



(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)



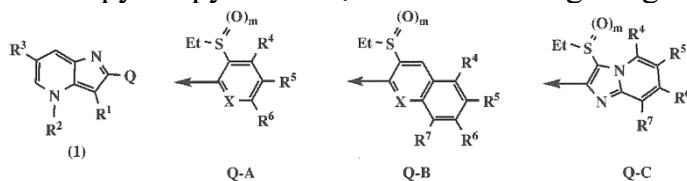
1-0035404

(51)⁷ C07D 471/04; A01P 5/00; C07D 519/00; (13) B
A01P 7/04; A01N 43/90; A01P 7/02

- (21) 1-2019-04055 (22) 26/12/2017
(86) PCT/JP2017/046771 26/12/2017 (87) WO/2018/124128 05/07/2018
(30) 2016-253629 27/12/2016 JP
(45) 25/04/2023 421 (43) 25/12/2019 381A
(73) NIHON NOHYAKU CO., LTD. (JP)
19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386 (JP)
(72) YONEMURA, Ikki (JP); SANO, Yusuke (JP); SHIMIZU, Naoto (JP); MIYASAKA,
Akihiro (JP); SUWA, Akiyuki (JP); FUJIE, Shunpei (JP); TANAKA, Ryosuke (JP).
(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) HỢP CHẤT 4H-PYROLOPYRIDIN, THUỐC TRỪ SÂU DÙNG TRONG NÔNG NGHIỆP VÀ TRỒNG TRỌT CHỨA HỢP CHẤT NÀY, VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT LOÀI GÂY HẠI TRONG NÔNG NGHIỆP VÀ TRỒNG TRỌT

(57) Trong sản xuất cây trồng trên đồng ruộng trong nông nghiệp, trồng trọt và lĩnh vực tương tự, thiệt hại gây ra bởi các côn trùng gây hại v.v. vẫn còn rất lớn, và đã xuất hiện các côn trùng gây hại kháng lại với các thuốc trừ sâu đang lưu hành. Dưới hoàn cảnh đó, sự phát triển của các thuốc trừ sâu mới dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được mong muốn. Sáng chế đề cập đến thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm hợp chất 4H-pyrolOPYRIDIN được biểu diễn bằng công thức chung (1):



{trong đó R¹ là nguyên tử halogen, R² và R³ là nhóm haloalkyl, Q là Q-A, Q-B hoặc Q-C, X là nguyên tử nitơ, R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro, R² và R³ là nguyên tử halogen, nhóm haloalkyl hoặc nhóm phenyl được thế, và m là 2} hoặc muối của nó làm thành phần hoạt tính; và phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến loại nhất định của hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối của nó, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm hợp chất hoặc muối làm thành phần hoạt tính, và phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các hợp chất khác nhau đã được kiểm tra về tiềm năng của chúng để làm các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, và trong số chúng, các loại hợp chất dị vòng ngưng tụ nhất định đã được báo cáo là có tác dụng làm thuốc trừ sâu (ví dụ, xem Tài liệu sáng chế 1 đến 7). Tuy nhiên, tài liệu không bộc lộ bất kỳ hợp chất dị vòng ngưng tụ có vòng 4H-pyrrolopyridin.

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 2014/157600

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề kỹ thuật

Trong sản xuất cây trồng ở các lĩnh vực nông nghiệp, trồng trọt và lĩnh vực tương tự, thiệt hại gây ra bởi các côn trùng gây hại v.v. vẫn còn rất lớn, và sự xuất hiện của các côn trùng gây hại kháng lại với các thuốc trừ sâu đang

lưu hành đang là một vấn đề. Ngoài ra, việc bảo vệ môi trường trên trái đất là thách thức toàn cầu cần được hướng đến cho mọi lĩnh vực, bao gồm cả lĩnh vực nông nghiệp và trồng trọt. Do đó, sự phát triển của các hợp chất mới như các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt có ít tác động đến môi trường được mong muốn.

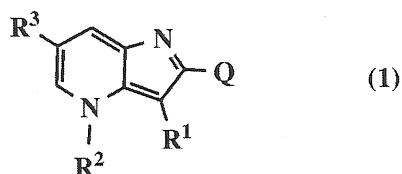
Giải quyết vấn đề

Các tác giả sáng chế đã thực hiện nghiên cứu chuyên sâu để giải quyết các vấn đề nêu trên. Kết quả là, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra là hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) và muối của nó có hiệu quả cao trong việc kiểm soát các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt và có ít tác động đến môi trường. Dựa trên phát hiện này, các tác giả sáng chế đã hoàn thành sáng chế.

Nghĩa là, sáng chế bao gồm những điểm sau.

[1] Hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1):

Công thức hóa học 1



trong đó

R¹ là

- (a1) nguyên tử hydro;
- (a2) nguyên tử halogen;
- (a3) nhóm xyano;
- (a4) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (a5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (a6) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl; hoặc
- (a7) nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl,

R² là

- (b1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (b2) nhóm xyano (C₁-C₆) alkyl;

(b3) nhóm (C₂-C₆) nhóm alkenyl;

(b4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl;

(b5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl;

(b6) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl; hoặc

(b7) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl,

R³ là

(c1) nguyên tử halogen;

(c2) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(c3) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;

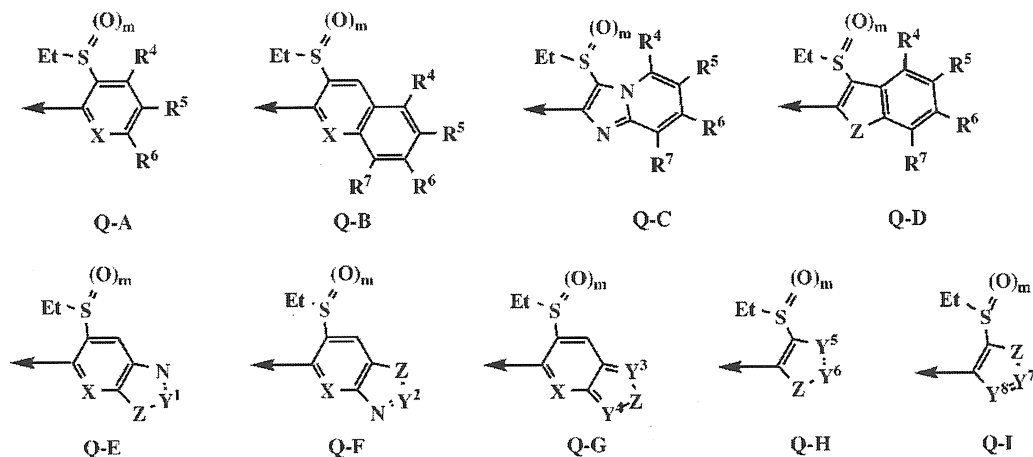
(c4) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;

(c5) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl; hoặc

(c6) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

Q là vòng được biểu diễn bằng công thức cấu tạo bất kỳ dưới đây Q-A, Q-B, Q-C, Q-D, Q-E, Q-F, Q-G, Q-H và Q-I:

Công thức hóa học 2



(trong đó

X là nhóm CH hoặc nguyên tử nitơ,

R⁴, R⁵, R⁶ và R⁷ có thể giống hoặc khác nhau, và mỗi kí hiệu là

(d1) nguyên tử hydro;

(d2) nguyên tử halogen;

(d3) nhóm formyl;

(d4) nhóm xiano;

(d5) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

- (d6) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (d7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl;
- (d8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (d9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (d10) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (d11) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (d12) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (d13) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (d14) N(R²⁰)(R²¹) (trong đó R²⁰ là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl, và R²¹ là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl);
- (d15) C(R²⁰)=NO(R²¹) (trong đó R²⁰ và R²¹ như được định nghĩa ở trên);
- (d16) nhóm aryl;
- (d17) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcarbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycarbonyl;
- (d18) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy;
- (d19) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy nhóm có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế which có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆)

alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(d20) nhóm dị vòng; hoặc

(d21) nhóm dị vòng có, ở trong vòng, 1 hoặc 2 các nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl,

Z là O, S hoặc N-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro, (e2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (e3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl hoặc (e4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y¹ là C-R⁹ (trong đó R⁹ là (f1) nguyên tử hydro, (f2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl hoặc (f4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y² là C-R¹⁰ (trong đó R¹⁰ là (g1) nguyên tử hydro, (g2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (g3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl hoặc (g4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y³, Y⁴, Y⁵ và Y⁸ là nhóm CH hoặc N,

Y⁶ và Y⁷ có thể giống hoặc khác nhau, và là C-R¹¹ (trong đó

R¹¹ là

(h1) nguyên tử halogen;

(h2) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(h3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(h4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(h5) nhóm aryl; hoặc

(h6) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl),

mỗi mũi tên là liên kết vào vòng 4H-pyrololopyridin,

m là 0, 1 hoặc 2; và

Et đại diện cho nhóm etyl)},

hoặc muối của nó.

[2] Hợp chất 4H-pyrololopyridin hoặc muối theo mục [1] nêu trên, trong đó Q là Q-A, Q-B hoặc Q-C.

[3] Việc sử dụng hợp chất 4H-pyrololopyridin hoặc muối theo mục [1] hoặc [2] nêu trên làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt.

[4] Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, bao gồm xử lý cây hoặc đất với thành phần hoạt tính của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được xác định trong mục [3] nêu trên.

[5] Phương pháp kiểm soát các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt, bao gồm xử lý cây hoặc đất với lượng hữu hiệu của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được xác định trong mục [3] nêu trên.

[6] Tác nhân kiểm soát loài ngoại ký sinh trên động vật bao gồm hợp chất 4H-pyrololopyridin hoặc muối theo mục [1] hoặc [2] nêu trên làm thành phần hoạt tính.

[7] Phương pháp kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật, bao gồm quá trình xử lý các vật ngoại ký sinh trên động vật với lượng hữu hiệu của tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật theo mục [6] nêu trên.

Hiệu quả đạt được của sáng chế

Hợp chất 4H-pyrollopyridin của sáng chế hoặc muối của nó không chỉ có hiệu quả cao làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt mà còn có hiệu quả diệt các loài gây hại mà sống trên vật nuôi như là chó và mèo và gia súc như là trâu bò và cừu.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong các định nghĩa về công thức chung (1) là hợp chất 4H-pyrollopyridin của sáng chế hoặc muối của nó, “halo” là “nguyên tử halogen” và là nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iot hoặc nguyên tử flo.

“Nhóm (C_1 - C_6) alkyl” là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm isobutyl, nhóm sec-butyl, nhóm tert-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm isopentyl, nhóm tert-pentyl, nhóm neopentyl, nhóm 2,3-dimethylpropyl, nhóm 1-ethylpropyl, nhóm 1-methylbutyl, nhóm 2-methylbutyl, nhóm n-hexyl, nhóm isohexyl, nhóm 2-hexyl, nhóm 3-hexyl, nhóm 2-methylpentyl, nhóm 3-methylpentyl, nhóm 1,1,2-trimethyl propyl, nhóm 3,3-dimethylbutyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C_2 - C_6) alkenyl” là nhóm alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm vinyl, nhóm allyl, nhóm isopropenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 2-metyl-2-propenyl, nhóm 1-metyl-2-propenyl, nhóm 2-metyl-1-propenyl, nhóm pentenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 3,3-dimetyl-1-butenyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C_2 - C_6) alkynyl” là nhóm alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butynyl, nhóm 2-butynyl, nhóm 3-butynyl, nhóm 3-metyl-1-propynyl, nhóm 2-metyl-3-propynyl, nhóm pentynyl, nhóm 1-hexynyl, nhóm 3-metyl-1-butynyl, nhóm 3,3-dimetyl-1-butynyl hoặc nhóm tương tự.

“Nhóm (C_3 - C_6) xycloalkyl” là nhóm xyclic alkyl có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C_1 - C_6) alkoxy” là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ,

nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm isopropoxy, nhóm n-butoxy, nhóm sec-butoxy, nhóm tert-butoxy, nhóm n-pentyloxy, nhóm isopentyloxy, nhóm tert-pentyloxy, nhóm neopentyloxy, nhóm 2,3-dimethylpropyloxy, nhóm 1-ethylpropyloxy, nhóm 1-methylbutyloxy, nhóm n-hexyloxy, nhóm isohexyloxy, nhóm 1,1,2-trimethylpropyloxy hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy” là nhóm alkenyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenyloxy, nhóm butenyloxy, nhóm pentenyloxy, nhóm hexenyloxy hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy” là nhóm alkynyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynyloxy, nhóm butynyloxy, nhóm pentynyloxy, nhóm hexynyloxy hoặc nhóm tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkylthio” là nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylthio, nhóm ethylthio, nhóm n-propylthio, nhóm isopropylthio, nhóm n-butylthio, nhóm sec-butylthio, nhóm tert-butylthio, nhóm n-pentylthio, nhóm isopentylthio, nhóm tert-pentylthio, nhóm neopentylthio, nhóm 2,3-dimethylpropylthio, nhóm 1-ethylpropylthio, nhóm 1-methylbutylthio, nhóm n-hexylthio, nhóm isohexylthio, nhóm 1,1,2-trimethylpropylthio hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl” là nhóm alkylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylsulfinyl, nhóm ethylsulfinyl, nhóm n-propylsulfinyl, nhóm isopropylsulfinyl, nhóm n-butylsulfinyl, nhóm sec-butylsulfinyl, nhóm tert-butylsulfinyl, nhóm n-pentylsulfinyl, nhóm isopentylsulfinyl, nhóm tert-pentylsulfinyl, nhóm neopentylsulfinyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfinyl, nhóm 1-ethylpropylsulfinyl, nhóm 1-methylbutylsulfinyl, nhóm n-hexylsulfinyl, nhóm isohexylsulfinyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfinyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl” là nhóm alkylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 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 nhóm tương tự.

“Nhóm (C₂-C₆) alkenylthio” là nhóm alkenylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenylthio, nhóm butenylthio, nhóm pentenylthio, nhóm hexenylthio hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₂-C₆) alkynylthio nhóm” là nhóm alkynylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynylthio, nhóm butynylthio, nhóm pentynylthio, nhóm hexynylthio hoặc nhóm tương tự.

“Nhóm (C₂-C₆) alkenylsulfinyl” là nhóm alkenylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propenylsulfinyl, nhóm butenylsulfinyl, nhóm pentenylsulfinyl, nhóm hexenylsulfinyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₂-C₆) alkynylsulfinyl” là nhóm alkynylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm propynylsulfinyl, nhóm butynylsulfinyl, nhóm pentynylsulfinyl, nhóm hexynylsulfinyl hoặc nhóm tương tự.

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

“Nhóm (C₃-C₆) xycloalkoxy” là nhóm alkoxy vòng có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropoxy, nhóm xyclobutoxy, nhóm xyclopentyloxy, nhóm xyclohexyloxy hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₃-C₆) xycloalkylthio” là nhóm alkylthio vòng có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylthio, nhóm xyclobutylthio, nhóm xyclopentylthio, nhóm xyclohexylthio hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₃-C₆)

xycloalkylsulfinyl” là nhóm alkylsulfinyl vòng có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylsulfinyl, nhóm xyclobutylsulfinyl, nhóm xyclopentylsulfinyl, nhóm xyclohexylsulfinyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl” là nhóm alkylsulfonyl vòng có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm xyclopropylsulfonyl, nhóm xyclobutylsulfonyl, nhóm xyclopentylsulfonyl, nhóm xyclohexylsulfonyl hoặc nhóm tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl” là nhóm alkylcacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metylcacbonyl, nhóm etylcacbonyl, nhóm n-propylcacbonyl, nhóm isopropylcacbonyl, nhóm n-butylcacbonyl, nhóm sec-butylcacbonyl, nhóm tert-butylcacbonyl, nhóm n-pentylcacbonyl, nhóm isopentylcacbonyl, nhóm tert-pentylcacbonyl, nhóm neopentylcacbonyl, nhóm 2,3-dimetylpropylcacbonyl, nhóm 1-etylpropylcacbonyl, nhóm 1-metylbutylcacbonyl, nhóm n-hexylcacbonyl, nhóm isohexylcacbonyl, nhóm 1,1,2-trimetylpropylcacbonyl hoặc nhóm tương tự. “Nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl” là nhóm alkoxycacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm n-propoxycacbonyl, nhóm isopropoxycacbonyl, nhóm n-butoxycacbonyl, nhóm sec-butoxycacbonyl, nhóm tert-butoxycacbonyl, nhóm n-pentoxycacbonyl, nhóm isopentyloxycacbonyl, nhóm tert-pentyloxycacbonyl, nhóm neopentyloxycacbonyl, nhóm 2,3-dimetylpropyloxycacbonyl, nhóm 1-etylpropyloxycacbonyl, nhóm 1-metylbutyloxycacbonyl, nhóm n-hexyloxycacbonyl, nhóm isohexyloxycacbonyl, nhóm 1,1,2-trimetylpropyloxycacbonyl hoặc nhóm tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkyl”, “nhóm (C₂-C₆) nhóm alkenyl”, “(C₂-C₆) alkynyl”, “nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl”, “nhóm (C₃-C₆) xycloalkoxy”, “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) xycloalkyl”, “nhóm (C₁-C₆) alkoxy”, “nhóm (C₂-C₆) alkenyloxy”, “nhóm (C₂-C₆) alkynyloxy”, “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylthio”, “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” và “nhóm (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl” được đề cập ở trên có thể được thế với một hoặc nhiều nguyên tử halogen tại (các) vị trí có thể thế được ở vị trí của (các) nguyên tử hydro, và trong trường hợp mà nhóm bất kỳ trong số các nhóm được liệt kê ở trên được thế với hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống hoặc khác nhau.

