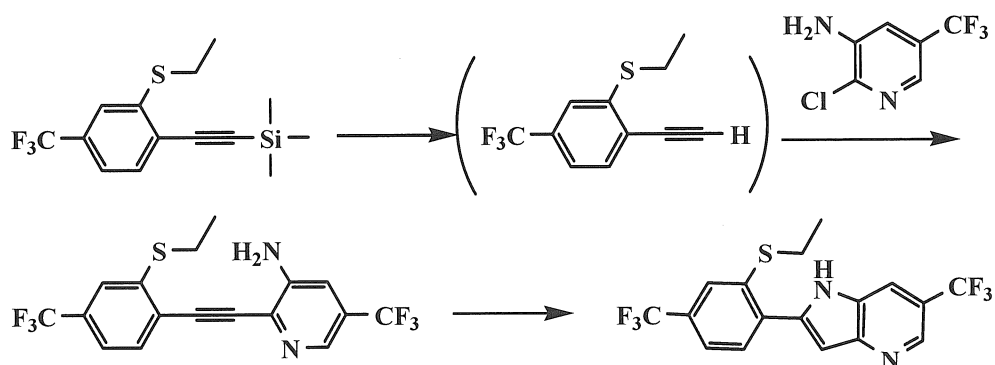
Tính chất vật lý: ¹H-NMR (CDCl₃): 7,92 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,07 (dd, 1H), 2,99 (dd, 2H), 1,42 (t, 3H), 0,29 (s, 9H)

Ví dụ mẫu 2

Phương pháp điều chế

2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 8]



1-trimetylsilyl-2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)etyn (794 mg), 3-amino-2-clo-5-triflometylpyridin (650 mg, 1,1 đương lượng), trietylamin (1 mL), diphenylphosphino feroxen diclopaladi (141 mg), đồng iốtua (33 mg), DMF (5 mL) và dung dịch 1 M THF (tetrahydrofuran) (4 mL) của tetrabutylamoni fluorit được trộn, và hỗn hợp được gia nhiệt tại hồi lưu dưới điều kiện khí agon trong khoảng 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc và phần còn sót lại thu được được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất mong muốn, nghĩa là, 2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)etynyl-5-triflometylpyridin-3-amin (0,54 g). Hợp chất thu được được hòa tan trong DMF (3 mL), kali t-butoxit (672 mg, 3 đương lượng)

được bổ sung vào dung dịch, và hỗn hợp được gia nhiệt tại 100°C và khuấy trong khoảng 3 giờ. Sau khi hỗn hợp phản ứng được cho phép để nguội xuống nhiệt độ phòng, silicagel được bổ sung và hỗn hợp được cô đặc. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được

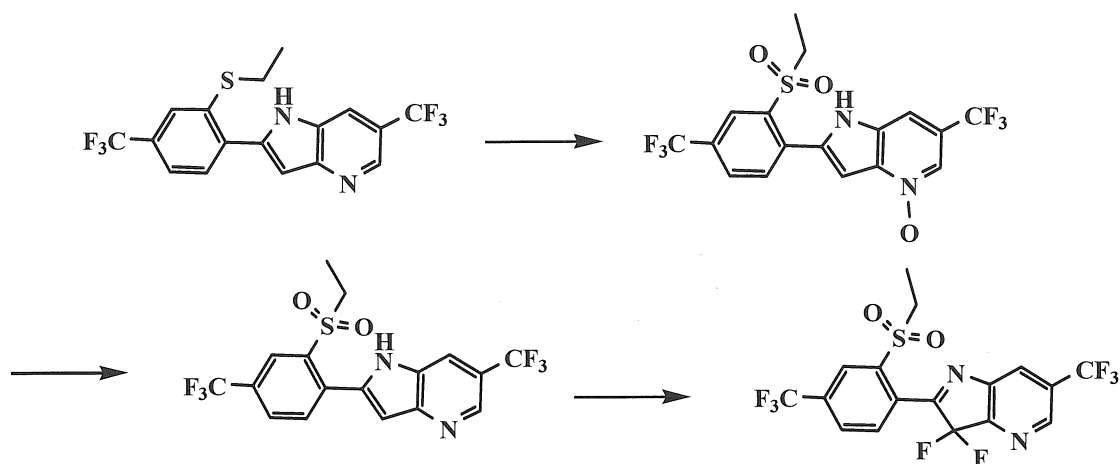
2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin.