“Các nhóm được thế được đề cập ở trên với một hoặc nhiều nguyên tử halogen” 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) xycloalkoxy”, “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) xycloalkyl”, “nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy”, “nhóm halo (C₂-C₆) alkenyloxy”, “nhóm halo (C₂-C₆) alkynyloxy”, “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylthio”, “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfinyl” và “nhóm halo (C₃-C₆) xycloalkylsulfonyl”.

Các cách thể hiện “(C₁-C₆)”, “(C₂-C₆)”, “(C₃-C₆)”, v.v. đều chỉ phạm vi số lượng các nguyên tử cacbon trong mỗi nhóm. Định nghĩa tương tự cũng đúng với các nhóm mà trong đó hai hoặc nhiều nhóm được đề cập ở trên được ghép với nhau, và ví dụ, “nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl” nghĩa là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon được liên kết vào nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon.

“Nhóm aryl” là nhóm hydrocacbon thơm có từ 6 đến 10 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm phenyl, nhóm 1-naphthyl, nhóm 2-naphthyl hoặc nhóm

tương tự. Nhóm aryl đặc biệt tốt hơn là nhóm phenyl.

Các ví dụ về “nhóm dị vòng” và “vòng dị vòng” bao gồm nhóm dị vòng không thơm đơn vòng có từ 5 đến 6 phần tử hoặc nhóm dị vòng không thơm đơn vòng có từ 4 đến 6 phần tử chứa, như các nguyên tử vòng, một hoặc nhiều các nguyên tử cacbon và 1 đến 4 dị nguyên tử được chọn từ nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh và nguyên tử nitơ, và cũng bao gồm nhóm dị vòng thơm ngưng tụ được tạo ra bằng cách ngưng tụ của chất dị vòng thơm đơn vòng này với vòng benzen; và nhóm dị vòng thơm ngưng tụ được tạo ra bằng cách ngưng tụ vòng thơm đơn vòng này với vòng benzen.

Các ví dụ về “nhóm dị vòng thơm” bao gồm các nhóm dị vòng thơm đơn vòng như là furyl, thienyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl và triazinyl; và nhóm dị vòng thơm ngưng tụ như là 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 các nhóm dị vòng không thơm đơn vòng như là oxetanyl, thietanyl, azetidiny, pyrrolidinyl, pyrrolidinyl-2-on, piperidinyl, morpholiny, thiomorpholiny, piperazinyl, hexametyleniminy, 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, pyranyl, tetrahydropyranyl, thiopyranyl, tetrahydrothiopyranyl, 1-oxit tetrahydrothiopyranyl, 1,1-dioxit tetrahydrothiopyranyl, tetrahydrofuranyl, dioxanyl, pyrazolidinyl, pyrazolinyl, tetrahydropyrimidinyl, dihydrotriazolyl và tetrahydrotriazolyl.

Các ví dụ ưu tiên về “nhóm dị vòng” bao gồm isoxazolyl, pyrimidinyl,

pyrazinyl, pyridyl, pyrazolyl, thiazoyl, thienyl, pyrolyl, benzimidazolyl, benzofuranyl, benzothienyl và pyrrolidinyl-2-on.

Các ví dụ về muối của hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế bao gồm các muối của axit vô cơ, như là hydroclorua, sulfat, nitrat và phosphat; các muối của axit hữu cơ, như là axetat, fumarat, maleat, oxalat, metansulfonat, benzensulfonat và p-toluensulfonat; và các muối với an bazơ vô cơ hoặc hữu cơ như là ion natri, ion kali, ion canxi và ion trimetylamon.

Hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế và muối của nó có thể có một hoặc nhiều các tâm bất đối xứng trong công thức cấu tạo, và có thể tồn tại dưới dạng hai hoặc nhiều loại đồng phân quang học hoặc đồng phân phi đối hình. Tất cả đồng phân quang học và các hỗn hợp các đồng phân ở tỷ lệ bất kỳ cũng được bao gồm trong sáng chế. Hơn nữa, hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế và muối của nó có thể tồn tại dưới dạng hai loại đồng phân hình học do liên kết đôi cacbon-cacbon hoặc liên kết đôi cacbon-nitơ trong công thức cấu tạo. Tất cả các đồng phân hình học và các hỗn hợp của các đồng phân ở tỷ lệ bất kỳ cũng được bao gồm trong sáng chế.

Trong hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của nó,

R^1 tốt hơn là

- (a1) nguyên tử hydro;
- (a2) nguyên tử halogen;
- (a3) nhóm xyano;
- (a4) nhóm (C_1-C_6) alkyl;
- (a5) nhóm (C_1-C_6) alkoxy;
- (a6) nhóm (C_1-C_6) alkylcacbonyl; hoặc
- (a7) nhóm (C_1-C_6) alkoxycacbonyl,

R^2 tốt hơn là

- (b1) nhóm (C_1-C_6) alkyl;

- (b2) a xyano (C_1-C_6) alkyl;
- (b3) nhóm (C_2-C_6) nhóm alkenyl;
- (b4) nhóm (C_2-C_6) alkynyl;
- (b5) nhóm (C_1-C_6) alkoxy (C_1-C_6) alkyl;
- (b6) nhóm (C_1-C_6) alkylthio (C_1-C_6) alkyl; hoặc
- (b7) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl,

R^3 tốt hơn là

- (c1) nguyên tử halogen;
- (c2) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl;
- (c3) nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy;
- (c4) nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio;
- (c5) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl; hoặc
- (c6) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl,

Q tốt hơn là Q-A, Q-B hoặc Q-C,

X tốt hơn là nhóm CH hoặc nguyên tử nitơ,

R^4 , R^5 , R^6 và R^7 có thể giống hoặc khác nhau, và tốt hơn là

- (d1) nguyên tử hydro;
- (d2) nguyên tử halogen;
- (d3) nhóm formyl;
- (d4) nhóm xyano;
- (d5) nhóm (C_1-C_6) alkyl;
- (d6) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl;
- (d7) nhóm (C_3-C_6) xycloalkyl (C_1-C_6) alkyl;
- (d8) nhóm (C_1-C_6) alkoxy;
- (d9) nhóm halo (C_1-C_6) alkyl;
- (d10) nhóm halo (C_1-C_6) alkoxy;
- (d11) nhóm halo (C_1-C_6) alkylthio;
- (d12) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfinyl;
- (d13) nhóm halo (C_1-C_6) alkylsulfonyl;
- (d14) $N(R^{20})(R^{21})$ (trong đó R^{20} là nguyên tử hydro, nhóm (C_1-C_6) alkyl, nhóm

halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl, và R²¹ là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl nhóm);

(d15) C(R²⁰)=NO(R²¹) (trong đó R²⁰ và R²¹ như được định nghĩa ở trên);

(d16) nhóm aryl;

(d17) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(d18) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy;

(d19) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy nhóm có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(d20) nhóm dị vòng; hoặc

(d21) nhóm dị vòng có, ở trong vòng, 1 hoặc 2 các nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆)

alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl,

Z tốt hơn là O, S hoặc N-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro, (e2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (e3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl nhóm hoặc (e4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y¹ tốt hơn là C-R⁹ (trong đó R⁹ là (f1) nguyên tử hydro, (f2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl nhóm hoặc (f4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y² tốt hơn là C-R¹⁰ (trong đó R¹⁰ là (g1) nguyên tử hydro, (g2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (g3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl nhóm hoặc (g4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y³, Y⁴, Y⁵ và Y⁸ tốt hơn là nhóm CH hoặc N,

Y⁶ và Y⁷ có thể giống hoặc khác nhau, và tốt hơn là C-R¹¹ (trong đó R¹¹ là

(h1) nguyên tử halogen;

(h2) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(h3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(h4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(h5) nhóm aryl; hoặc

(h6) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆)

alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl),

mỗi mũi tên là liên kết vào vòng 4H-pyrololopyridin, và

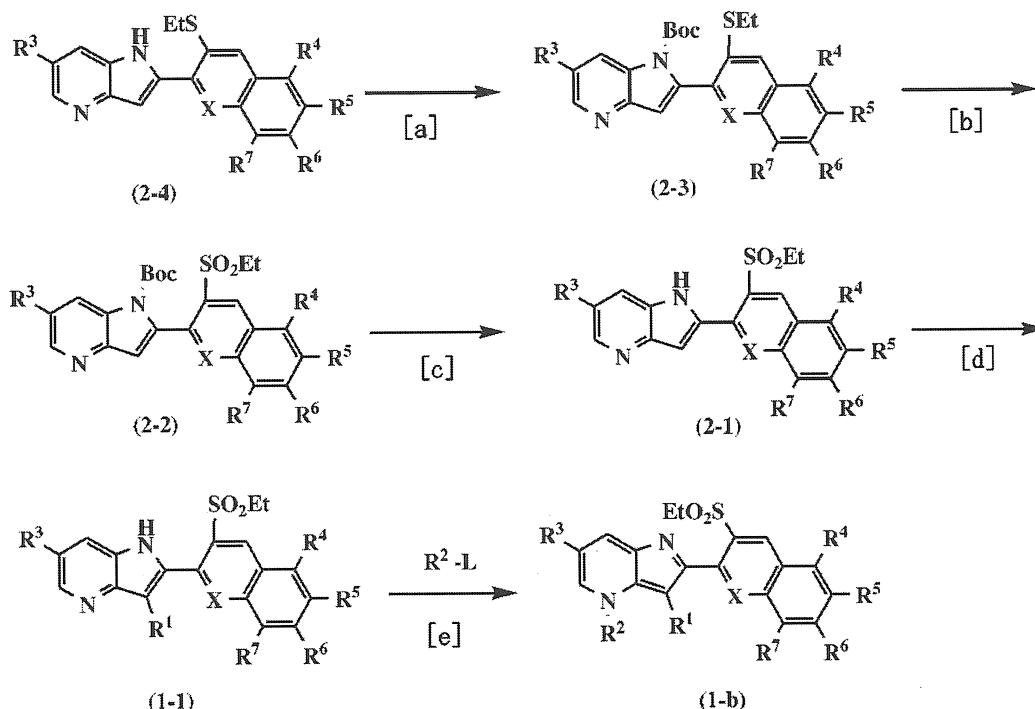
m tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

Các dạng kết hợp của R¹, R², R³ và Q được xác định ở trên tốt hơn là là các ví dụ của công thức (1).

Hợp chất 4H-pyrololopyridin của sáng chế hoặc muối của nó có thể được điều chế theo, ví dụ, phương pháp điều chế được mô tả dưới đây, mà không phải là ví dụ giới hạn.

Phương pháp điều chế 1 (trường hợp mà Q is Q-B)

Công thức hóa học 3



(Trong công thức, R¹, R², R³ và X như được định nghĩa ở trên, Boc là nhóm t-butoxycacbonyl, và L là nhóm rời đi như là nguyên tử halogen)

Phương pháp điều chế ở [Bước a]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-3) có thể được điều chế từ hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-4), mà được điều chế theo phương pháp điều chế trung gian dưới đây hoặc phương pháp điều chế được mô tả trong tài liệu WO 2014/157600, theo phương pháp được mô

tả trong tài liệu Greene's Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

Phương pháp điều chế tại [Bước b]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-2) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-3) với tác nhân oxy hóa trong dung môi trơ.

Các ví dụ về tác nhân oxy hóa được sử dụng trong bước này bao gồm các peroxit như là dung dịch hydro peroxit, axit pebenzoic và axit m-cloperoxybenzoic. Lượng tác nhân oxy hóa sử dụng được chọn thích hợp trong phạm vi từ 2 đến 5 lần lượng mol tương ứng với hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-3).

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

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này được chọn trong phạm vi thích hợp từ -10°C đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi với quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và yếu tố tương tự và không giống nhau trong từng trường hợp, nhưng về cơ bản được chọn như trong phạm vi thích hợp từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng được kết thúc, oxit sinh ra được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn.

Phương pháp điều chế tại [Bước c]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-1) có thể được điều

chế từ hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-2) theo phương pháp được mô tả trong tài liệu Greene's Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

Phương pháp điều chế tại [Bước d]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1-1) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-1) với tác nhân halogen hóa trong dung môi bất hoạt.

Các ví dụ về tác nhân halogen hóa (clo hóa, brom hóa hoặc iot hóa) được sử dụng trong bước này bao gồm các phân tử halogen như là các phân tử clo, brom hoặc iot; các tác nhân halogen hóa như là thionyl clorua, sulfuryl clorua và phosphorus tribromua; các succinimid như là N-closuccinimid (NCS), N-bromsuccinimid (NBS) và N-iotosuccinimid (NIS); và các hydantoin như là 1,3-dibrom-5,5-dimethylhydantoin (DBH) và 1,3-diiodo-5,5-dimethylhydantoin (DIH). Lượng tác nhân halogen hóa được sử dụng có thể được chọn như trong phạm vi thích hợp từ 1- đến gấp 5 lần lượng mol tương ứng với hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (2-1).

Dung môi trơ được sử dụng trong quá trình halogen hóa (clo hóa, brom hóa hoặc iot hóa) có thể là dung môi bất kỳ mà không ức chế phản ứng rõ rệt, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như là benzen, toluen và xylen; các hydrocacbon được halogen hóa như là metylen clorua và clorofom; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như là clobenzen và diclobenzen; các nitril như là axetonitril; các este như là etyl axetat; các axit hữu cơ như là axit formic và axit axetic; và các dung môi phân cực như là nước. Một trong số các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn lẻ, và đồng thời hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng dưới dạng hỗn hợp.

Các ví dụ về tác nhân flo hóa mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm N-flo-N'-(clometyl)trietylendiamin bis(tetrafloroborat), Selectflo, $(\text{PhSO}_2)_2\text{NF}$ và N-flopyridin triflat. Selectflo được ưu tiên. Lượng tác nhân halogen hóa được sử dụng, như là tác nhân flo hóa, thường từ 1 đến 5 mol tương đương với 1 mol hợp chất của công thức chung (2-1) mà trong đó R^1 là

nguyên tử iot, nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo.

Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng trong quá trình halogen hóa, như là quá trình flo hóa, bao gồm các bazơ vô cơ như là 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 là trietylamin, pyridin và piperidin. Lượng bazơ được sử dụng thường từ 1 đến 10 mol tương đương với 1 mol hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1-1).

Dung môi hữu cơ được sử dụng trong quá trình halogen hóa, như là flo hóa, không bị giới hạn cụ thể và có thể là dung môi hữu cơ bất kỳ trơ với phản ứng. Các ví dụ về dung môi hữu cơ bao gồm các dung môi nitril như là axetonitril và benzonitril; nước; và dung môi hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại trong số chúng.

Nhiệt độ phản ứng trong quá trình halogen hóa được chọn thích hợp từ phạm vi từ -10°C đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi với quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và yếu tố tương tự và không giống nhau trong từng trường hợp, nhưng về cơ bản được chọn như trong phạm vi thích hợp từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng được kết thúc, oxit sinh ra được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn.

Trong trường hợp mà R^1 trong công thức chung (1-1) là nguyên tử flo, hợp chất mong muốn cũng có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất của công thức chung (1-1) mà trong đó R^1 là nguyên tử iot, nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo, mà hợp chất được điều chế ở bước d, với tác nhân flo hóa với sự có mặt của bazơ trong dung môi trơ bằng phương pháp thông thường đã biết đối với người có trình độ. Trong trường hợp mà R^1 trong công thức chung (1-1) không phải là nguyên tử halogen, nghĩa là, R^1 là (a1) hoặc bất kỳ trong số từ (a3) đến (a7), hợp chất mong muốn có thể được điều chế dễ dàng bằng phương pháp đã biết hoặc bằng chính phương pháp này.

Phương pháp điều chế tại [Bước e]

Hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1-b) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1-1) với R^2-L với sự có mặt của bazơ trong dung môi trơ.

Dung môi hữu cơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi hữu cơ bất kỳ trơ đối với phản ứng. Các ví dụ về dung môi hữu cơ bao gồm các dung môi ete như là dioxan, 1,2-dimetoxyetan và tetrahydrofuran; các dung môi hydrocacbon thơm như là toluen, benzen và xylene; các dung môi amid như là N,N-dimetylformamid, N,N-dimetylaxetamid và N-metylpyrrolidon; và dung môi hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại trong số chúng.

Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng nêu trên bao gồm các bazơ vô cơ như là natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, bari hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat và kali phosphat; các alkoxit như là kali t-butoxit, natri methoxit và natri ethoxit; các hydrua kim loại kiềm như là natri hydrua và kali hydrua; và các amin như là trietylamin, pyridin và piperidin. Lượng bazơ được sử dụng thường từ 1 đến 10 mol tương đương với 1 mol hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1-1).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng số mol của các chất phản ứng, hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1-1) và R^2-L về cơ bản được sử dụng theo các lượng mol bằng nhau, nhưng chúng đều có thể được sử dụng với lượng dư.

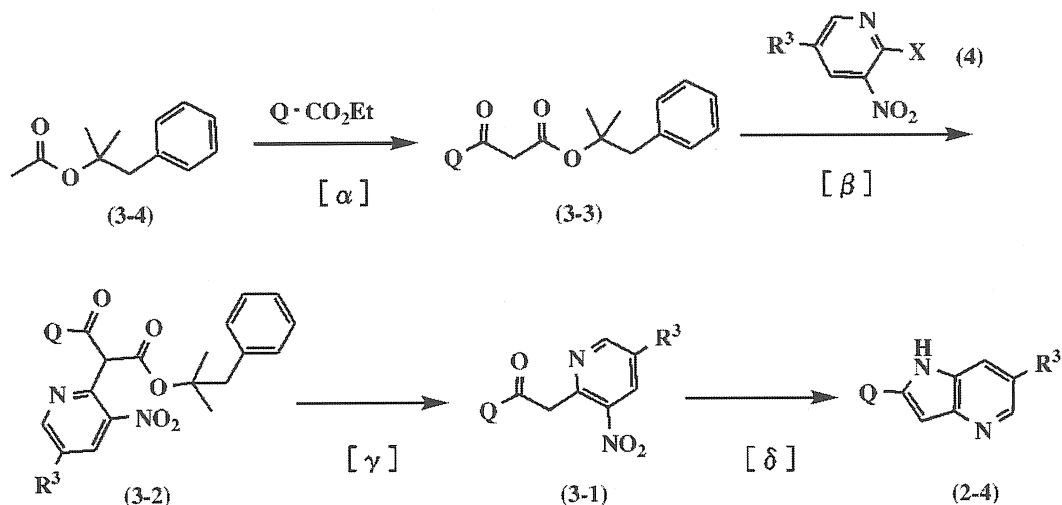
Nhiệt độ phản ứng thường trong phạm vi từ nhiệt độ phòng đến điểm sôi của dung môi được sử dụng. Thời gian phản ứng thường từ vài phút đến hàng giờ. Phản ứng tốt hơn là được thực hiện dưới môi trường khí trơ. Sau khi phản ứng được kết thúc, hợp chất mong muốn được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn.

Các hợp chất có vòng khác với Q-B có thể được điều chế bằng phương pháp đã biết hoặc bằng chính phương pháp này theo cùng cách như trong

phương pháp điều chế 1 nêu trên.

Phương pháp điều chế trung gian

Công thức hóa học 4



(Trong công thức, R^3 và Q như được định nghĩa ở trên, và X là nhóm rời đi như là nguyên tử halogen.)

Phương pháp điều chế tại [Bước α]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (3-3) có thể được điều chế bằng quá trình ngưng tụ Claisen (Org. React. 1942, 1, 266) hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (3-4) với dẫn xuất este của axit axetic được biểu diễn bằng $Q \cdot CO_2Et$.

Phương pháp điều chế tại [Bước β]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (3-2) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất β -ketoeste được biểu diễn bằng công thức chung (3-3) với hợp chất nitro được biểu diễn bằng công thức chung (4) với sự có mặt của bazơ trong dung môi trơ.

Dung môi hữu cơ được sử dụng trong phản ứng này không bị giới hạn cụ thể và có thể là dung môi hữu cơ bất kỳ trơ đối với phản ứng. Các ví dụ về dung môi hữu cơ bao gồm các dung môi ete như là dioxan, 1,2-dimethoxyetan và tetrahydrofuran; các dung môi hydrocarbon thơm như là toluen, benzen và xylen; các dung môi amid như là N,N-dimetylformamid, N,N-dimetylaxetamid và N-metylpyrrolidon; và dung môi hỗn hợp của hai

hoặc nhiều loại trong số chúng.

Các ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các bazơ vô cơ như là natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, bari hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat và kali phosphat; các alkoxit như là kali t-butoxit, natri methoxit và natri ethoxit; các hydrua kim loại kiềm như là natri hydrua và kali hydrua; và các amin như là trietylamin, pyridin và piperidin. Lượng bazơ được sử dụng thường từ 1 đến 10 mol tương đương với 1 mol hợp chất (3-3).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng số mol của các chất phản ứng, hợp chất (3-3) và hợp chất (4) về cơ bản được sử dụng theo các lượng mol bằng nhau, nhưng một trong số chúng có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng thường trong phạm vi từ nhiệt độ phòng đến điểm sôi của dung môi được sử dụng. Thời gian phản ứng thường từ vài phút đến hàng giờ. Phản ứng tốt hơn là được thực hiện dưới môi trường khí trơ. Sau khi phản ứng được kết thúc, hợp chất mong muốn (3-2) được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn.

Phương pháp điều chế tại [Bước γ]

Hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (3-1) có thể được điều chế bằng cách xử lý hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (3-2) với axit với sự có mặt hoặc không có mặt của dung môi.

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

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ức chế rõ rệt tiến trình phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như là benzen, toluen và xylen; các hydrocacbon béo được halogen hóa như là metylen clorua, clorofom và cacbon tetraclorea; các hydrocacbon thơm được halogen hóa như là clobenzen và diclobenzen; các amid như là dimetylformamid và dimetylaxetamid; các keton như là axeton và metyl etyl keton; và các dung môi phân cực như là 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Một trong số các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn lẻ, và đồng thời hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng dưới dạng hỗn hợp. Trong trường hợp mà axit được sử dụng làm dung môi, không cần phải sử dụng dung môi khác.

Nhiệt độ phản ứng có thể ở trong phạm vi từ nhiệt độ phòng đến điểm sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi với quy mô phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản là ở trong phạm vi từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng được kết thúc, hợp chất mong muốn (3-1) được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn.

Phương pháp điều chế tại [Bước δ]

Hợp chất 4H-pyrololopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (2-4) có thể được điều chế bằng cách khử và khử nước hợp chất nitro được biểu diễn bằng công thức chung (3-1).

Đối với quá trình khử, các điều kiện khử của các nhóm nitro được mô tả trong tài liệu đã biết (xem tài liệu “New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza)”, vol. 15, Oxidation và Reduction II, 1977, edited by Chemical Society of Japan, published by 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 là metanol và etanol; các ete như là tetrahydrofuran và

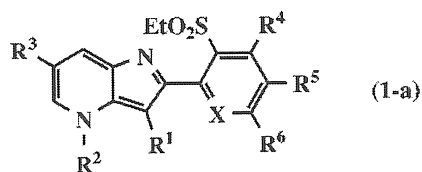
dioxan; các axit hữu cơ như là axit formic và axit axetic; và nước. Một trong số các dung môi trơ này có thể được sử dụng đơn lẻ, và đồng thời hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng dưới dạng hỗn hợp. Dung dịch nước của axit được sử dụng làm tác nhân khử trong phản ứng này cũng có thể được sử dụng làm dung môi trơ cho phản ứng.

Các ví dụ về tác nhân khử mà có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm axit-kim loại và muối-kim loại. Các ví dụ về kim loại bao gồm sắt, thiếc và kẽm, các ví dụ về axit bao gồm các axit vô cơ như là axit clohydric và axit sulfuric và các axit hữu cơ như là axit axetic, và các ví dụ về muối bao gồm thiếc clorua và amoni clorua. Ngoài ra, kim loại có thể là dạng kết hợp của hai hoặc nhiều trong số các ví dụ này, và áp dụng tương tự cho axit và muối. Như đối với lượng tác nhân khử được sử dụng, lượng kim loại được chọn thích hợp từ phạm vi từ khoảng 1 đến 10 lần lượng mol tương ứng với hợp chất nitro được biểu diễn bằng công thức chung (3-1), và lượng axit hoặc muối được chọn thích hợp từ phạm vi từ khoảng 0,05 đến 10 lần lượng mol tương ứng với hợp chất nitro được biểu diễn bằng công thức chung (3-1). Nhiệt độ phản ứng có thể được chọn từ phạm vi từ khoảng 0 đến 150°C. Thời gian phản ứng thay đổi với quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và yếu tố tương tự, nhưng về cơ bản được chọn như trong phạm vi thích hợp từ vài phút đến khoảng 48 giờ. Quá trình khử trong bước này cũng có thể được thực hiện bằng quá trình 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 kết thúc, hợp chất mong muốn (2-4) được phân tách từ hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Nếu cần, quá trình kết tinh lại, chưng cất, sắc ký cột, v.v. có thể được thực hiện để tinh chế hợp chất mong muốn (2-4). Hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (2-4) được điều chế theo sơ đồ điều chế được mô tả ở trên được đưa vào các phản ứng trong phương pháp điều chế 1 để cho ra hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1). Hợp chất trung gian được sử dụng để điều chế hợp chất được biểu diễn bằng công thức chung (1) 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 của sáng chế được thể hiện dưới đây. Trong các bảng được nêu dưới đây, Me đại diện cho nhóm methyl, Et đại diện cho nhóm ethyl, c-Pr đại diện cho nhóm xyclopropyl, Bn đại diện cho nhóm benzyl, Ph đại diện cho nhóm phenyl, Pyrazol đại diện cho nhóm pyrazol, và 1,2,4-Triazol đại diện cho nhóm 1,2,4-triazol. Được thể hiện trong cột “Đặc tính vật lý” là điểm nóng chảy (°C) hoặc “NMR”. Dữ liệu NMR được thể hiện trong các bảng 17 và 18,

Công thức hóa học 5



Bảng 1

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	Đặc tính vật lý
1-1	Cl	Me	CF ₃	I	275-276
1-2	Cl	Et	CF ₃	I	
1-3	H	Me	CF ₃	I	297-299
1-4	H	Et	CF ₃	I	282-283
1-5	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	289-290
1-6	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	
1-7	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	NMR
1-8	Cl	Me	CF ₃	OEt	290-291
1-9	Cl	Et	CF ₃	OEt	245-246
1-10	Cl	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
1-11	Cl	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	154-156
1-12	H	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	268-269
1-13	Cl	Me	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	268-269
1-14	Cl	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	186-187
1-15	F	Me	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	273-274
1-16	F	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	256-257
1-17	Cl	CH ₂ CN	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	NMR
1-18	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	NMR

1-19	Cl	n-Bu	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	NMR
1-20	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	NMR
1-21	Cl	Me	CF ₃	4-F-Ph	293-294
1-22	Cl	Et	CF ₃	4-F-Ph	248-249
1-23	F	Me	CF ₃	4-F-Ph	282-283
1-24	F	Et	CF ₃	4-F-Ph	223-224
1-25	Br	Et	CF ₃	4-F-Ph	230-231

R⁴ và R⁶ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nitơ.

Bảng 2

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
1-26	H	Et	CF ₃	4-F-Ph	H	246-247
1-27	Me	Me	CF ₃	4-F-Ph	H	281-282
1-28	Me	Et	CF ₃	4-F-Ph	H	256-257
1-29	Cl	n-Pr	CF ₃	4-F-Ph	H	172-173
1-30	H	n-Pr	CF ₃	4-F-Ph	H	214-215
1-31	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	4-F-Ph	H	119-120
1-32	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃	4-F-Ph	H	103-104
1-33	Cl	Et	CF ₃	3-CN-Ph	H	232-233
1-34	Cl	Et	CF ₃	4-CF ₃ -BnO	H	196-197
1-35	Cl	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	246-247
1-36	H	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	H	242-244
1-37	Cl	Me	CF ₃	H	1,2,4-Triazol-1-yl	270-271
1-38	Cl	Et	CF ₃	H	1,2,4-Triazol-1-yl	262-263
1-39	Cl	Me	CF ₃	H	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	
1-40	Cl	Et	CF ₃	H	3-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	
1-41	Cl	Me	CF ₃	H	Pyrazol-1-yl	
1-42	Cl	Et	CF ₃	H	Pyrazol-1-yl	
1-43	Cl	Me	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph	H	237-238
1-44	Cl	Et	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph	H	
1-45	Cl	Me	CF ₃	3-F-4-Cl-Ph	H	295-297

1-46	Cl	Et	CF ₃	3-F-4-Cl-Ph	H	264-265
1-47	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	H	298-300
1-48	Cl	Et	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	H	266-267
1-49	Cl	Me	CF ₃	3,4-F ₂ -Ph	H	299-300
1-50	Cl	Et	CF ₃	3,4-F ₂ -Ph	H	

R⁴ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nitơ.

Bảng 3

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	X	Đặc tính vật lý
1-51	Cl	Me	CF ₃	3,4,5-F ₃ -Ph	N	287-288
1-52	Cl	Et	CF ₃	3,4,5-F ₃ -Ph	N	
1-53	Cl	Me	CF ₃	3,5-F ₂ -Ph	N	
1-54	Cl	Et	CF ₃	3,5-F ₂ -Ph	N	
1-55	Cl	Me	CF ₃	3-Me-4-F-Ph	N	291-293
1-56	Cl	Et	CF ₃	3-Me-4-F-Ph	N	
1-57	Cl	Me	CF ₃	2-F-5-CF ₃ -Ph	N	290-292
1-58	Cl	Et	CF ₃	2-F-5-CF ₃ -Ph	N	276-277
1-59	Cl	Me	CF ₃	4-CN-Ph	N	
1-60	Cl	Et	CF ₃	4-CN-Ph	N	
1-61	Cl	Me	CF ₃	Pyrazol-1-yl	N	
1-62	Cl	Et	CF ₃	Pyrazol-1-yl	N	
1-63	Cl	Me	CF ₃	3-Br-Pyrazol-1-yl	N	
1-64	Cl	Et	CF ₃	3-Br-Pyrazol-1-yl	N	
1-65	Cl	Me	CF ₃	4-Cl-Pyrazol-1-yl	N	
1-66	Cl	Et	CF ₃	4-Cl-Pyrazol-1-yl	N	
1-67	Cl	Me	CF ₃	4-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	N	
1-68	Cl	Et	CF ₃	4-CF ₃ -Pyrazol-1-yl	N	
1-69	Cl	Me	CF ₃	H	CH	
1-70	Cl	Me	CF ₃	I	CH	
1-71	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	CH	
1-72	CN	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	238-239
1-73	CN	Et	CF ₃	4-F-Ph	N	253-254
1-74	CN	Et	CF ₃	3-CN-Ph	N	273-274

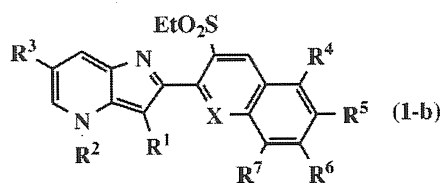
R⁴ và R⁶ là nguyên tử hydro.

Bảng 4

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	Đặc tính vật lý
1-75	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	NMR
1-76	Cl	Me	CF ₃	4-Et-Ph	277-279
1-77	Cl	Et	CF ₃	4-Et-Ph	272-274
1-78	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	235-237
1-79	F	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	230-232
1-80	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	237-238
1-81	F	Allyl	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	224-225
1-82	F	CH ₂ OMe	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	155-156
1-83	F	CH ₂ OEt	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	171-172
1-84	F	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	202-203
1-85	F	CH ₂ OEt	CF ₃	c-Pr	132-134
1-86	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	c-Pr	70-71
1-87	F	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	c-Pr	139-140
1-88	F	CH ₂ C≡CH	CF ₃	c-Pr	52-53
1-89	F	Allyl	CF ₃	c-Pr	182-183
1-90	F	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	c-Pr	187-188
1-91	F	CH ₂ OMe	CF ₃	c-Pr	174-175
1-92	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	c-Pr	207-208
1-93	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	c-Pr	198-199
1-94	F	Me	CF ₃	c-Pr	278-279
1-95	F	Et	CF ₃	c-Pr	252-253

R⁴ và R⁶ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nitơ.

Công thức hóa học 6



Bảng 5

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
2-1	Cl	Me	CF ₃	H	H	
2-2	Cl	Me	CF ₃	Cl	H	
2-3	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	
2-4	Cl	Me	CF ₃	Br	H	

2-5	Cl	Me	CF ₃	H	Br	NMR
2-6	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	H	
2-7	Cl	Me	CF ₃	H	CF ₃	
2-8	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	H	
2-9	Cl	Me	CF ₃	H	c-Pr	
2-10	Cl	Me	CF ₃	CN	H	
2-11	Cl	Me	CF ₃	H	CN	
2-12	Cl	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	
2-13	Cl	Me	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-14	Cl	Me	CF ₃	NHCOMe	H	
2-15	Cl	Me	CF ₃	H	NHCOMe	
2-16	Cl	Me	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-17	Cl	Me	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	
2-18	Cl	Me	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-19	Cl	Me	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-20	Cl	Me	CF ₃	CHO	H	
2-21	Cl	Me	CF ₃	H	CHO	
2-22	Cl	Me	CF ₃	NH ₂	H	
2-23	Cl	Me	CF ₃	H	NH ₂	
2-24	F	Me	CF ₃	H	H	
2-25	F	Me	CF ₃	Cl	H	
2-26	F	Me	CF ₃	H	Cl	

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nitơ.

Bảng 6

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
2-27	F	Me	CF ₃	Br	H	
2-28	F	Me	CF ₃	H	Br	
2-29	F	Me	CF ₃	CF ₃	H	
2-30	F	Me	CF ₃	H	CF ₃	
2-31	F	Me	CF ₃	c-Pr	H	
2-32	F	Me	CF ₃	H	c-Pr	
2-33	F	Me	CF ₃	CN	H	
2-34	F	Me	CF ₃	H	CN	

2-35	F	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	
2-36	F	Me	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-37	F	Me	CF ₃	NHCOMe	H	
2-38	F	Me	CF ₃	H	NHCOMe	
2-39	F	Me	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-40	F	Me	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	
2-41	F	Me	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-42	F	Me	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-43	F	Me	CF ₃	CHO	H	
2-44	F	Me	CF ₃	H	CHO	
2-45	F	Me	CF ₃	NH ₂	H	
2-46	F	Me	CF ₃	H	NH ₂	
2-47	Cl	Et	CF ₃	H	H	
2-48	Cl	Et	CF ₃	H	H	
2-49	Cl	Et	CF ₃	Cl	H	
2-50	Cl	Et	CF ₃	H	Cl	
2-51	Cl	Et	CF ₃	Br	H	
2-52	Cl	Et	CF ₃	H	Br	NMR

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nitơ.