Ví dụ 1

Phương pháp điều chế

2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)-3,3-diflo-6-triflometyl-3H-pyrido[3,2-b]pyridin (số của hợp chất 1-1)

[Công thức hóa học 9]



2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin (218 mg, 0,559 mmol) được điều chế trong Ví dụ mẫu 2 được hòa tan trong etyl axetat (3 mL) và clorofom (10 mL). Axit m- perbenzoic (745 mg, 5 đương lượng) được bổ sung vào dung dịch, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong khoảng 1 giờ. Sau đó, nước, kali cacbonat và etyl axetat được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat 3 lần. Sau khi lớp hữu cơ được cô đặc, clorofom (10 mL) và phospho triclơrua (822 mg, 10 đương lượng) được bổ sung vào phần dư, và hỗn hợp được tiếp xúc với sóng siêu âm tại nhiệt độ phòng trong khoảng 5 phút. Sau đó, nước, kali cacbonat và etyl axetat được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat 3 lần. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat và sau đó được cô đặc. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được 2-(2-ethylsulfonfyl-4-triflometylphenyl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin. Hợp chất thu được (110 mg, 0,258 mmol), natri bicacbonat (65 mg, 3 đương lượng) và

nước (28 mg, 6 đương lượng) được hòa tan trong axetonitril (5 mL). Tiếp theo, Selectfluor (274 mg, 3 đương lượng) được bổ sung và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong khoảng 3 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, nước và etyl axetat được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat 3 lần. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat và sau khi được cô đặc. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được 2-(2-ethylthio-4-triflometylphenyl)-3,3-diflo-6-triflometyl-3H-pyrido[3,2-b]pyridin.

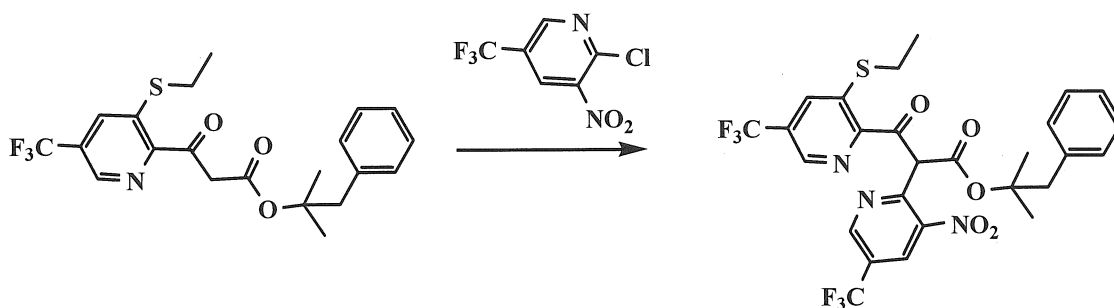
Tính chất vật lý: nằm trong khoảng từ 120 đến 122°C

Ví dụ mẫu 3

Phương pháp điều chế 2-metyl-1-phenylpropan-2-yl

3-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)-3-oxo-propionat

[Công thức hóa học 10]



Natri hydrua (240 mg, 3 đương lượng) được hòa tan trong DMA (dimethylaxetamid) (2 mL). Dưới sự làm lạnh bằng đá, dung dịch DMA (2 mL) của 2-metyl-1-phenylpropan-2-yl 3-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-3-oxo-propionat (895 mg, 2 mmol) được bổ sung từ từ vào dung dịch, và hỗn hợp được khuấy trong khoảng 30 phút. Sau đó, dung dịch DMA (2 mL) của 2-clo-3-nitro-5-triflometylpyridin (454 mg, 1 đương lượng) được bổ sung từ từ, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong khoảng 4,5 giờ. Nước và axit clo hydric 3 N được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết với etyl axetat. Lớp hữu cơ được cô đặc và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất mong muốn, nghĩa là, 2-metyl-1-phenylpropan-2-yl

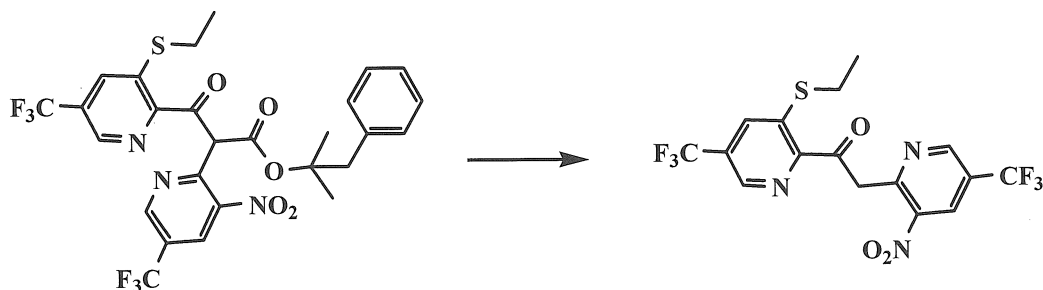
3-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)-3-oxo-propionat (653 mg, chứa khoảng 20% nitropyridin (nguyên liệu ban đầu)).