Bảng 7

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
2-53	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	
2-54	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	297-298
2-55	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	H	
2-56	Cl	Et	CF ₃	H	c-Pr	
2-57	Cl	Et	CF ₃	CN	H	
2-58	Cl	Et	CF ₃	H	CN	
2-59	Cl	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	
2-60	Cl	Et	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-61	Cl	Et	CF ₃	NHCOMe	H	
2-62	Cl	Et	CF ₃	H	NHCOMe	
2-63	Cl	Et	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-64	Cl	Et	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	

2-65	Cl	Et	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-66	Cl	Et	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-67	Cl	Et	CF ₃	CHO	H	
2-68	Cl	Et	CF ₃	H	CHO	
2-69	Cl	Et	CF ₃	NH ₂	H	
2-70	Cl	Et	CF ₃	H	NH ₂	
2-71	F	Et	CF ₃	H	H	
2-72	F	Et	CF ₃	H	H	
2-73	F	Et	CF ₃	Cl	H	
2-74	F	Et	CF ₃	H	Cl	
2-75	F	Et	CF ₃	Br	H	
2-76	F	Et	CF ₃	H	Br	NMR
2-77	F	Et	CF ₃	CF ₃	H	
2-78	F	Et	CF ₃	H	CF ₃	286-287

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro, và X là nguyên tử nito.

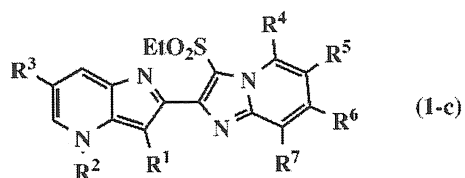
Bảng 8

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	X	Đặc tính vật lý
2-79	F	Et	CF ₃	c-Pr	H	N	
2-80	F	Et	CF ₃	H	c-Pr	N	
2-81	F	Et	CF ₃	CN	H	N	
2-82	F	Et	CF ₃	H	CN	N	
2-83	F	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	N	
2-84	F	Et	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	N	
2-85	F	Et	CF ₃	NHCOMe	H	N	
2-86	F	Et	CF ₃	H	NHCOMe	N	
2-87	F	Et	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	N	
2-88	F	Et	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	N	240-241
2-89	F	Et	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	N	
2-90	F	Et	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-91	F	Et	CF ₃	CHO	H	N	
2-92	F	Et	CF ₃	H	CHO	N	
2-93	F	Et	CF ₃	NH ₂	H	N	
2-94	F	Et	CF ₃	H	NH ₂	N	
2-95	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	N	

2-96	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	N	
2-97	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	N	
2-98	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	N	
2-99	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	N	
2-100	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	N	NMR
2-101	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	N	
2-102	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	N	
2-103	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	N	
2-104	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	N	
2-105	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	N	
2-106	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	N	
2-107	Cl	Me	CF ₃	H	H	CH	
2-108	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	H	Br	N	119-120
2-109	Cl	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	H	Br	N	150-151

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro.

Công thức hóa học 7



Bảng 9

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
3-1	Cl	Me	CF ₃	Cl	H	
3-2	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	
3-3	Cl	Me	CF ₃	Br	H	
3-4	Cl	Me	CF ₃	H	Br	
3-5	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	H	NMR
3-6	Cl	Me	CF ₃	H	CF ₃	NMR
3-7	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	H	
3-8	Cl	Me	CF ₃	H	c-Pr	
3-9	F	Me	CF ₃	Cl	H	
3-10	F	Me	CF ₃	H	Cl	
3-11	F	Me	CF ₃	Br	H	
3-12	F	Me	CF ₃	H	Br	
3-13	F	Me	CF ₃	CF ₃	H	

3-14	F	Me	CF ₃	H	CF ₃	NMR
3-15	F	Me	CF ₃	c-Pr	H	
3-16	F	Me	CF ₃	H	c-Pr	
3-17	Cl	Et	CF ₃	Cl	H	
3-18	Cl	Et	CF ₃	H	Cl	NMR
3-19	Cl	Et	CF ₃	Br	H	NMR
3-20	Cl	Et	CF ₃	H	Br	
3-21	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	NMR
3-22	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	254-256
3-23	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	H	NMR
3-24	Cl	Et	CF ₃	H	c-Pr	
3-25	F	Et	CF ₃	Cl	H	

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro.

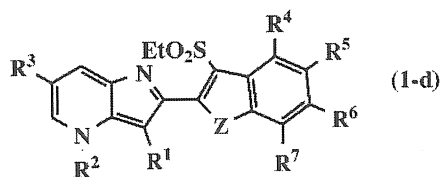
Bảng 10

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Đặc tính vật lý
3-26	F	Et	CF ₃	H	Cl	
3-27	F	Et	CF ₃	Br	H	
3-28	F	Et	CF ₃	H	Br	
3-29	F	Et	CF ₃	CF ₃	H	NMR
3-30	F	Et	CF ₃	H	CF ₃	NMR
3-31	F	Et	CF ₃	c-Pr	H	
3-32	F	Et	CF ₃	H	c-Pr	
3-33	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	
3-34	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	
3-35	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	
3-36	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	NMR
3-37	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	
3-38	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	
3-39	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	
3-40	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	
3-41	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	
3-42	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	
3-43	H	Me	CF ₃	H	Br	NMR
3-44	Cl	n-Pr	CF ₃	H	CF ₃	212-214
3-45	H	Et	CF ₃	H	CF ₃	NMR

3-46	Br	Et	CF ₃	H	CF ₃	230-232
------	----	----	-----------------	---	-----------------	---------

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro.

Công thức hóa học 8

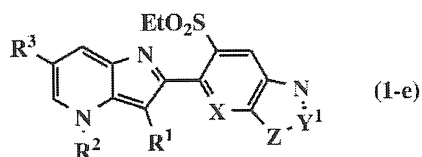


Bảng 11

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Z	Đặc tính vật lý
4-1	Cl	Et	CF ₃	H	H	S	
4-2	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	S	
4-3	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	S	
4-4	Cl	Et	CF ₃	H	H	O	
4-5	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	O	
4-6	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	O	
4-7	Cl	Et	CF ₃	H	H	NMe	
4-8	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	NMe	
4-9	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	NMe	

R⁴ và R⁷ là nguyên tử hydro.

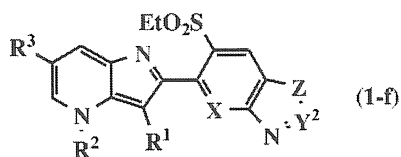
Công thức hóa học 9



Bảng 12

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	X	Y ¹	Z	Đặc tính vật lý
5-1	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	O	
5-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	S	
5-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	NMe	
5-4	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	O	
5-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	S	
5-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	NMe	

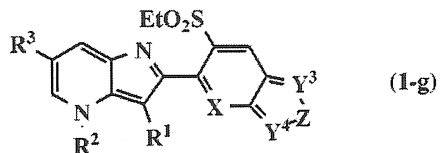
Công thức hóa học 10



Bảng 13

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	X	Y ²	Z	Đặc tính vật lý
6-1	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	O	
6-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	S	
6-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	NMe	
6-4	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	O	
6-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	S	
6-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	NMe	

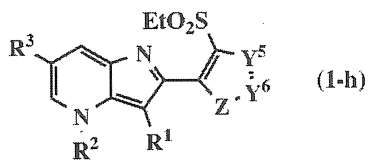
Công thức hóa học 11



Bảng 14

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	X	Y ³	Y ⁴	Z	Đặc tính vật lý
7-1	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NMe	
7-2	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	N-i-Pr	
7-3	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NCH ₂ CF ₃	
7-4	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NCHF ₂	
7-5	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	O	
7-6	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NMe	
7-7	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	N-i-Pr	
7-8	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NCH ₂ CF ₃	
7-9	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NCHF ₂	
7-10	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	O	

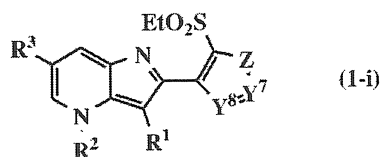
Công thức hóa học 12



Bảng 15

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	Y ⁵	Y ⁶	Z	Đặc tính vật lý
8-1	Cl	Et	CF ₃	CH	CBr	S	
8-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(3-CF ₃ -Ph)	S	
8-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(4-F-Ph)	S	
8-4	Cl	Et	CF ₃	CH	CBr	O	
8-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(3-CF ₃ -Ph)	O	
8-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(4-F-Ph)	O	
8-7	Cl	Et	CF ₃	N	CBr	NMe	
8-8	Cl	Et	CF ₃	N	C-(3-CF ₃ -Ph)	NMe	
8-9	Cl	Et	CF ₃	N	C-(4-F-Ph)	NMe	
8-10	Cl	Et	CF ₃	N	CBr	S	
8-11	Cl	Et	CF ₃	N	C-(3-CF ₃ -Ph)	S	
8-12	Cl	Et	CF ₃	N	C-(4-F-Ph)	S	

Công thức hóa học 13



Bảng 16

Hợp chất số.	R ¹	R ²	R ³	Y ⁷	Y ⁸	Z	Đặc tính vật lý
9-1	Cl	Et	CF ₃	CBr	CH	S	
9-2	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	CH	S	
9-3	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	CH	S	
9-4	Cl	Et	CF ₃	CBr	CH	O	
9-5	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	CH	O	
9-6	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	CH	O	
9-7	Cl	Et	CF ₃	CBr	N	NMe	
9-8	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	N	NMe	
9-9	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	N	NMe	

9-10	Cl	Et	CF ₃	CBr	N	S	
9-11	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	N	S	
9-12	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	N	S	

Bảng 17

Hợp chất số.	Dữ liệu ¹ H-NMR (CDCl ₃)
1-7	9,20(d, 1H), 8,76(d, 1H), 8,36(d, 1H), 8,34(s, 1H), 8,01(d, 1H), 5,51(q, 2H), 4,63(q, 2H), 4,36(q, 2H), 1,35(t, 3H)
1-17	9,21(d, 1H), 8,69(d, 1H), 8,33(d, 1H), 8,12(d, 1H), 7,97(d, 1H), 7,92(dd, 1H), 7,79(dd, 1H), 7,71(dd, 1H), 3,92(q, 2H), 1,39(t, 3H)
1-18	9,20(d, 1H), 8,69(d, 1H), 8,46(d, 1H), 8,32(d, 1H), 7,97(d, 1H), 7,93(dd, 1H), 7,78(dd, 1H), 7,72(dd, 1H), 5,81(d, 2H), 3,94(q, 2H), 2,91(t, 1H), 1,38(t, 3H)
1-19	9,19(d, 1H), 8,69(d, 1H), 8,30(d, 1H), 8,01(d, 1H), 7,97(d, 1H), 7,93(dd, 1H), 7,78(dd, 1H), 7,71(dd, 1H), 4,85(t, 2H), 3,94(q, 2H), 1,88(m, 2H), 1,51(m, 2H), 1,38(t, 3H), 1,02(t, 3H)
1-20	9,21(d, 1H), 8,68(d, 1H), 8,34(d, 1H), 7,99(d, 1H), 7,96(d, 1H), 7,91(dd, 1H), 7,78(dd, 1H), 7,71(dd, 1H), 5,52(q, 2H), 3,89(q, 2H), 1,35(t, 3H)
2-5	9,02(s, 1H), 8,47(s, 1H), 8,30(s, 1H), 7,95(s, 1H), 7,94(s, 1H), 7,84(dd, 1H), 4,61(s, 3H), 3,92(q, 2H), 1,35(t, 3H)
2-52	9,02(s, 1H), 8,48(s, 1H), 8,30(s, 1H), 8,00(s, 1H), 7,94(d, 1H), 7,85(dd, 1H), 4,94(q, 2H), 3,90(q, 2H), 1,77(t, 3H), 1,35(t, 3H)
2-76	9,04(s, 1H), 8,47(s, 1H), 8,28(s, 1H), 7,99(s, 1H), 7,93(d, 1H), 7,84(dd, 1H), 4,70(q, 2H), 4,10(q, 2H), 1,79(t, 3H), 1,40(t, 3H)
2-100	9,04(s, 1H), 8,47(s, 1H), 8,31(s, 1H), 7,96(s, 1H), 7,94(d, 1H), 7,85(dd, 1H), 5,15(q, 2H), 4,28(q, 2H), 1,40(t, 3H)

Bảng 18

Hợp chất số.	Dữ liệu ¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-5	9,61(s, 1H), 8,35(s, 1H), 7,95(d, 1H), 7,92(s, 1H), 7,64(d, 1H), 4,63(s, 3H), 4,05(q, 2H), 1,43(t, 3H)

3-6	9,36(d, 1H), 8,34(s, 1H), 8,15(s, 1H), 7,92(s, 1H), 7,23(d, 1H), 4,62(s, 3H), 4,05(q, 2H), 1,42(t, 3H)
3-14	9,43(d, 1H), 8,33(s, 1H), 8,13(s, 1H), 7,92(s, 1H), 7,22(d, 1H), 4,44(s, 3H), 4,22(q, 2H), 1,43(t, 3H)
3-18	9,15(d, 1H), 8,32(s, 1H), 7,96(s, 1H), 7,84(s, 1H), 7,06(d, 1H), 4,94(q, 2H), 4,01(q, 2H), 1,75(t, 3H), 1,40(t, 3H)
3-19	9,37(s, 1H), 8,31(s, 1H), 7,96(s, 1H), 7,74(d, 1H), 7,56(d, 1H), 4,93(q, 2H), 4,01(q, 2H), 1,75(t, 3H), 1,43(t, 3H)
3-21	9,61(s, 1H), 8,34(s, 1H), 7,98(d, 1H), 7,96(s, 1H), 7,64(d, 1H), 4,95(q, 2H), 4,07(q, 2H), 1,76(t, 3H), 1,44(t, 3H)
3-23	8,98(s, 1H), 8,29(s, 1H), 7,94(s, 1H), 7,73(d, 1H), 7,18(d, 1H), 4,92(q, 2H), 3,92(q, 2H), 2,01(m, 1H), 1,74(t, 3H), 1,413(t, 3H), 1,07(m, 2H), 0,78(m, 2H)
3-29	9,71(s, 1H), 8,33(s, 1H), 7,97(s, 1H), 7,95(d, 1H), 7,63(d, 1H), 4,70(q, 2H), 4,26(q, 2H), 1,76(t, 3H), 1,45(t, 3H)
3-30	9,45(d, 1H), 8,33(s, 1H), 8,14(s, 1H), 7,97(s, 1H), 7,22(d, 1H), 4,70(q, 2H), 4,25(q, 2H), 1,76(t, 3H), 1,43(t, 3H)
3-36	9,36(d, 1H), 8,33(s, 1H), 8,14(s, 1H), 7,97(s, 1H), 7,22(d, 1H), 4,70(q, 2H), 4,25(q, 2H), 1,76(t, 3H), 1,43(t, 3H)
3-43	9,23(d, 1H), 8,39(s, 1H), 7,967(s, 1H), 7,96(s, 1H), 7,29(s, 1H), 7,12(d, 1H), 4,27(s, 3H), 4,16(q, 2H), 1,35(t, 3H)
3-45	9,52(d, 1H), 8,39(s, 1H), 8,07(s, 1H), 8,01(s, 1H), 7,52(s, 1H), 7,19(d, 1H), 4,59(q, 2H), 4,27(q, 2H), 1,74(t, 3H), 1,38(t, 3H)

Thuốc trừ sâu trong nông nghiệp và trồng trọt chứa hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của nó làm thành phần hoạt tính thích hợp cho việc kiểm soát nhiều loài gây hại khác nhau mà có thể gây hại cho lúa nước, cây ăn quả, rau, các loài cây trồng và các loài cây hoa cảnh khác. Các loài gây hại đích, ví dụ, các loài gây hại trong nông nghiệp và trong rừng, các loài gây hại trong nông nghiệp, các loài gây hại lương thực trữ kho, các loài gây hại sống trong nhà vệ sinh,

các loài giun tròn, v.v.

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

các loài thuộc bộ Cánh vẩy như là *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 gômns*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*,

Grapholita molesta, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, các loài thuộc họ bướm đêm Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*,
Lymantria dispar, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiotes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, loài *Bambalina*, *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, loài *Synanthedon*, *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, các loài thuộc họ bướm Pieridae như là *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 orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* và *Earias cupreoviridis*;
các loài thuộc bộ Cánh nửa như là *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptopsaltria nigrofusca*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariotes 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, nhiều loài thuộc giống *Lygus*, *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Brúchanitis 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*, *Geoica lucifuga*, *Numata muiri*, *Comstockaspis perniciosus*, *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 oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Brúchanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis 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 striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovina punctata*, nhiều loài thuộc giống *Empoasca*, *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*,

Aphrophora costalis, *Lygus 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*, *Orientus ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* và *Aphis gossypii*;

các loài thuộc bộ Cánh cứng như là *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera*, *Invulvulus 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*, nhiều loài thuộc giống *Diabrotica*, *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*,

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

các loài thuộc bộ Hai cánh như là *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Clops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, các loài thuộc họ Ruồi lưng gù như là *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, loài *Asphondylia*, *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 là *Pristomyrmex pungens*, các loài thuộc họ ong bắp cày Betylidae, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, các loài thuộc phân họ ong Vespinae, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, nhiều loài thuộc giống *Acromyrmex*, nhiều loài thuộc giống *Solenopsis*, *Arge mali* và *Ochetellus glaber*;

các loài thuộc bộ Cánh thẳng như là *Homorocoryphus lineosus*, loài *Gryllotalpa*, *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* và *Teleogryllus emma*;

các loài thuộc bộ Cánh viền như là *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 thuộc bộ Ve bét như là *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, các loài thuộc họ Ve ký sinh như là *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanensis*, *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 loài *Sancassania*;

các loài thuộc bộ Mối như là *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, loài *Reticulitermes*, *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 thuộc bộ Gián như là *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* và *Periplaneta americana*;

các loài thuộc bộ Bọ chét như là *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* và *Ceratophyllus gallinae*;

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

các loài thuộc ngành Động vật thân mềm như là *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* và *Acusta despecta sieboldiana*.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế cũng có hiệu quả trừ sâu mạnh lên *Tuta absoluta*.