Ví dụ mẫu 4

Phương pháp điều chế

1-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)etanon

[Công thức hóa học 11]



2-metyl-1-phenylpropan-2-yl

3-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)-3-oxo-pro pionat (653 mg, ca. 0,4 mmol) được hòa tan trong axit triflo axetic (5 mL), và dung dịch được gia nhiệt tại 80°C và khuấy trong khoảng 0,5 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất mong muốn, nghĩa là,

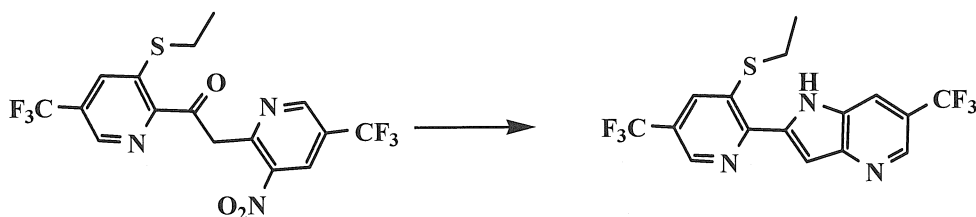
1-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)etanon (172 mg, 98%).

Ví dụ mẫu 5

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 12]



Axit axetic (5 mL) và bột sắt (109 mg, 5 đương lượng) được bổ sung vào

1-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-2-(3-nitro-5-triflometylpyridin-2-yl)etanon (171 mg, 0,39 mmol), và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 80°C trong khoảng 1 giờ. Sau khi hỗn hợp phản ứng được cho phép để nguội xuống nhiệt độ phòng, nước và etyl

axetat được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat 3 lần. Lóp hữu cơ được cô đặc và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất mong muốn, nghĩa là,

2-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrololo[3,2-b]pyridin (98 mg, 65%).

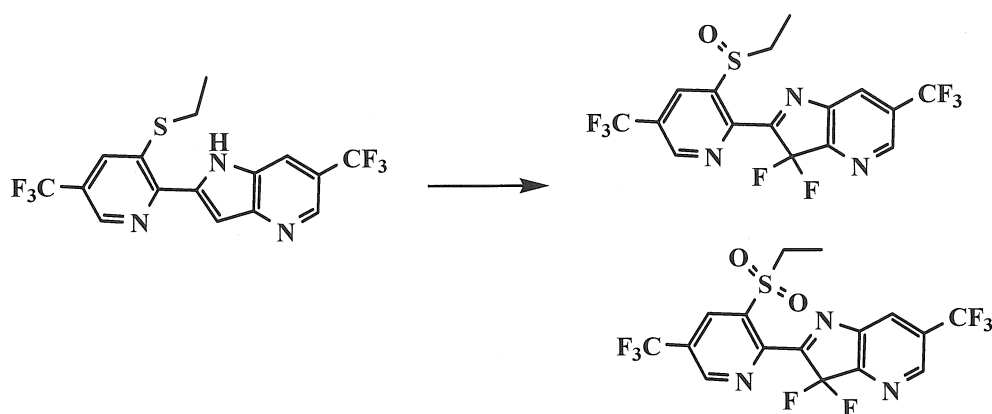
Ví dụ 2

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfinyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-3,3-diflo-6-triflometyl-3H-pyrololo[3,2-b]pyridin (số của hợp chất 1-9) và

2-(3-ethylsulfonyl-5-triflometylpyridin-2-yl)-3,3-diflo-6-triflometyl-3H-pyrololo[3,2-b]pyridin (số của hợp chất 1-10)

[Công thức hóa học 13]



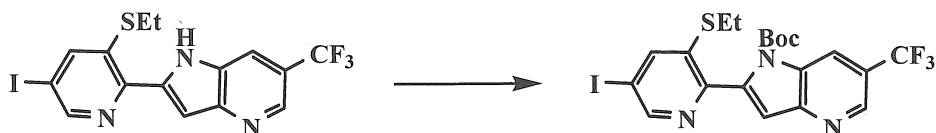
2-(3-ethylthio-5-triflometylpyridin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrololo[3,2-b]pyridin (98 mg, 0,25 mmol), natri bicarbonat (126 mg, 6 đương lượng), nước (54 mg, 12 đương lượng), axetonitril (3 mL) và Selectfluor (531 mg, 6 đương lượng) được trộn và sau đó được khuấy tại nhiệt độ phòng trong khoảng 1 giờ. Silicagel được bổ sung vào hệ phản ứng và hỗn hợp được cô đặc. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để thu được hợp chất sulfoxit mong muốn (26,4 mg, 28%) và hợp chất sulfon mong muốn (39,3 mg, 40%).

Ví dụ mẫu 6

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-1-tert-butoxycacbonyl-6-triflometyl-1H-pyrololo[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 14]



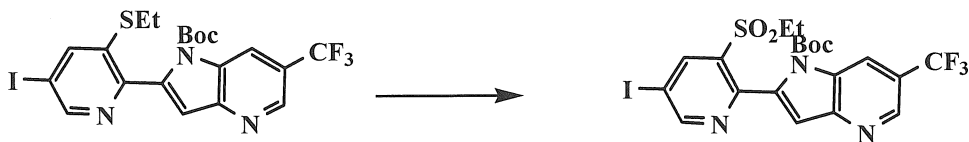
DMAP (4-dimethylaminopyridin) (0,25 g) và Boc_2O (2,6 mL) được bổ sung vào dung dịch THF (40 mL) 2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (4,0 g), mà đã được điều chế theo sơ đồ tương tự như được mô tả trong Ví dụ mẫu từ 3 đến 5, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm. Sau khi hoàn thành phản ứng, dung dịch natri bicacbonat chứa nước bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat khan và sau đó được làm khô trong chân không, và phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để tạo ra hợp chất mong muốn (4,8 g theo định lượng). Boc là viết tắt của tert-butoxycarbonyl.

Ví dụ mẫu 7

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfonyl-5-iodopyridin-2-yl)-1-tert-butoxycarbonyl-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 15]



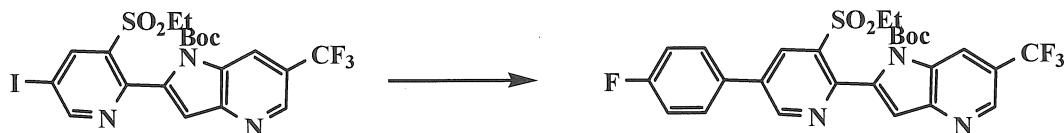
2-(3-ethylthio-5-iodopyridin-2-yl)-1-tert-butoxycarbonyl-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (4,1 g) được điều chế ở bước trước, axit m-cloperoxybenzoic (4,2 g) được bổ sung vào dung dịch etyl axetat (74 mL) tại nhiệt độ phòng, và hỗn hợp được khuấy trong khoảng 2 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, dung dịch natri bicacbonat chứa nước bão hòa và dung dịch natri thiosulfat chứa nước bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri bicacbonat chứa nước bão hòa, được làm khô qua magiê sulfat khan và sau đó được làm khô trong chân không. Phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để thu được hợp chất mong muốn (3,2 g, 72%).

Ví dụ mẫu 8

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfonyl-5-(4-flophenyl)pyridin-2-yl)-1-tert-butoxycarbonyl-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 16]



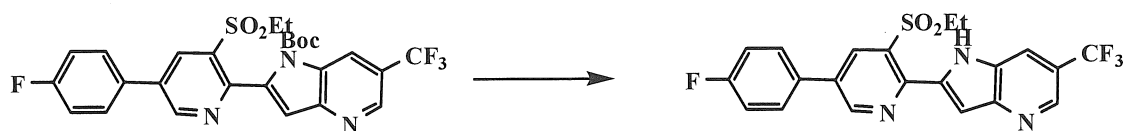
Axit 4-flophenylboronic (0,047 g), PdCl_2 (dppf)-axeton (0,008 g) và Cs_2CO_3 (0,21 g) được bổ sung vào dung dịch DME (1,2-dimetoxyetan)/ H_2O (4:1) (2 mL) của 2-(3-ethylsulfonyl-5-iodopyridin-2-yl)-1-tert-butoxycarbonyl-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (0,13 g) được điều chế ở bước trước, và hỗn hợp được gia nhiệt tại nhiệt độ hồi lưu trong khoảng 1 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm khô trong chân không, và phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để thu được hợp chất mong muốn. Sản phẩm này được đưa vào bước tiếp theo mà không cần tinh chế.

Ví dụ mẫu 9

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfonyl-5-(4-flophenyl)pyridin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin

[Công thức hóa học 17]



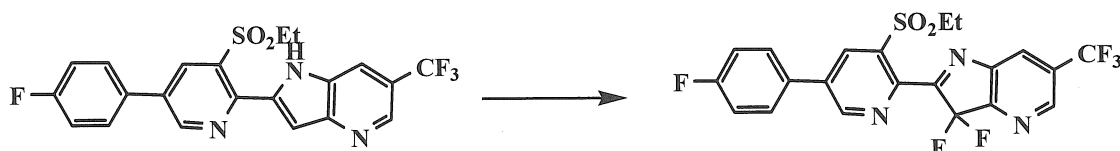
TFA (axit triflo axetic) (10 mL) được bổ sung vào 2-(3-ethylsulfonyl-5-(4-flophenyl)pyridin-2-yl)-1-tert-butoxycarbonyl-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin được điều chế ở bước trước và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm. Sau khi hoàn thành phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm khô trong chân không, và phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để thu được hợp chất mong muốn (0,081 g, 81% (2 bước)).