Ngoài ra, các loài ve và bét sống ký sinh trên động vật cũng được tính

là các loài gây hại đích, và các ví dụ bao gồm các loài thuộc họ Ve ký sinh như là *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 là *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bursa*; các loài thuộc họ Ve mò như là *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* và *Helenicula miyagawai*; các loài thuộc họ ve Cheyletidae như là *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* và *Cheyletiella blakei*; các loài thuộc liên họ ve Sarcoptoidea như là *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* và *Notoedres cati*; và các loài thuộc họ ve Demodicidae như là *Demodex canis*.

Các loài gây hại đích khác bao gồm các loài bộ chết tính cả các loài côn trùng không cánh ngoại ký sinh thuộc bộ Bộ chết, cụ thể hơn, các loài thuộc các họ bộ chết Pulicidae và bộ chết Ceratophyllidae. Các ví dụ về các loài thuộc họ bộ chết Pulicidae bao gồm *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* và *Monopsyllus anisus*.

Các loài gây hại đích khác bao gồm các loài ký sinh ngoài, ví dụ, các loài thuộc phân bộ Chấy như là *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* và *Pediculus capitis*; các loài thuộc phân bộ rận Mallophaga như là *Trichodectes canis*; và các côn trùng gây hại hút máu thuộc bộ Hai cánh như là *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* và *Simulium ornatum*. Ngoài ra, các ví dụ về các loài nội ký sinh bao gồm các loài giun tròn như là giun phổi, giun tóc, giun sần, các loài giun sống ký sinh trong dạ dày, giun đũa và giun

chỉ; các loài sán dây như là *Spirometra erinacei*, *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* và *Echinococcus multilocularis*; các loài sán lá như là *Schistosoma japonicum* và *Fasciola hepatica*; và động vật nguyên sinh như là cầu trùng, *Plasmodium*, các loài ký sinh trong ruột *Sarcocystis*, *Toxoplasma* và *Cryptosporidium*.

Thuốc trừ sâu trong nông nghiệp và trồng trọt chứa hợp chất 4H-pyrollopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của nó làm thành phần hoạt tính có hiệu quả kiểm soát xuất sắc lên các loài gây hại được mô tả ở trên mà gây hại cho cây trồng đất trồng, cây trồng đồng ruộng, cây ăn quả, rau, các loại cây trồng khác, các loại cây hoa cảnh, v.v. Có thể thu được hiệu quả mong muốn khi thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được dùng cho các vườn ươm cây giống, đồng lúa nước, ruộng, cây ăn quả, rau, các loại cây trồng khác, các loại cây hoa cảnh, v.v. và hạt giống của chúng, nước tưới tiêu, tán lá, môi trường canh tác như đất, hoặc tương tự trong khoảng thời gian dự tính nhiễm ký sinh loài gây hại, chẳng hạn, trước khi nhiễm ký sinh hoặc sau khi xác nhận là đã nhiễm ký sinh. Trong các phương án ưu tiên cụ thể, việc áp dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt sử dụng cách được gọi quá trình thâm nhập và dịch chuyển. Nghĩa là, đất ươm, đất trong hồ trồng, gốc cây, nước tưới, nước canh tác trong kỹ thuật trồng cây dưới nước, hoặc thành phần tương tự được xử lý với thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt để cho phép các loại cây trồng, các loại cây hoa cảnh, v.v. hấp thụ hợp chất theo sáng chế qua rễ từ đất hoặc theo một cách nào đó.

Ví dụ về các cây có lợi mà thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể được áp dụng bao gồm, nhưng không bị giới hạn cụ thể, các loại ngũ cốc (ví dụ, lúa, lúa mạch, lúa mỳ, lúa mạch đen, yến mạch, ngô, v.v.), các cây họ 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, cam quýt, lê, nho, đào, mận, anh đào, quả óc chó, hạt dẻ, hạnh nhân, chuối, v.v.), lá và rau xanh (ví dụ, cải bắp, cà chua, rau chân vịt, súp lơ xanh, rau diếp, hành

tây, hành (hệ và hành xứ Wales), ớt xanh, cà tím, dâu tây, hồ tiêu, đậu bắp, hệ Trung Quốc, v.v.), rau củ (ví dụ, cà rốt, khoai tây, khoai lang, khoai sọ, củ cải Nhật, củ cải, rễ sen, rễ cây ngưu bàng, tỏi, hành Trung Quốc, v.v.), cây công nghiệp (ví dụ, bông, cây gai dầu, củ cải, hoa bia, mía, củ cải đường, ô liu, cao su, cà phê, thuốc lá, trà, v.v.), các loại bầu (ví dụ, bí ngô Nhật Bản, dưa chuột, dưa hấu, dưa ngọt phương Đông, dưa gang, v.v.), cỏ chăn nuôi (ví dụ, cỏ vườn, cao lương, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng, v.v.), cỏ bãi (ví dụ, cỏ bãi, cỏ cong, v.v.), các cây gia vị và rau thơm và cây cảnh trang trí (ví dụ, hoa oải hương, hương thảo, húng tây, rau mùi tây, tiêu, gừng, v.v.), các loại cây hoa cảnh (ví dụ, hoa cúc, hoa hồng, cẩm chướng, phong lan, hoa tulip, lily, v.v.), các loài cây trong vườn (ví dụ, cây bạch quả, cây anh đào, ô rô bà Nhật Bản, v.v.) và các loài cây trong rừng (ví dụ, *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, thông, tuyết tùng vàng, tuyết tùng Nhật Bản, bách hinoki, bạch đàn, v.v.).

“Các loài thực vật” được đề cập ở trên cũng bao gồm các loài cây trồng có khả năng chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật gây giống truyền thống hoặc kỹ thuật tái tổ hợp gen. Ví dụ về khả năng chịu thuốc diệt cỏ bao gồm khả năng chịu các chất ức chế HPPD, như isoxaflutol; các chất ức chế ALS, như imazetapyr 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 cacboxylaza, như setoxydim; hoặc thuốc diệt cỏ khác, như bromxynil, dicamba và 2,4-D.

Ví dụ về các loài thực vật có khả năng chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật gây giống truyền thống bao gồm các loài hạt cải dầu, lúa mì, hoa hướng dương và lúa chịu được các thuốc diệt cỏ ức chế-ALS họ imidazolinon như imazetapyr, và như các loài thực vật được bán dưới tên thương mại là Clearfield (nhãn hiệu đã được đăng ký) Cũng bao gồm các loài đậu nành có khả năng chịu các thuốc diệt cỏ ức chế-ALS họ sulfonyl urê như thifensulfuron-metyl bằng kỹ thuật gây giống truyền thống, và được bán dưới tên thương mại là đậu nành STS. Cũng bao gồm các loài thực vật có khả năng

chịu các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza như thuốc diệt cỏ trion oxim và thuốc diệt cỏ axit aryloxy phenoxy propionic bằng kỹ thuật gây giống truyền thống, ví dụ, ngô SR và các loài tương tự.

Các loài thực vật có khả năng chịu các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza được mô tả trong tài liệu Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), và like. Ngoài ra, các chất gây đột biến axetyl-CoA cacboxylaza kháng với các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza được báo cáo trong tài liệu Weed Science, 53, 728-746 (2005), và các tài liệu tương tự khác, và bằng cách đưa gen của chất gây đột biến axetyl-CoA cacboxylaza vào các loài thực vật bằng kỹ thuật tái tổ hợp gen, hoặc đưa một đột biến kháng thuốc vào trong axetyl-CoA cacboxylaza của thực vật, có thể tạo ra các loài thực vật chịu được các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza. Ngoài ra, bằng cách đưa axit nucleic gây ra đột biến thay thế cặp bazơ vào trong các tế bào thực vật (ví dụ điển hình kỹ thuật này là kỹ thuật gắn kết khảm (Gura T. 1999, Repairing Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318,)) cho phép đột biến thay thế tại vị trí đặc hiệu trong các amino axit được mã hóa bằng gen axetyl-CoA cacboxylaza, gen ALS hoặc các gen tương tự của thực vật, các loài thực vật chịu được các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza, các 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 dùng cho các loài thực vật này.

Ngoài ra, ví dụ về các chất độc tiêu biểu có trong thực vật biến đổi gen bao gồm các protein trừ sâu của *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; *Bacillus thuringiensis* δ -endotoxins, như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 và Cry9C, và các protein trừ sâu khác, như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A; các protein diệt giun tròn; các chất độc có nguồn gốc từ động vật, như chất độc bọ cạp, chất độc nhện, chất độc ong và chất độc thần kinh đặc hiệu với côn trùng; các chất độc của nấm sợi; các lectin thực vật; agglutinin; các chất ức chế proteaza, như các chất ức chế trypsin, các chất ức chế serin proteaza, các chất ức chế patatin, xystatin và papain; các protein bất hoạt ribosome (ribosome inactivating protein-RIP), như rixin, RIP

ở ngô, abrin, luffin, saporin và bryodin; enzym chuyển hóa steroid, như 3-hydroxy steroid oxidaza, ecdysteroid-UDP-glucosyltransferaza và cholesteol oxidaza; các chất ức chế ecdyson; HMG-CoA reductaza; các chất ức chế kênh ion, như các chất ức chế kênh natri và các chất ức chế kênh canxi; esteraza hormon nguyên sinh; các thụ thể hormon lợi tiểu; stilben synthaza; bibenzyl synthaza; chitinaza; và glucanaza.

Cũng bao gồm các chất độc lai, chất độc khuyết một phần và chất độc biến đổi có nguồn gốc từ các chất sau: các 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. Chất độc lai có thể được điều chế bằng cách kết hợp một số vùng của các protein khác nhau từ tổ hợp gốc trong tự nhiên bằng cách sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp. Chất độc khuyết một phần, chất độc Cry1Ab trong đó một phần trình tự amino axit bị xóa là đã biết. Trong chất độc biến đổi, một hoặc nhiều amino axit của chất độc xuất hiện trong tự nhiên được thế.

Ví dụ về các chất độc và thực vật biến đổi gen nêu trên có khả năng tổng hợp các chất độc 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 có các chất độc chứa trong thực vật biến đổi gen, các loài thực vật này thể hiện sự kháng với các loài gây hại, cụ thể là, các loài côn trùng gây hại thuộc Bộ cánh cứng, các loài côn trùng gây hại thuộc Bộ cánh nửa, các loài côn trùng gây hại thuộc Bộ hai cánh, các loài côn trùng gây hại thuộc bộ Cánh vẩy và các loài giun tròn. Các công nghệ được mô tả nêu trên và thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể được sử dụng kết hợp hoặc được sử dụng một cách có hệ thống.

Để kiểm soát các loài gây hại đích, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế, được pha loãng hoặc không được pha loãng hoặc tạo huyền phù trong nước v.v., được dùng cho các loài cây trồng có khả năng bị nhiễm côn trùng gây hại đích hoặc các loài giun tròn với lượng

có hiệu quả để kiểm soát côn trùng gây hại hoặc các loài giun tròn. Ví dụ, để kiểm soát các loài côn trùng gây hại và các loài giun tròn có thể gây thiệt hại cho cây trồng như cây ăn quả, các loại ngũ cốc và rau, có thể dùng cho lá và thực hiện xử lý hạt như ngâm, phủ bụi và phủ canxi peroxit. Ngoài ra, cũng có thể tiến hành xử lý đất hoặc các biện pháp tương tự cho thực vật hấp thụ các hóa nông qua rễ của chúng. Ví dụ về cách xử lý bao gồm cày xới lại toàn bộ đất, xử lý hàng cây trồng, cày đất nền, xử lý cây giống, xử lý hố trồng cây, xử lý gốc cây, bón phân trên mặt đất, xử lý hộp ươm giống lúa nước, và ngâm. Ngoài ra, đối với kỹ thuật canh tác cây trồng dưới nước, cũng có thể thực hiện xử lý khới, phun thân cây và các phương pháp tương tự.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế, được pha loãng hoặc không được pha loãng hoặc tạo huyền phù trong nước v.v. có thể được dùng ở các vị trí có khả năng bị nhiễm các loài gây hại với lượng có hiệu quả để kiểm soát các loài gây hại. Ví dụ, nó có thể được dùng trực tiếp lên loài gây hại thóc lúa được lưu kho, các loài gây hại trong nhà, các loài gây hại sống trong nhà vệ sinh, các loài gây hại trong rừng, v.v., và cũng có thể được dùng phủ lên các loại vật liệu xây dựng cho khu dân cư, để xử lý khới, hoặc dưới dạng chế phẩm dạng môi.

Phương pháp mẫu xử lý hạt bao gồm việc ngâm hạt trong chất lỏng pha loãng hoặc không pha loãng của chế phẩm lỏng hoặc rắn để thẩm thấu các hóa nông vào trong hạt; trộn hoặc phủ bụi hạt với chế phẩm lỏng hoặc rắn để gắn chế phẩm lên trên bề mặt hạt; phủ lên hạt với hỗn hợp chế phẩm lỏng hoặc rắn và chất mang bám dính như nhựa và polyme; và áp dụng chế phẩm lỏng hoặc rắn vào vùng lân cận hạt cùng với lúc gieo hạt.

Thuật ngữ “hạt” trong xử lý hạt được đề cập ở trên dùng để chỉ thân cây trong giai đoạn canh tác ban đầu và được sử dụng để nhân giống cây. Ví dụ bao gồm, ngoài dùng để chỉ hạt, thân cây để nhân giống sinh dưỡng, như hành, thân củ, hạt giống khoai tây, hành con, cây non, thân cây hình đĩa và thân cây được sử dụng để giâm.

Thuật ngữ “đất” hoặc “môi trường canh tác” trong phương pháp theo

sáng chế để sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt dùng để chỉ môi trường hỗ trợ canh tác cây trồng, cụ thể là môi trường hỗ trợ mà cho phép các loài cây trồng phân tán rễ của chúng trong đó, và các vật liệu là không bị giới hạn cụ thể miễn là chúng cho phép các loài cây trồng phát triển. Ví dụ về môi trường hỗ trợ bao gồm đất, thảm cây giống và nước, và ví dụ cụ thể về vật liệu bao gồm cát, đá bột, chất khoáng bón cây, diatomit, thạch trắng, các chất nền gelatin, các chất nền cao phân tử, sợi đá, sợi thủy tinh, gỗ vụn và vỏ cây.

Phương pháp mẫu áp dụng cho các loài gây hại cho cây trồng có tán lá hoặc thóc lúa được lưu kho, các loài gây hại trong nhà, các loài gây hại sống trong nhà vệ sinh, các loài gây hại trong rừng, v.v. bao gồm sử dụng chế phẩm lỏng, như chất cô đặc có thể nhũ hóa và có thể chảy được, hoặc chế phẩm rắn, như dạng bột có thể thấm ướt và dạng viên có thể phân tán vào nước, sau đó pha loãng thích hợp vào nước; phủ bụi và tạo khói.

Phương pháp mẫu áp dụng cho đất bao gồm sử dụng chế phẩm lỏng pha loãng hoặc không pha loãng với nước vào gốc cây, vườn ươm cây giống, hoặc các dạng tương tự; sử dụng viên vào gốc cây, vườn ươm cây giống, hoặc các dạng tương tự; sử dụng bụi, bột có thể thấm ướt, viên có thể phân tán vào nước, viên hoặc các dạng tương tự vào đất và sau đó kết hợp chế phẩm vào trong toàn bộ đất trước gieo hạt hoặc cấy; và áp dụng bụi, bột có thể thấm ướt, viên có thể phân tán vào nước, viên hoặc các dạng tương tự vào các hố trồng, các hàng cây hoặc các dạng tương tự trước gieo hạt hoặc trồng.

Ví dụ, với hộp ươm lúa nước, có thể dùng dạng bụi, viên có thể phân tán vào nước, viên hoặc các dạng tương tự, mặc dù chế phẩm thích hợp có thể khác nhau phụ thuộc vào thời điểm sử dụng, nói cách khác, phụ thuộc vào giai đoạn canh tác như thời gian gieo hạt, khoảng thời gian ươm và thời gian trồng. Chế phẩm như bụi, viên có thể phân tán vào nước và viên có thể được trộn với đất ươm. Ví dụ, chế phẩm này được đưa vào trong đất nền, đất phủ hoặc toàn bộ đất. Một cách đơn giản, đất ươm và chế phẩm có thể được phủ xen kẽ theo từng lớp.

Khi áp dụng cho ruộng lúa, chế phẩm rắn, như dạng gói to, dạng gói, dạng viên và viên có thể phân tán vào nước, hoặc chế phẩm lỏng, chất cô đặc có thể nhũ hóa và có thể chảy được, thường được dùng cho lúa nước. Trong giai đoạn trồng lúa, chế phẩm thích hợp, dạng nguyên chất hoặc sau khi trộn với phân bón, có thể phủ lên đất hoặc phun vào trong đất. Ngoài ra, chất cô đặc có thể nhũ hóa, có thể chảy được hoặc các dạng tương tự có thể được pha vào nguồn nước cung cấp cho ruộng lúa, như cống dẫn nước và thiết bị tưới tiêu. Trong trường hợp này, việc xử lý có thể được thực hiện cùng với việc cấp nước và nhờ đó tiết kiệm được sức lao động.