Ví dụ 3

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfonyl-5-(4-fluorophenyl)pyridin-2-yl)-3,3-difluoro-6-trifluoromethyl-3H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (số của hợp chất 1-19)

[Công thức hóa học 18]



NaHCO₃ (0,034 g) và Selectfluor (0,14 g) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (3 mL) của

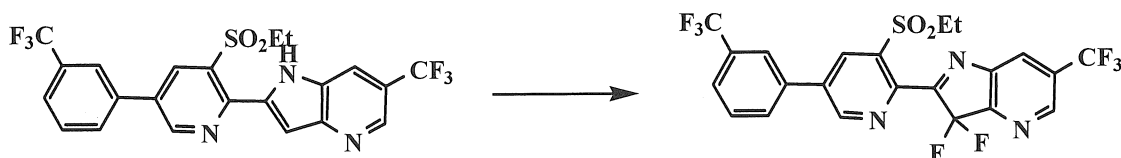
2-(3-ethylsulfonyl-5-(4-fluorophenyl)pyridin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (0,06 g) được điều chế ở bước trước tại nhiệt độ phòng, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 60°C trong khoảng 2 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, dung dịch natri bicacbonat chứa nước bão hòa và dung dịch natri thiosulfat chứa nước bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat khan và sau đó được làm khô trong chân không, và phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để thu được hợp chất mong muốn (0,044 g, 68%).

Ví dụ 4

Phương pháp điều chế

2-(3-ethylsulfonyl-5-(3-trifluoromethylphenyl)pyridin-2-yl)-3,3-difluoro-6-trifluoromethyl-3H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (số của hợp chất 1-20)

[Công thức hóa học 19]



NaHCO₃ (0,034 g) và Selectfluor (0,14 g) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (3 mL) của

2-(3-ethylsulfonyl-5-(3-trifluoromethylphenyl)pyridin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (0,06 g), mà được điều chế bằng phương pháp tương tự trong ví dụ mẫu nêu trên

tại nhiệt độ phòng, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 60°C trong khoảng 2 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng, dung dịch natri bicacbonat chứa nước bão hòa và dung dịch natri thiosulfat chứa nước bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết với etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat khan và sau đó được làm khô trong chân không, và phần còn sót lại được tinh chế bằng phép sắc ký silicagel để thu được hợp chất mong muốn (0,045 g, 63%).

Ở đây, các ví dụ về chế phẩm được thể hiện, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở đó. Trong các ví dụ về chế phẩm, “phần” nghĩa là một phần theo trọng lượng.

Ví dụ về chế phẩm 1

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

Các thành phần nêu trên được trộn đều để hòa tan thu được chế phẩm cô đặc nhũ hóa học.

Ví dụ về chế phẩm 2

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

Các thành phần nêu trên được trộn đều và sau đó được tán thành bột tạo ra chế phẩm dạng bụi.

Ví dụ về chế phẩm 3

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

Canxi lignosulfonat

5 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều. Sau khi sau khi bổ sung lượng nước thích hợp, hỗn hợp được nhào, được kết hạt và được làm khô tạo ra chế phẩm dạng hạt.

Ví dụ về chế phẩm 4

Hợp chất theo sáng chế

20 phần

Kaolin và axit silicic phân tán cao tổng hợp

75 phần

Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi alkylbenzen sulfonat

5 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đều và sau đó được tán thành bột tạo ra chế phẩm bột có thể làm ướt.

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

Ví dụ thử nghiệm 1

Thử nghiệm về tác dụng phòng trừ đối với *Myzus persicae*

Các cây bắp cải Trung Quốc được trồng trong chậu nhựa (đường kính: 8 cm, chiều cao: 8 cm), rệp đào xanh (*Myzus persicae*) được phát tán trên các cây này, và số lượng rệp đào xanh sống sót trong mỗi chậu được đếm. Các hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức chung (1) theo sáng chế hoặc các muối của chúng được phân tán tách biệt trong nước và được pha loãng đến 500 ppm, và các thể phân tán hóa nông được áp dụng đối với tán lá của các cây bắp cải Trung Quốc được trồng trong chậu. Sau khi các thực vật này được làm khô bằng không khí, các chậu được giữ trong nhà kính. Sau 6 ngày áp dụng trên lá, số lượng rệp đào xanh sống sót trên các cây bắp cải Trung Quốc trong mỗi chậu là được đếm, tỷ lệ phòng trừ được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và tác dụng phòng trừ được đánh giá theo tiêu chí được thể hiện dưới đây.