Trong trường hợp các loại hoa màu, hạt của chúng, môi trường canh tác tại lân cận với cây trồng, hoặc khu vực tương tự có thể được xử lý trong giai đoạn gieo hạt đến khi cây giống. Trong trường hợp thực vật mà hạt được gieo trực tiếp ngoài ruộng, ngoài quá trình xử lý hạt trực tiếp, ưu tiên xử lý gốc cây trong khi canh tác. Cụ thể, việc xử lý có thể được thực hiện bằng cách, ví dụ, phủ dạng viên lên đất, hoặc làm ẩm đất với dạng chế phẩm lỏng pha loãng hoặc không pha loãng với nước. Một cách xử lý khác được ưu tiên là kết hợp viên vào môi trường canh tác trước gieo hạt.

Trong trường hợp các loài cây trồng phải cấy, ví dụ ưu tiên về cách xử lý trong giai đoạn gieo hạt đến khi cây giống ngoài quá trình xử lý hạt trực tiếp bao gồm, xử lý ngâm cây giống ươm với chế phẩm ở dạng lỏng; và dùng dạng viên nhỏ cho cây giống ươm. Cũng bao gồm quá trình xử lý các hố trồng với dạng viên nhỏ; và kết hợp dạng viên nhỏ vào trong môi trường canh tác ở lân cận nơi gieo trồng tại thời điểm gieo trồng cố định.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế thường được sử dụng dưới dạng chế phẩm tiện dụng, mà được điều chế theo các phương pháp thông thường dùng để điều chế các chế phẩm hóa nông.

Nghĩa là, hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của nó và chất mang bất hoạt thích hợp, và nếu cần chất bổ trợ, được trộn theo một tỷ lệ thích hợp, và qua các bước hòa tan, phân tách, tạo huyền phù, trộn, ngâm, hấp phụ và/hoặc kết dính, được

điều chế thành dạng thích hợp để sử dụng, như huyền phù đặc, nhũ tương đặc, dạng hòa tan đặc, bột có thể thấm ướt, viên có thể phân tán vào nước, dạng viên, bụi, viên nén và dạng gói.

Chế phẩm (thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt hoặc tác nhân kiểm soát động vật ký sinh) theo sáng chế có thể tùy ý chứa thêm phụ gia thường được sử dụng cho các chế phẩm hóa nông hoặc các tác nhân kiểm soát động vật ký sinh ngoài thành phần hoạt tính. Ví dụ về phụ gia bao gồm các chất mang như các chất mang có dạng lỏng hoặc rắn, các chất hoạt động bề mặt, các chất phân tán, các tác nhân làm ướt, các chất liên kết, chất kết dính, các chất làm dày, chất tạo màu, chất phân tán, các tác nhân gây bám dính/phân rải, các tác nhân chống đông, các tác nhân chống kết khối, các tác nhân phân rã và ổn định. Nếu cần, các chất bảo quản, vụn thực vật, v.v. cũng có thể được sử dụng làm phụ gia. Các phụ gia này có thể được dùng riêng rẽ, và cũng dùng kết hợp hai hoặc nhiều loại với nhau.

Ví dụ về các chất mang rắn bao gồm các chất khoáng tự nhiên, như thạch anh, đất sét, caolinit, pyrophyllit, serixit, talc, 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 hữu cơ rắn, như axit silixic tổng hợp, các silicat tổng hợp, tinh bột, xenluloza và các bột thực vật (ví dụ, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô, cuống cây thuốc lá, v.v.); các chất mang dẻo, như polyetylen, polypropylen và polyvinyliden clorua; urê; các loại vật liệu vô cơ rỗng; các loại vật liệu dẻo rỗng; và silic dioxit dạng khối (cacbon trắng). Các chất mang rắn có thể được dùng riêng rẽ, và cũng có thể dùng kết hợp hai hoặc nhiều loại với nhau.

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

glycol monoethyl ete, dipropyl ete và tetrahydrofuran; các hydrocacbon béo, như parafin thường, naphten, isoparafin, dầu hỏa và dầu khoáng; các hydrocacbon thơm, như benzen, toluen, xilen, dung môi naphta và alkyl naphtalen; hydrocacbon halogen hóa, như diclometan, clorofom và cacbon tetraclorea; các este, như etyl axetat, diisopropyl phtalat, dibutyl phtalat, dioctyl phtalat và dimetyl adipat; các lacton, như γ -butyrolacton; các amit, như dimetylfomamit, dietylformamit, dimetylxetamit và N-alkyl pyrolidinon; các nitril, như axetonitril; các hợp chất của lưu huỳnh, như dimetyl sulfoxit; dầu thực vật, như dầu đậu nành, dầu hạt cải dầu, dầu hạt cotton, dầu thầu dầu và nước. Một trong số các chất mang lỏng này có thể được dùng riêng rẽ, và cũng có thể dùng kết hợp hai hoặc nhiều loại với nhau

Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt được sử dụng làm chất phân tán hoặc tác nhân tổng hợp ẩm/phân bố bao gồm các chất hoạt động bề mặt không ion, như este của axit béo với sorbitan, este của axit béo với sorbitan polyoxyetylen, este của axit béo với sucroza, este của axit béo với polyoxyetylen, este của axit nhựa polyoxyetylen, dieste của axit béo với polyoxyetylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkyl aryl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete, polyoxyetylen dialkyl phenyl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete-formaldehyt cô đặc, các copolyme khối polyoxyetylen-polyoxypropylen, các polyme khối polystyren-polyoxyetylen, ete của copolyme khối alkyl polyoxyetylen-polypropylen, polyoxyetylen alkylamin, amit của axit béo polyoxyetylen, bis(phenyl ete) của axit béo polyoxyetylen, polyalkylen benzyl phenyl ete, polyoxyalkylen styryl phenyl ete, axetylen diol, axetylen diol được cộng polyoxyalkylen, silicon kiểu polyoxyetylen ete, silicon kiểu este, chất hoạt động bề mặt flo, dầu thầu dầu polyoxyetylen và dầu thầu dầu polyoxyetylen được hydrogen hóa; các chất hoạt động bề mặt anion, như các alkyl sulfat, các polyoxyetylen alkyl ete sulfat, các polyoxyetylen alkyl phenyl ete sulfat, các polyoxyetylen styryl phenyl ete sulfat, các alkylbenzen sulfonat, các alkylaryl sulfonat, các lignosulfonat, các alkyl sulfosuxinat, các naphtalen sulfonat, các

alkylnaphtalen sulfonat, các muối của axit-formaldehyt naphtalensulfonic ngưng tụ, các muối của axit-formaldehyt alkylnaphtalensulfonic ngưng tụ, muối của các axit béo, các muối của axit polycacboxylic, polyacrylat, sarcosinat của axit N-metyl-béo, các chất nhựa hóa, polyoxyetylen alkyl ete phosphat và polyoxyetylen alkyl phenyl ete phosphat; các chất hoạt động bề mặt cation bao gồm các muối alkyl amin, như lauryl amin hydroclorua, stearyl amin hydroclorua, oleyl amin hydroclorua, stearyl amin axetat, stearyl aminopropyl amin axetat, alkyl trimetyl amoni clorua và alkyl dimetyl benzalkoni clorua; và các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính, như các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính kiểu amino axit hoặc kiểu betain Một trong số các chất hoạt động bề mặt có thể được sử dụng riêng rẽ, và cũng có thể sử dụng kết hợp hai hoặc nhiều loại với nhau.

Ví dụ về các chất liên kết hoặc chất dính bao gồm cacboxymetyl xenluloza hoặc muối của nó, dextrin, tinh bột tan được, gồm xanthan, gồm guar, sucroza, polyvinyl pyrolidon, gồm arabic, rượu polyvinyl, polyvinyl axetat, natri polyacrylat, các polyetylen glycol với khối lượng phân tử trung bình từ 6000 đến 20000, các polyetylen oxit với khối lượng phân tử trung bình từ 100000 đến 5000000, các phospholipit (ví dụ, xephalin, lexitin, v.v.), bột xenluloza, dextrin, tinh bột biến tính, các hợp chất tạo chelat với axit polyaminocacboxylic, polyvinyl pyrolidon liên kết ngang, copolyme của axit maleic-styren, copolyme của axit (met)acrylic, các bán este polyme rượu đa chức và dicacboxylic anhydrit, polystyren sulfonat tan được trong nước, parafin, terpen, nhựa polyamit, polyacrylat, polyoxyetylen, sáp, polyvinyl alkyl ete, alkylphenol-formaldehyt đặc và nhũ tương nhựa tổng hợp.

Ví dụ về các chất làm đầy bao gồm các polyme tan được trong nước, như gồm xanthan, gồm guar, gồm diutan, cacboxymetyl xenluloza, polyvinyl pyrolidon, cacboxyvinyl polyme, acrylic polyme, các hợp chất tinh bột và các loại polysaccarit; và bột mịn vô cơ, như bentonit cao cấp và silica dạng khối (cacbon trắng).

Ví dụ về chất tạo màu bao gồm các chất màu vô cơ, như sắt oxit, titan

oxit và màu xanh Prussian; và thuốc nhuộm hữu cơ, như thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm metal phtaloxyanin.

Ví dụ về các tác nhân chống đông bao gồm các loại rượu đa chức, như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol và glyxerin.

Ví dụ về các chất hỗ trợ giúp chống vón cục hoặc phân hủy dễ dàng bao gồm các loại polysaccarit (tinh bột, axit alginic, mannoza, galactosa, v.v.), polyvinyl pyrrolidon, silica dạng khối (cacbon trắng), gôm este, nhựa dầu mỏ, natri tripolyphosphat, natri hexametaphosphat, các stearat kim loại, bột xenluloza, dextrin, metacrylat copolyme, polyvinyl pyrrolidon, các hợp chất tạo chelat với axit polyaminocacboxylic, copolyme anhydrit styren-isobutylen-maleic sulfonat hóa và copolyme tinh bột-polyacrylonitril ghép.

Ví dụ về các tác nhân ổn định bao gồm các chất hút nước, như zeolit, vôi sống và magie oxit; các chất chống oxy hóa, như các hợp chất phenon, hợp chất amin, các hợp chất của lưu huỳnh và các hợp chất của axit phosphoric; và các chất hấp thụ tia cực tím, như các hợp chất axit salixylic và các hợp chất benzophenon.

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

Ngoài ra, chất hỗ trợ khác bao gồm các tác nhân phân rải nhóm chức, các chất tăng hoạt tính như các chất ức chế trao đổi chất (piperonyl butoxit v.v.), các tác nhân chống đông (propylen glycol v.v.), các chất chống oxy hóa (BHT v.v.) và các chất hấp thụ tia cực tím cũng có thể được dùng nếu cần.

Lượng hợp chất thành phần hoạt tính trong thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể điều chỉnh nếu cần, và về cơ bản, lượng hợp chất thành phần hoạt tính được chọn thích hợp 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 thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt có dạng bụi, dạng viên, chất cô đặc có thể nhũ hóa hoặc bột có thể thấm ướt, lượng hợp chất thành phần hoạt tính từ 0,01 đến 50 phần theo trọng lượng (0,01 đến 50% theo trọng

lượng so với tổng trọng lượng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt) là thích hợp.

Tỷ lệ sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế có thể khác nhau với yếu tố khác nhau, ví dụ, mục đích sử dụng, loài gây hại đích, các điều kiện sinh trưởng của cây trồng, khuynh hướng của loài ký sinh gây hại, thời tiết, điều kiện môi trường, dạng liều lượng, phương pháp áp dụng, vị trí sử dụng, thời điểm sử dụng, v.v., nhưng về cơ bản, tỷ lệ sử dụng của hợp chất thành phần hoạt tính được chọn thích hợp trong khoảng từ 0,001 g đến 10 kg, và tốt hơn là từ 0,01 g đến 1 kg trên 1000 m² tùy thuộc vào mục đích.

Ngoài ra, để mở rộng khoảng các loài gây hại đích và thời điểm thích hợp để kiểm soát loài gây hại, hoặc để giảm 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 các loại thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt khác, acarixit, thuốc diệt giun tròn, các chất khử trùng, các thuốc trừ sâu sinh học và/hoặc các loại tương tự. Ngoài ra, 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 tiết sự tăng trưởng của cây trồng, phân bón và/hoặc các loại tương tự phụ thuộc vào từng trường hợp.

Ví dụ về các loại thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bổ sung, acarixit và thuốc diệt giun tròn được sử dụng với mục đích nêu trên bao gồm 3,5-xylyl metylcacbammat (XMC), các chất độc protein tinh thể được sản xuất bởi *Bacillus thuringiensis* như là *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* và *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, các hợp chất trừ sâu có nguồn gốc từ độc tố Bt, CPCBS (clofenson), DCIP (diclodiisopropyl ete), D-D (1,3-diclopropen), DDT, NAC, O-4-dimetylsulfamoylphenyl O,O-diethyl phosphorothioat (DSP), O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat (EPN), tripropylisoxyanurat (TPIC), acrinathrin, azadirachtin, azinphos-metyl, axequinoxyl, axetamiprid,

axetoprol, axephat, abamectin, avermectin-B, amidoflumet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, alpha-endosulfan, alpha-xypermethrin, albendazol, allethrin, isazofos, isamidofos, isoamidofos isoxathion, isofenphos, isoprocab (MIPC), ivermectin, imicyafos, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, esfenvalerat, ethiofencacb, ethion, ethiprol, etoxazol, ethofenprox, ethoprophos, etrimfos, emamectin, emamectin-benzoat, endosulfan, empenthrin, oxamyl, oxydemeton-metyl, oxydeprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, kali oleat, natri oleat, cadusafos, cartap, cabcaryl, cabcosulfan, cacbofuran, gamma-cyhalothrin, xylylcarb, quinalphos, kinopren, chinometionat, cloethocarb, clothianidin, clofentezin, chromafenozid, clorantraniliprol, cloetoxifos, clodimeform, clodan, clopyrifos, clopyrifos-metyl, clophenapy, clofenson, clofenvinphos, clofluazuron, clobenzilat, clobenzoat, kelthan (dicofol), salithion, xyanophos (CYAP), diafenthiuron, diamidafos, xyantraniliprol, theta-xypermethrin, dienoclo, xyenopyrafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-xypermethrin, dichlofenthion (ECP), xycloprothrin, diclofos (DDVP), disulfoton, dinotefuran, xyhalothrin, xyphenothrin, xyfluthrin, diflubenzuron, xyflumetofen, diflovidazin, xyhexatin, xypermethrin, dimetylvinphos, dimethoat, dimefluthrin, silafluofen, xyromazin, spinetoram, spinosad, spiroticlofen, spirotetramat, spiromesifen, sulfluramid, sulprofos, sulfoxaflo, zeta-xypermethrin, diazinon, tau-fluvalinat, dazomet, thiacloprid, thiamethoxam, thioticarb, thioxyclam, thiosultap, thiosultap-natri, thionazin, thiometon, deet, dieldrin, tetraclovinphos, tetradifon, tetrametylfluthrin, tetramethrin, tebupirimfos, tebufenozid, tebufenpyrad, tefluthrin, teflubenzuron, demeton-S-metyl, temephos, deltamethrin, terbufos, tralopyril, tralomethrin, transfluthrin, triazamat, triazuron, trichlamid, triclophon (DEP), triflumuron, tolfenpyrad, naled (BRP), nithiazin, nitenpyram, novaluron, noviflumuron, hydropren, vaniliprol, vamidothion, parathion, parathion-metyl, halfenprox, halofenozid, 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, brompropylat, 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, fluxyclohexuron, flucythrinate, fluvalinat, flupyrzofos, flufenimer, flufenoxuron, flufenzin, flufenprox, fluproxyfen, flubroxysthinate, flubendiamid, flumethrin, flurimfen, prothiofos, prothifinbut, flonicamid, propaphos, propargit (BPPS), profenofos, profluthrin, propoxur (PHC), brompropylat,

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

dầu máy, malathion, milbemycin, milbemycin-A, milbemectin, mecacbam, mesulfenfos, methomyl, metaldehyt, metaflumizon, metamidophos, metamoni, metam-natri, methiocarb, methidathion (DMTP), metylisothioxyanat, metylneodecanamid, metylparathion, metoxadiazon, metoxyclo, metoxyfenozid, metofluthrin, methopren, metolcarb, meperfluthrin, mevinphos, monocrotophos, monosultap, lambda-xyhalothrin, ryanodin, lufenuron, resmethrin, lepimectin, rotenone, levamisol hydroclorua, fenbutatin oxit, morantel tartarat, metyl bromua, trixyclohexyltin hydroxit (xyhexatin), canxi xyanamid, canxi polysulfua, lưu huỳnh và nicotin-sulfat.