[Công thức toán học 1]

$$\text{Tỷ lệ phòng trừ} = 100 - \{(T \times Ca)/(Ta \times C)\} \times 100$$

Ta: Số lượng sâu hại sống sót trước khi áp dụng trên lá ở điểm xử lý

T: Số lượng sâu hại sống sót sau khi áp dụng trên lá ở điểm xử lý

Ca: Số lượng sâu hại sống sót trước khi áp dụng trên lá ở điểm không xử lý

C: Số lượng sâu hại sống sót sau khi áp dụng trên lá trong điểm không xử lý

Các tiêu chí

A: tỷ lệ phòng trừ là 100%.

B: tỷ lệ phòng trừ là 90 đến 99%.

C: tỷ lệ phòng trừ là 80 đến 89%.

D: tỷ lệ phòng trừ từ 50 đến 79%.

Do đó, các hợp chất 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-34, 1-71, 1-81, 1-99, 1-100, 1-109, 1-169, 1-171, 1-174, 1-176, 1-177, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-194, 1-200, 1-202, 1-209, 1-210, 1-211, 1-212, 1-224, 1-226, 1-239, 1-241, 1-257, 1-287, 1-290, 2-1, 2-3, 2-13 và 2-16 theo sáng chế đã cho thấy mức độ hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 2

Thử nghiệm trừ sâu đối với *Laodelphax striatella*

Các hợp chất dị vòng ngưng tụ có công thức chung (1) theo sáng chế hoặc các muối của chúng được phân tán tách riêng trong nước và được pha loãng đến 500 ppm, và các cây mạ của lúa (loại: Nihonbare) được ngâm trong các dung dịch phân tán hóa nông học trong khoảng 30 giây. Sau khi làm khô bằng không khí, mỗi cây mạ được đặt vào ống nghiệm thủy tinh riêng và được cấy nhiễm mười ấu trùng giai đoạn 3 của *Laodelphax striatella*, và sau đó ống nghiệm thủy tinh được đậy bằng nút bông. Sau 8 ngày cấy nhiễm, số lượng ấu trùng sống sót và ấu trùng chết được đếm, tỷ lệ tử vong được hiệu chỉnh được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và tác dụng trừ sâu được đánh giá theo các tiêu chí của Ví dụ thử nghiệm 1.

[Công thức toán học 1]

Tỷ lệ tử vong được hiệu chỉnh (%)

$$= 100 \times (\text{tỷ lệ sống sót tại điểm không xử lý} - \text{tỷ lệ sống sót tại điểm xử lý}) / \text{tỷ lệ sống sót tại điểm không xử lý}$$

Do đó, các hợp chất 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-34, 1-71, 1-81, 1-99, 1-100, 1-109, 1-169, 1-171, 1-174, 1-176, 1-177, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-194, 1-200, 1-202, 1-209, 1-210, 1-211, 1-212, 1-224, 1-226, 1-239, 1-241, 1-257, 1-287, 1-290, 2-1, 2-3, 2-13 và 2-16 theo sáng chế đã thể hiện mức độ hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 3

Thử nghiệm trừ sâu đối với *Plutella xylostella*

Sâu trưởng thành *Plutella xylostella* được thả ra trên các cây giống bắp cải Trung Quốc và đẻ trứng trên đó. Sau 2 ngày các sâu trưởng thành được thả ra, cây giống bắp cải Trung Quốc với trứng được đặt trên đó đã được nhúng khoảng 30 giây với các dịch phân tán hóa nông được pha loãng đến 500 ppm, mỗi dịch phân tán này chứa một loại hợp chất dị vòng ngưng tụ khác nhau có công thức chung (1) theo sáng chế làm hoạt chất. Sau khi làm khô bằng không khí, các cây giống được giữ trong buồng nhiệt ở 25°C. Sau 6 ngày xử lý nhúng, số lượng ấu trùng nở ra trên mỗi điểm được đếm, tỷ lệ tử vong được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và tác dụng trừ sâu được đánh giá theo các tiêu chí của Ví dụ thử nghiệm 1. Thử nghiệm này được tiến hành lặp lại ba lần sử dụng 10 sâu trưởng thành *Plutella xylostella* trên mỗi điểm.

[Công thức toán học 2]

Tỷ lệ tử vong được hiệu chỉnh (%)

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

Do đó, các hợp chất 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-34, 1-71, 1-81, 1-99, 1-100, 1-109, 1-169, 1-171, 1-174, 1-176, 1-177, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-194, 1-200, 1-202, 1-209, 1-210, 1-211, 1-212, 1-224, 1-226, 1-239, 1-241, 1-257, 1-287, 1-290, 2-1, 2-3, 2-13 và 2-16 theo sáng chế đã thể hiện mức độ hoạt tính được đánh giá là A.