Ví dụ về các chất khử trùng dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được sử dụng với mục đích nêu trên bao gồm aureofungin, azaconazol, azithiram, axypetacs, axibenzolar, axibenzolar-S-metyl, azoxystrobin, anilazin, amisulbrom, ampropylfos, ametoctradin, rượu allyl, aldimorph, amobam, isotianil, isovaledion, isopyrazam, isoprothiolan, ipconazol, iprodion,

iprovalicarb, iprobenfos, imazalil, iminoctadin, iminoctadin-albesilat, iminoctadin-triaxetat, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, echlomezol, edifenphos, etaconazol, etaboxam, ethirimol, etem, etoxyquin, etridiazol, enestroburin, epoxiconazol, oxadixyl, oxycacboxin, đồng-8-quinolinolat, oxytetraxyclin, đồng-oxinat, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarat, axit oxolinic, octhilinon, ofurac, orysastrobin, metam-natri, kasugamycin, cacbamorph, carpropamid, carbendazim, cacboxin, carvone, quinazamid, quinacetol, quinoxifen, quinometionat, captafol, captan, kiralaxyl, quinconazol, quintozen, guazatin, cufraneb, cuprobam, glyodin, griseofulvin, climbazol, cresol, kresoxim-metyl, chlozolinat, clotrimazol, chlobenthiazon, cloaniformetan, cloanil, cloquinox, clopicrin, clofenazol, clodinitronaphthalene, clothalonil, cloneb, zarilamid, salixylanilid, xyazofamid, diethyl pyrocacbonat, diethofencarb, xyclafuramid, diclocymet, dichlozolin, diclobutrazol, dichlofluanid, xycloheximid, diclomezin, dicloran, diclophen, diclon, disulfiram, ditalimfos, dithianon, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinoceton, dinosulfon, dinoterbon, dinobuton, dinopenton, dipyrithion, diphenylamin, difenoconazol, cyflufenamid, diflumetorim, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, cypendazol, simeconazol, dimethirimol, dimethomorph, xymoxanil, dimoxystrobin, metyl bromua, ziram, silthiofam, streptomycin, spiroxamin, sultropen, sedaxan, zoxamid, dazomet, thiadiazin, tiadinil, thiadiflo, thiabendazol, tioxyimid, thioclofenphim, thiophanat, thiophanat-metyl, thixyofen, thioquinox, chinometionat, thifluzamid, thiram, decafentin, tecnazen, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, axit dehydroaxetic, tebuconazol, tebufloquin, dodicin, dodin, dodexyl benzensulfonat bis-etylen diamin đồng(II) (DBEDC), dodemorph, drazoxolon, triadimenol, triadimefon, triazbutil, triazoxit, triamiphos, triarimol, trichlamid, tricyclazol, triticonazol, tridemorph, tributyltin oxit, triflumizol, trifloxystrobin, triforin, tolylfluanid, tolclofos-metyl, natamycin, nabam, nitrothal-isopropyl, nitrostyren, nuarimol, đồng nonylphenol

sulfonat, halacrinat, validamycin, valifenalat, harpin protein,
 bixafen, picoxystrobin, picobenzamid, bithionol, bitertanol,
 hydroxyisoxazol, hydroxyisoxazol-kali, binapacryl, biphenyl, piperalin,
 hymexazol, pyraoxystrobin, pyracacbolid, pyraclostrobin, pyrazophos,
 pyrametostrobin, pyriofenon, pyridinitril, pyrifenox, pyribencarb,
 pyrimetanil, pyroxylo, pyroxyfur, pyroquilon, vinclozolin,
 famoxadon, fenapanil, fenamidon, fenaminosulf, fenarimol, fenitropan,
 fenoxanil, ferimzon, ferbam, fentin, fenciclonil, fenpyrazamin,
 fenbuconazol, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fenhexamid, phthalid,
 buthiobat, butylamin, bupirimat, fuberidazol, blasticidin-S, furametpy,
 furalaxyl, fluacrypyrim, fluazinam, fluoxastrobin, fluotrimazol, fluopicolid,
 fluopyram, floimid, furcacbanil, fluxapyroxad, fluquinconazol, furconazol,
 furconazole-cis, fludioxonil, flusilazol, flusulfamid, flutianil, flutolanil,
 flutriafol, furfural, furmexyclox, 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, polycacbammat, folpet,
 formaldehyd, 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, mepanipyrim, mefenoxam, meptyldinocap,
 mepronil, mebenil, iotometan, rabenzazol, benzalkonium clorua, đồng clorua
 bazơ, đồng sulfat bazơ, chất diệt khuẩn vô cơ như là bạc, natri hypoclorơ,
 cupric hydroxit, lưu huỳnh có thể thấm ướt, canxi polysulfua, kali hydro
 cacbonat, natri hydro cacbonat, lưu huỳnh, đồng sulfat anhydrit, niken

dimetyldithiocacbammat, các hợp chất đồng như là đồng-8-quinolinolat (đồng oxin), kẽm sulfat và đồng sulfat pentahydrat.

Ví dụ về thuốc diệt cỏ được sử dụng đề với mục đích trên bao gồm 1-naphthylaxetamit, 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, aciflofen, aziprotryn, azimsulfuron, asulam, axetoclo, atrazin, atraton, anisuron, anilofos, aviglyxin, axit abscisic, amicacbazon, amidosulfuron, amitrol, aminoxyclopyraclo, aminopyralid, amibuzin, amiprophos-metyl, ametrion, ametryn, alaclo, allidoclo, alloxymid, alorac, isouron, isocacbamid, isoxaclotol, isoxapyrifop, isoxaflutol, isoxaben, isocil, isonoruron, isoproturon, isopropalin, isopolinat, isomethiozin, inabenfide, ipazin, ipfencacbazon, iprymidam, imazaquin, imazapic, imazapy, imazametapy, imazametabenz, imazametabenz-metyl, imazamox, imazetapy, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, uniconazol-P, eglinazin, esprocarb, etametsulfuron, etametsulfuron-metyl, etalfluralin, ethiolat, etyclozat-etyl, ethidimuron, etinofen, ethephon, etoxysulfuron, etoxyfen, etnipromid, ethofumesat, etobenzanid, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargyl, oxaziclomefon, oxasulfuron, oxapyrazon, oxyflofen, oryzalin, orthosulfamuron, orbencarb, cafenstrol, cambendiclo, cacbasulam, carfentrazone, carfentrazone-etyl, karbutilat, carbetamid, cacboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etyl, xylaclo, quinclamin, quinonamid, quinclorac, quinmerac, cumyluron, cliotinat, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P, credazin, clethodim, cloxyfonac, clodinafop, clodinafop-propargyl, clotoluron, clopyralid, cloproxydim, cloprop, clobromuron, clofop, clomazon, clometoxynil, clometoxyfen, 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,
 saflufenaxil, xyanazin, xyanatryn, di-allat, diuron, dietamquat, dicamba,
 xycluron, xycloa, xycloxydim, diclosulam, xyclosulfamuron, dicloprop,
 dicloprop-P, dichlobenil, diclofop, diclofop-metyl, diclomat, dicloalurea,
 diquat, cisanilide, disul, siduron, dithiopy, dinitramin, cinidon-etyl, dinosam,
 cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenat, dinoprop, xyhalofop-butyl,
 diphenamid, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, xybutryn, xyprazin,
 xyprazol, diflufenican, diflufenzopy, dipropetryn, xypromid, xyperquat,
 gibberellin, simazin, dimexano, dimetaclo, dimidazon, dimetametryn,
 dimethenamid, simetryn, simeton, dimepiperat, dimefuron, cinmetylin, swep,
 sulglycapin, sulcotrion, sulfallat, sulfentrazon, sulfosulfuron, sulfometuron,
 sulfometuron-metyl, secbumeton, setoxydim, sebuthylazin,
 terbaxil, daimuron, dazomet, dalapon, thiazafluron, thiazopy, thienacabazon,
 thienacabazon-metyl, tiocacbazil, tioclorim, thiobencarb, thidiazimin,
 thidiazuron, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, desmedipham, desmetryn,
 tetrafluron, thenylclo, tebutam, tebuthiuron, terbumeton, tepraloxym,
 tefuryltrion, tembotrion, delaclo, terbaxil, terbucarb, terbuclo, terbuthylazin,
 terbutryn, topramezon, tralkoxydim, triaziflam, triasulfuron, tri-allat,
 trietazin, tricamba, triclopy, tridiphan, tritac, tritosulfuron, triflusulfuron,
 triflusulfuron-metyl, trifluralin, trifloxysulfuron, tripropindan, tribenuron-
 metyl, tribenuron, trifop, trifopsim, trimeturon, naptalam, naproanilid,
 napropamid, nicosulfuron, nitratin, nitrofen, nitroflofen, 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, pyrazolat, bilanafos,
 pyraflufen-etyl, pyriclo, pyridafol, pyriothiac, pyriothiac-natri, pyridat,
 pyrifthalid, pyributicarb, pyribenzoxim, pyrimisulfan, pyrimisulfuron,

pyriminobac-metyl, pyroxasulfon, pyroxsulam,
 fenasulam, phenisopham, fenuron, fenoxasulfon, fenoxaprop, fenoxaprop-P,
 fenoxaprop-etyl, phenothiol, fenoprop, phenobenzuron, fenthiaprop,
 fenteracol, fentrazamid, phenmedipham, phenmedipham-etyl, butaclo,
 butafenaxil, butamifos, buthiuron, buthidazol, butylat, buturon, butenaclo,
 butroxydim, butralin, flazasulfuron, flamprop, furyloxyfen, prynaclo,
 primisulfuron-metyl, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazolat,
 fluroxypy, fluothiuron, fluometuron, floglycofen, fluocloidon, flodifen,
 flonitrofen, flomidin, flucacbazon, flucacbazon-natri, flucloalin,
 flucetosulfuron, fluthiacet, fluthiacet-metyl, flupyrasulfuron, flufenacet,
 flufenican, flufenpy, flupropacil, flupropanat, flupoxam, flumioxazin,
 flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumipropyn, flumezin, fluometuron,
 flumetsulam, fluridon, flurtamon, fluroxypy,
 pretilaclo, proxan, proglinazin, procyazin, prodiamin, prosulfalin,
 prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclo, propazin, propanil,
 propyzamid, propisoclo, prohydrojasmon, propyrisulfuron, propham,
 profluazol, profluralin, prohexadion-canxi, propoxycacbazon,
 propoxycacbazon-natri, profoxydim, bromaxil, brompyrazon, prometryn,
 prometon, bromxynil, bromfenoxim, brombutid, brombonil, florasulam,
 hexacloaxeton, hexazinon, pethoxamid, benazolin, penoxsulam, pebulat,
 beflubutamid, vernolat, perfluidon, bencacbazon, benzadox, benzipram,
 benzylaminopurin, benzthiazuron, benzfendizon, bensulid, bensulfuron-
 metyl, benzoylprop, benzobixyclon, benzofenap, benzoflo, bentazon,
 pentanoclo, benthioncarb, pendimetalin, pentoxazon, benfluralin, benfuresat,
 fosamin, fomesafen, foramsulfuron, forclofenuron, maleic hydrazid,
 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, mefenaxet, mefluidit, monalid, monisouron, monuron, axit monocloaxetic, monolinuron, molinat, morfamquat, iotosulfuron, iotosulfuron-metyl-natri, iotobonil, iotometan, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenaxil, rhodetanil, canxi peroxit và metyl bromua.

Ví dụ về các thuốc trừ sâu sinh học được sử dụng để với mục đích trên bao gồm các dạng virus như các virut đa diện nhân (nuclear polyhedrosis viruses-NPV), các virut hạt (granulosis viruses-GV), virut đa diện bào tương (cytoplasmic polyhedrosis viruses-CPV) và virut entomopox (EPV); thuốc diệt loài gây hại vi trùng được dùng làm thuốc trừ sâu hoặc thuốc diệt giun tròn, như *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* và *Pasteuria penetrans*; thuốc diệt loài gây hại vi trùng được dùng chất khử trùng, như *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, các thuốc không có độc tính *Erwinia carotovora* và *Bacillus subtilis*; và các thuốc trừ sâu sinh học được dùng làm thuốc diệt cỏ, như *Xanthomonas campestris*. Việc sử dụng kết hợp thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt theo sáng chế với thuốc trừ sâu sinh học nói trên hỗn hợp có thể được kỳ vọng cho hiệu quả tương đương như trên.

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

Các hợp chất của sáng chế có các đặc tính sinh học ưu việt như được mô tả ở trên, và ngoài ra, có ít tác động đến môi trường, như được minh họa bằng ví dụ có thể dễ dàng phân hủy trong môi trường và có ít tác động đến các sinh vật có lợi như là ong mật.

Các hợp chất của sáng chế cũng thích hợp để diệt ký sinh trùng mà sống ở bên trong hoặc ở phía ngoài của động vật như là người, gia súc và vật nuôi.

Sáng chế cũng bao gồm tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật bao gồm hợp chất của sáng chế hoặc muối của nó làm thành phần hoạt tính; và phương pháp kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật, bao gồm quá trình xử lý các vật ngoại ký sinh trên động vật với tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật. Hợp chất của sáng chế có thể được sử dụng bằng áp dụng tại chỗ hoặc đổ vào một hoặc hai vị trí ở trên da của động vật như mèo hoặc chó. Diện tích áp dụng thường từ 5 đến 10 cm². Một khi được áp dụng, hợp chất của sáng chế tốt hơn là khuếch tán qua cơ thể động vật và sau đó khô đi mà không kết tinh hoặc thay đổi về vẻ bề ngoài hoặc kết cấu trực quan. Tốt hơn là lượng hợp chất sử dụng được chọn từ phạm vi từ 0,1 đến 10 mL theo trọng lượng của động vật, và cụ thể, là khoảng từ 0,5 đến 1 mL cho mèo và khoảng từ 0,3 đến 3 mL cho chó.

Tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh của sáng chế chống lại hiệu quả, ví dụ, các vật ngoại ký sinh trên động vật sau đây. Các loài bộ chét ký sinh bao gồm các loài thuộc chi *Pulex* như là *Pulex irritans*; các loài thuộc chi *Ctenocephalides* như là *Ctenocephalides felis* và *Ctenocephalides canis*; các loài thuộc chi *Xenopsylla* như là *Xenopsylla cheopis*; các loài thuộc chi *Tunga* như là *Tunga penetrans*; các loài thuộc chi *Echidnophaga* như là *Echidnophaga gallinacea*; và các loài thuộc chi *Nosopsyllus* như là *Nosopsyllus fasciatus*.

Các loài rận hút máu ký sinh bao gồm các loài thuộc chi *Pediculus* như là *Pediculus humanus capitis*; các loài thuộc chi *Pthirus* như là *Pthirus pubis*; các loài thuộc chi *Haematopinus* như là *Haematopinus eurysternus* và *Haematopinus suis*; các loài thuộc chi *Damalinia* như là *Damalinia ovis* và *Damalinia bovis*; các loài thuộc chi *Linognathus* như là *Linognathus vituli* và *Linognathus ovillus* (rận ký sinh trên thân cừu); và các loài thuộc chi *Solenopotes* như là *Solenopotes capillatus*.

Các loài chấy Mallophaga ký sinh bao gồm các loài thuộc chi *Menopon*

như là *Menopon gallinae*; *Trimenopon* nhiều loài thuộc giống; *Trinoton* nhiều loài thuộc giống; các loài thuộc chi *Trichodectes* như là *Trichodectes canis*; các loài thuộc chi *Felicola* như là *Felicola subrostratus*; các loài thuộc chi *Bovicola* như là *Bovicola bovis*; các loài thuộc chi *Menacanthus* như là *Menacanthus straminus*; nhiều loài thuộc giống *Werneckiella*; và nhiều loài thuộc giống *Lepikentron*.

Các loài ký sinh trùng cánh nửa bao gồm các loài thuộc chi *Cimex* như là *Cimex lectularius* và *Cimex hemipterus*; các loài thuộc chi *Reduvius* như là *Reduvius senilis*; các loài thuộc chi *Arilus* như là *Arilus critatus*; các loài thuộc chi *Rhodnius* như là *Rhodnius prolixus*; các loài thuộc chi *Triatoma* như là *Triatoma rubrofasciata*; và nhiều loài thuộc giống *Panstrongylus*.

Các ký sinh trùng thuộc loài ve bét Acarina bao gồm các loài thuộc chi *Amblyomma* như là *Amblyomma americanum* và *Amblyomma maculatum*; các loài thuộc chi *Boophilus* như là *Boophilus microplus* và *Boophilus annulatus*; các loài thuộc chi *Dermacentor* như là *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor taiwanensis* và *Dermacentor andersoni*; các loài thuộc chi *Haemaphysalis* như là *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava* và *Haemaphysalis campanulata*; các loài thuộc chi *Ixodes* như là *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes pacificus* và *Ixodes holocyclus*; các loài thuộc chi *Rhipicephalus* như là *Rhipicephalus sanguineus* và *Rhipicephalus appendiculatus*; các loài thuộc chi *Argas* như là *Argas persicus*; các loài thuộc chi *Ornithodoros* như là *Ornithodoros hermsi* và *Ornithodoros turicata*; các loài thuộc chi *Psoroptes* như là *Psoroptes ovis* và *Psoroptes equi*; các loài thuộc chi *Knemidocoptes* như là *Knemidocoptes mutans*; các loài thuộc chi *Notoedres* như là *Notoedres cati* và *Notoedres muris*; các loài thuộc chi *Sarcoptes* như là *Sarcoptes scabiei*; các loài thuộc chi *Otodectes* như là *Otodectes cynotis*; các loài thuộc chi *Listrophorus* như là *Listrophorus gibbus*; nhiều loài thuộc giống *Chorioptes*; nhiều loài thuộc giống *Hypodectes*; nhiều loài thuộc giống *Pterolichus*; nhiều loài thuộc giống *Cytodites*; nhiều loài thuộc giống *Laminosioptes*; các loài thuộc chi

Dermanyssus như là *Dermanyssus gallinae*; các loài thuộc chi *Ornithonyssus* như là *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bacoti*; các loài thuộc chi *Varroa* như là *Varroa jacobsoni*; các loài thuộc chi *Cheyletiella* như là *Cheyletiella yasguri* và *Cheyletiella blakei*; nhiều loài thuộc giống *Ornithocheyletia*; các loài thuộc chi *Demodex* như là *Demodex canis* và *Demodex cati*; nhiều loài thuộc giống *Myobia*; nhiều loài thuộc giống *Psorergates*; và các loài thuộc chi *Trombicula* như là *Trombicula akamushi*, *Trombicula pallida* và *Trombicula scutellaris*. Được ưu tiên là các ký sinh thuộc loài bộ chết Siphonaptera, các ký sinh thuộc loài rận hút máu Siphunculata và các ký sinh thuộc loài ve bét Acarina.