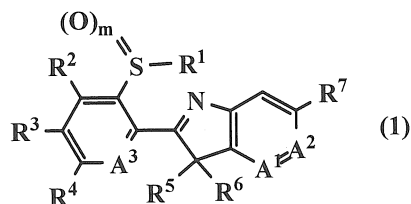
Khả năng áp dụng công nghiệp

Các hợp chất theo sáng chế có hiệu quả cao đối với việc phòng trừ trên khoảng rộng các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt và do đó là hữu dụng.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất 3H-pyrollopyridin có công thức chung (1):

[Công thức hóa học 1]



trong đó

R^1 là

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

R^2 và R^4 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^2 và R^4 này là

- (b1) nguyên tử hydro;
- (b2) nguyên tử halogen;
- (b3) nhóm hydroxyl;
- (b4) nhóm formyl;
- (b5) nhóm xyano;
- (b6) nhóm (C_1 - C_6) alkyl;
- (b7) nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b8) nhóm (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b9) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl;
- (b10) nhóm halo (C_3 - C_6) xycloalkyl;
- (b11) nhóm halo (C_1 - C_6) alkoxy;
- (b12) nhóm (C_1 - C_6) alkylthio;

- (b13) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (b14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (b15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (b16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (b17) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (b18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;
- (b19) nhóm R⁹(R¹⁰)N (trong đó R⁹ và R¹⁰ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁹ và R¹⁰ này là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl hoặc nhóm phenylcacbonyl);
- (b20) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminocacbonyl NH;
- (b21) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminothiocacbonyl NH;
- (b22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (b23) nhóm carboxyl;
- (b24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;
- (b25) nhóm R⁹(R¹⁰)N cacbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (b26) nhóm aryl;
- (b27) nhóm aryl có, từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (b28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;
- (b29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có, từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm

halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b30) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy;

(b31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có, từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b32) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH;

(b33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có, từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b34) nhóm dị vòng; hoặc

(b35) nhóm dị vòng có, từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R³ và R⁷ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R³ và R⁷ này là

(c1) nguyên tử hydro;

(c2) nguyên tử halogen;

(c3) nhóm hydroxyl;

(c4) nhóm formyl;

(c5) nhóm xyano;

(c6) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

- (c7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (c8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c10) nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (c11) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;
- (c13) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (c17) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;
- (c19) nhóm R⁹(R¹⁰)N (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c20) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminocacbonyl NH;
- (c21) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminothiocabonyl NH;
- (c22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c23) nhóm carboxyl;
- (c24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;
- (c25) nhóm R⁹(R¹⁰)N cacbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);
- (c26) nhóm aryl;
- (c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (c28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;

(c29) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c30) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyloxy;

(c31) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c32) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl NH;

(c33) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c34) nhóm dị vòng; hoặc

(c35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl,

R^5 và R^6 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^5 và R^6 này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(d4) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(d5) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl; hoặc

(d6) nhóm (C₁-C₆) alkoxyacetyl, hoặc theo một cách khác

(d7) R⁵ và R⁶ được liên kết với nhau để tạo ra vòng béo có từ 3 đến 6 phần tử,

R³ và R⁴ có thể được kết hợp để tạo ra vòng thơm,

A¹, A² và A³ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A¹, A² và A³ này là nguyên tử nitơ, N-O hoặc nhóm C-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro; hoặc (e2) nguyên tử halogen), và

m là 0, 1 hoặc 2,

N-oxit của nó hoặc muối của nó.

2. Hợp chất 3H-pyrololopyridin theo điểm 1, N-oxit của chúng hoặc muối của chúng, trong đó

R¹ là (a1) nhóm (C₁-C₆) alkyl,

R² và R⁴ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R² và R⁴ này là

(b1) nguyên tử hydro;

(b2) nguyên tử halogen;

(b3) nhóm hydroxyl;

(b6) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(b7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(b8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;

(b9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(b11) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;

(b12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(b14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;

(b16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;

(b18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;

(b19) nhóm R⁹(R¹⁰)N (trong đó R⁹ và R¹⁰ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R⁹ và R¹⁰ này là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl hoặc nhóm phenylcacbonyl);

(b20) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminocacbonyl NH;

(b21) nhóm mono-(C₁-C₆) alkylaminothiocacbonyl NH;

(b22) nhóm C(R⁹)=NOR¹⁰ (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);

(b23) nhóm carboxyl;

(b24) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(b25) nhóm R⁹(R¹⁰)N cacbonyl (trong đó R⁹ và R¹⁰ như được xác định ở trên);

(b26) nhóm aryl;

(b27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b28) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl;

(b29) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b31) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆)

alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b33) nhóm aryl (C₁-C₆) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(b34) nhóm dị vòng; hoặc

(b35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylthio, nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl và nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

R³ và R⁷ có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R³ và R⁷ này là

(c1) nguyên tử hydro;

(c2) nguyên tử halogen;

(c6) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(c7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(c8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;

(c9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(c11) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;

(c12) nhóm (C₁-C₆) alkylthio;

(c14) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl;

(c15) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;

(c16) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;

(c18) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy;

(c19) nhóm $R^9(R^{10})N$ (trong đó mỗi R^9 và R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^9 và R^{10} này là nguyên tử hydro, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkylcacbonyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxycacbonyl hoặc nhóm phenylcacbonyl);

(c20) nhóm mono- (C_1-C_6) alkylaminocacbonyl NH;

(c21) nhóm mono- (C_1-C_6) alkylaminothiocacbonyl NH;

(c22) nhóm $C(R^9)=NOR^{10}$ (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);

(c23) nhóm carboxyl;

(c24) nhóm (C_1-C_6) alkoxycacbonyl;

(c25) nhóm $R^9(R^{10})N$ cacbonyl (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);

(c26) nhóm aryl;

(c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c28) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl;

(c29) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c31) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyloxy có từ 1 đến 5 nhóm thế trên vòng mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c33) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl NH có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c34) nhóm dị vòng; hoặc

(c35) nhóm dị vòng có từ 1 đến 3 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl,

R^5 và R^6 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^5 và R^6 này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C_1-C_6) alkyl;

(d4) nhóm (C_1-C_6) alkylthio;

(d5) nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl; hoặc

(d6) nhóm (C_1-C_6) alkoxyacetyl, hoặc theo một cách khác

(d7) R^5 và R^6 được liên kết với nhau để tạo ra vòng béo có từ 3 đến 6 phần tử,

A^1 , A^2 và A^3 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A^1 , A^2 và A^3 này là nguyên tử nitơ, N-O hoặc nhóm C- R^8 (trong đó R^8 là (e1) nguyên tử hydro), và

m là 0, 1 hoặc 2.

3. Hợp chất 3H-pyrolpyridin theo điểm 1, N-oxit của chúng hoặc muối của chúng, trong đó

R^1 là (a1) nhóm (C_1-C_6) alkyl,

R^2 và R^4 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^2 và R^4 này là

(b1) nguyên tử hydro; hoặc

(b34) nhóm dị vòng,

R^3 và R^7 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^3 và R^7 này là

(c1) nguyên tử hydro;

(c2) nguyên tử halogen;

(c7) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl;

(c9) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl;

(c22) nhóm $C(R^9)=NOR^{10}$ (trong đó R^9 và R^{10} như được xác định ở trên);

(c27) nhóm aryl có từ 1 đến 5 nhóm thế, ở trên vòng, mà có thể giống nhau hoặc khác nhau và được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkyl, nhóm (C_1-C_6) alkoxy, nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy, nhóm (C_1-C_6) alkylthio, nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl, nhóm (C_1-C_6) alkylsulfonyl và nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;

(c28) nhóm aryl (C_1-C_6) alkyl; hoặc

(c34) nhóm dị vòng,

R^5 và R^6 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi R^5 và R^6 này là

(d1) nguyên tử halogen;

(d2) nhóm xyano;

(d3) nhóm (C_1-C_6) alkyl; hoặc

(d6) nhóm (C_1-C_6) alkoxyacetyl,

A^1 , A^2 và A^3 có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi A^1 , A^2 và A^3 này là nguyên tử nito, N-O hoặc nhóm C- R^8 (trong đó R^8 là (e1) nguyên tử hydro), và

m là 1 hoặc 2.

4. Phương pháp tạo ra chất phòng trừ vật ngoại ký sinh hoặc thuốc trừ sâu bao gồm: bước đưa hợp chất 3H-pyrololopyridin theo điểm 1, N-oxit của nó hoặc muối của nó vào chất phòng trừ vật ngoại ký sinh hoặc thuốc trừ sâu.

5. Phương pháp phòng trừ vật ngoại ký sinh bao gồm việc dùng một lượng hiệu quả của hợp chất 3H-pyrololopyridin theo điểm 1, N-oxit của nó hoặc muối của nó vào thực

vật hoặc đất.

6. Phương pháp ức chế côn trùng hoặc vật ngoại ký sinh, bao gồm việc cho côn trùng hoặc vật ngoại ký sinh tiếp xúc với chất phòng trừ vật ngoại ký sinh hoặc thuốc trừ sâu chứa hợp chất 3H-pyrollopyridin theo điểm 1, N-oxit của nó hoặc muối của nó.
7. Chất phòng trừ vật ngoại ký sinh hoặc thuốc trừ sâu bao gồm hợp chất 3H-pyrollopyridin theo điểm 1, N-oxit của chúng hoặc muối của chúng.