Các loài động vật mà có thể sử dụng tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh của sáng chế có thể là vật chủ đối với các vật ngoại ký sinh trên động vật được đề cập ở trên. Các loài động vật như này thường là các loài động vật đẳng nhiệt và các loài động vật biến nhiệt mà được nhân giống như gia súc hoặc vật nuôi. Các loài động vật đẳng nhiệt như này bao gồm các loài động vật có vú như là trâu bò, trâu, cừu, dê, lợn, lạc đà, hươu, nai, tuần lộc, ngựa, lừa, chó, mèo, thỏ, chồn, chuột, chuột, chuột và khỉ; động vật mang lông như chồn, sóc sin-sin và gấu trúc; và các loài chim như gà, ngỗng, gà tây, vịt nhà, bồ câu, vẹt và chim cú. Các loài động vật biến nhiệt được đề cập ở trên bao gồm các loài bò sát như rùa, rùa biển, truyệt ao, rùa ao Nhật Bản, thằn lằn, cự đà, tắc kè hoa, tắc kè, rắn, rắn nước và rắn hổ mang. Được ưu tiên là các loài động vật đẳng nhiệt, và được ưu tiên hơn là các động vật có vú như chó, mèo, gia súc, ngựa, lợn, cừu và dê.

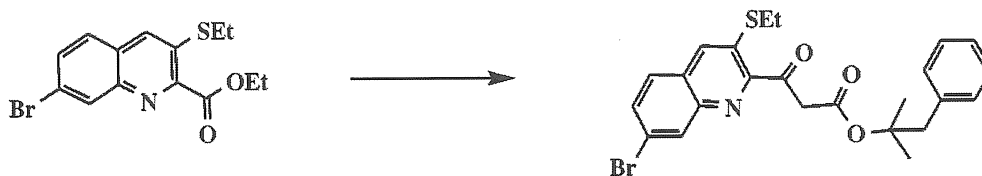
Ví dụ thực hiện sáng chế

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

Ví dụ tham khảo 1

Phương pháp điều chế este 1,1-dimetyl-2-phenyletyl của axit 3-(7-brom-3-ethylthio-quinolin-2-yl)-3-oxy-propionic.

Công thức hóa học 14

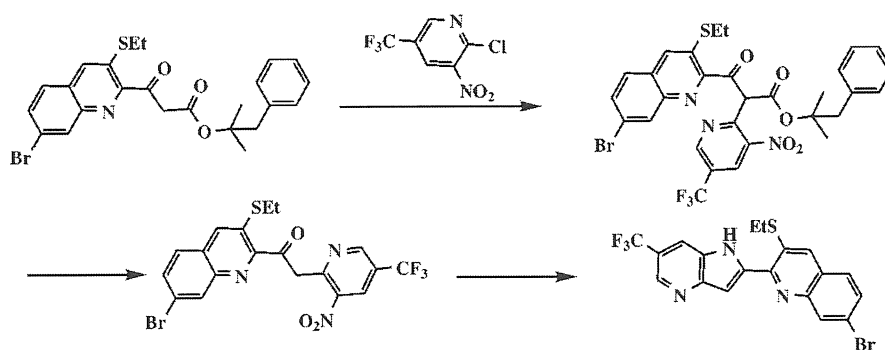


Hòa tan Este 1,1-dimetyl-2-phenyletyl của axit axetic (538 mg, 2,8 mmol) vào trong tetrahydrofuran (THF) (12 mL). Dưới môi trường argon, dung dịch được làm nguội trong bể axeton khô, và bổ sung thêm lithi diisopropylamid (dung dịch 2,6 M trong THF, 2,6 mL). Sau khi khuấy được 30 phút, bổ sung (808 mg, 2,4 mmol) este etyl của axit 7-brom-3-etylthio-quinolin-2-cacboxylic, mà được điều chế bằng phương pháp được mô tả trong tài liệu WO 2016/091731, sau khi khuấy được 1,5 giờ, bổ sung axit clohydric 3 N, và hỗn hợp được làm nóng đến nhiệt độ phòng. Bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện chiết tách etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa với dung dịch nước natri clorua bão hòa. Lớp hữu cơ đã rửa được làm khô qua natri sulfat khan, và dung môi được làm bay hơi trong chân không. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra hỗn hợp (620 mg) chứa hợp chất mong muốn.

Ví dụ tham khảo 2

Phương pháp điều chế 2-(7-brom-3-etylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin

Công thức hóa học 15



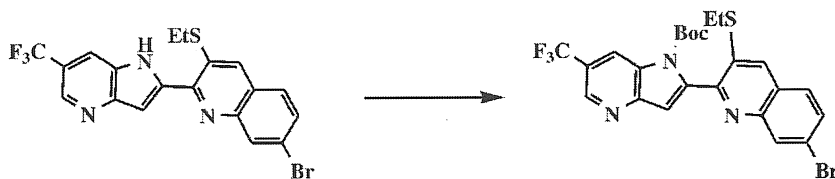
Hòa tan Este 1,1-dimetyl-2-phenyletyl của axit 3-(7-Bromo-3-etylthio-quinolin-2-yl)-3-oxy-propionic (750 mg) vào trong N,N-dimetylformamid

(DMF) (5 mL), và bổ sung natri hydrua (136 mg) trong điều kiện làm mát bằng đá lạnh. Sau khi khuấy được 30 phút, bổ sung 2-clo-3-nitro-5-triflometyl pyridin (462 mg) vào, và hỗn hợp được khuấy trong 2 giờ. Nước, axit clohydric 3 N và etyl axetat lần lượt được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng, và thực hiện việc chiết tách. Lớp hữu cơ được cô đặc, bổ sung axit trifloaxetic (5 mL) vào phần còn sót lại, và hỗn hợp được khuấy ở 50°C trong 1 giờ. Bổ sung bột sắt (500 mg) vào hỗn hợp phản ứng, và hỗn hợp được khuấy ở 80°C trong 2 giờ. Bổ sung nước và etyl axetat vào hỗn hợp phản ứng, và hỗn hợp được lọc qua Celite. Chiết tách lớp nước với etyl axetat, và cô đặc lớp hữu cơ. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra hợp chất mong muốn, nghĩa là, 2-(7-brom-3-etylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin (446 mg).

Ví dụ tham khảo 3

Phương pháp điều chế 1-(t-butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-etylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin

Công thức hóa học 16

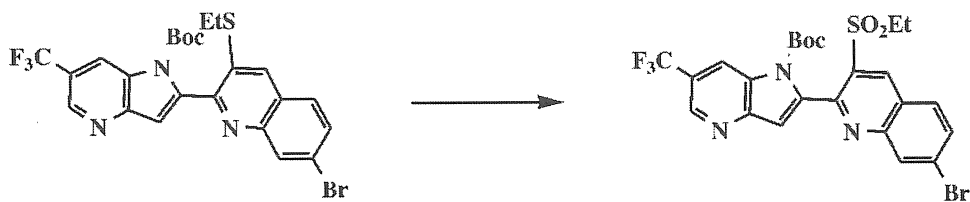


Hòa tan 2-(7-Bromo-3-etylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin (250 mg) vào trong THF (2 mL), và bổ sung N,N-dimetylaminopyridin (10 mg) và di-tert-butyl dicarbonat (158 mg). Sau khi khuấy được 30 phút, hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra hợp chất mong muốn, nghĩa là, 1-(t-butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-etylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin (244 mg).

Ví dụ tham khảo 4

Phương pháp điều chế 1-(t-butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrido[3,2-b]pyridin

Công thức hóa học 17

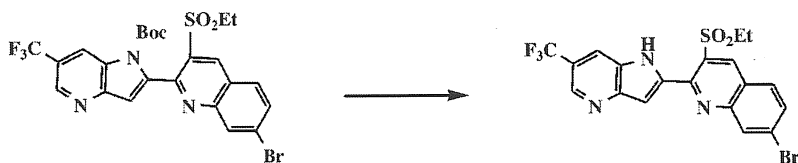


Hòa tan 1-(t-Butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-ethylthio-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (233 mg) vào trong etyl axetat (10 mL). Bổ sung axit meta-clopebenzoic (233 mg) vào hỗn hợp trên, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 10 phút. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra hợp chất mong muốn, nghĩa là, 1-(t-butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (149 mg).

Ví dụ tham khảo 5

Phương pháp điều chế 2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin trifloaxetat

Công thức hóa học 18

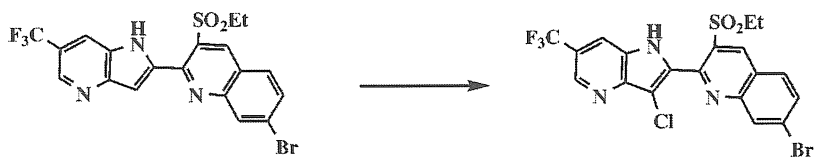


Hòa tan 1-(t-Butoxycarbonyl)-2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (135 mg) vào trong axit trifloaxetic (2 mL), và dung dịch được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra hợp chất mong muốn, nghĩa là, 2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin trifloaxetat (144 mg).

Ví dụ tham khảo 6

Phương pháp điều chế 3-clo-2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin

Công thức hóa học 19

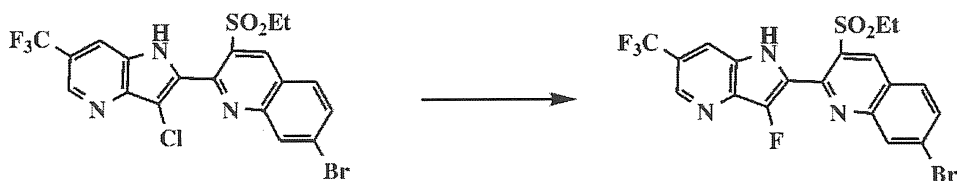


Hòa tan 2-(7-Bromo-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin trifluoroacetat (134 mg) vào trong axetonitril (5 mL) và DMF (1 mL). Bổ sung sulfuryl clorua (1 mL) vào hỗn hợp này, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 10 phút. Bổ sung dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa và dung dịch nước natri thiosulfat bão hòa vào hỗn hợp phản ứng, và hỗn hợp được khuấy trong 30 phút. Chiết tách lớp nước với etyl axetat, và cô đặc lớp hữu cơ. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra 3-clo-2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (104 mg).

Ví dụ tham khảo 7

Phương pháp điều chế 2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-flo-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin

Công thức hóa học 20

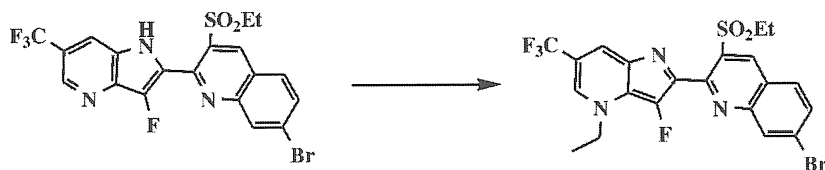


Hòa tan 3-Clo-2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (74 mg) vào trong axetonitril (5 mL). Bổ sung natri bicacbonat (40 mg) và Selectflo (160 mg) vào hỗn hợp trên, và hỗn hợp được khuấy ở 60°C trong 1 giờ. Bổ sung dung dịch nước natri thiosulfat bão hòa vào hỗn hợp phản ứng, và hỗn hợp được khuấy trong 10 phút và sau đó được để nguội xuống nhiệt độ phòng. Chiết tách lớp nước với etyl axetat, và cô đặc lớp hữu cơ. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột để cho ra 2-(7-brom-3-ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-flo-6-trifluoromethyl-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin (25 mg).

Ví dụ 1

Phương pháp điều chế 2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-flo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrololo[3,2-b]pyridin (hợp chất số 2-76)

Công thức hóa học 21

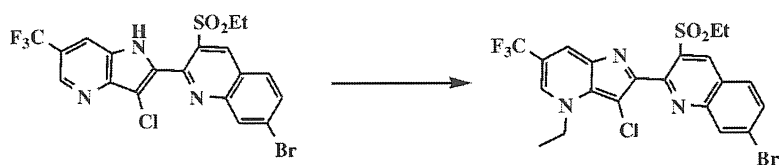


Bổ sung Etyl iotua (0,3 mL) vào dung dịch DMF (0,3 mL) chứa 2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-flo-6-triflometyl-1H-pyrololo[3,2-b]pyridin (10 mg, 0,02 mmol), và hỗn hợp được khuấy ở 80°C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, etyl axetat được bổ sung vào, và lớp hữu cơ được rửa với dung dịch nước natri clorua bão hòa. Lớp hữu cơ đã rửa được làm khô qua natri sulfat khan, và dung môi được làm bay hơi trong chân không. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột silica gel để cho ra 2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-flo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrololo[3,2-b]pyridin (5,1 mg, 47%).

Ví dụ 2

Phương pháp điều chế 2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-clo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrololo[3,2-b]pyridin (hợp chất số 2-52)

Công thức hóa học 22



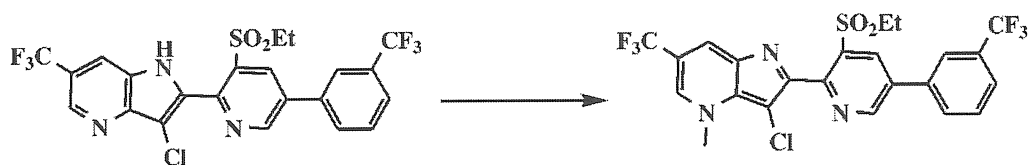
Bổ sung etyl iotua (0,3 mL) vào dung dịch DMF (0,3 mL) chứa 3-clo-2-(7-brom-3-etylsulfonyl-quinolin-2-yl)-6-triflometyl-1H-pyrololo[3,2-b]pyridin (10 mg, 0,02 mmol), và hỗn hợp được khuấy ở 80°C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, etyl axetat được bổ sung vào, và lớp hữu cơ được rửa với dung dịch nước natri clorua bão hòa. Lớp hữu cơ đã rửa được làm khô qua natri sulfat khan, và dung môi được làm bay hơi trong chân không. Phần còn sót lại được đưa vào sắc ký cột silica gel để cho ra 2-(7-brom-3-

ethylsulfonyl-quinolin-2-yl)-3-clo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrolo[3,2-b]pyridin (7,2 mg, 64%).

Ví dụ 3

Phương pháp điều chế 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-clo-4-metyl-6-triflometyl-4H-pyrolo[3,2-b]pyridin (hợp chất số 1-13)

Công thức hóa học 23

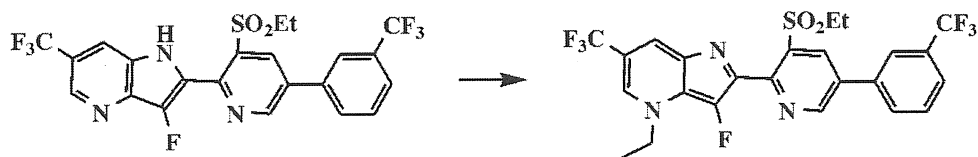


Bổ sung MeI (1 mL, 16 mmol) vào dung dịch DMF (1 mL) chứa 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-clo-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (0,05 g, 0,094 mmol), mà hợp chất được điều chế theo sơ đồ được mô tả trong các Ví dụ tham khảo từ 1 đến 6, và hỗn hợp được khuấy ở 60°C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết tách etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magie sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không. Phần còn sót lại được tinh chế bằng sắc ký cột silica gel để cho ra 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-clo-4-metyl-6-triflometyl-4H-pyrolo[3,2-b]pyridin (0,031 g, 60%).

Ví dụ 4

Phương pháp điều chế 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-flo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrolo[3,2-b]pyridin (hợp chất số 1-16)

Công thức hóa học 24



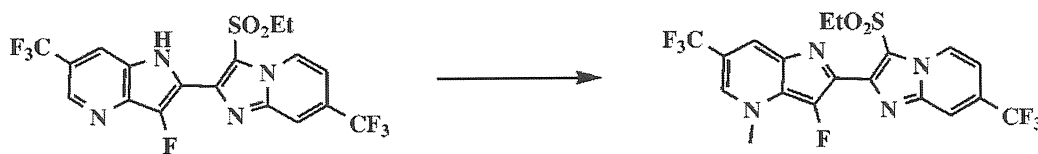
Bổ sung EtI (1 mL, 12,5 mmol) vào dung dịch DMF (1 mL) chứa 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-flo-6-triflometyl-1H-pyrolo[3,2-b]pyridin (0,04 g, 0,077 mmol), mà hợp chất được điều chế theo

sơ đồ được mô tả trong các Ví dụ tham khảo từ 1 đến 7, và hỗn hợp được khuấy ở 80°C trong 3 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hòa được bổ sung, và thực hiện việc chiết tách etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magie sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không. Phần còn sót lại được tinh chế bằng sắc ký cột silica gel để cho ra 2-(5-(3-triflometylphenyl)-3-etylsulfonyl-pyridin-2-yl)-3-flo-4-etyl-6-triflometyl-4H-pyrido[3,2-b]pyridin (0,029 g, 68%).

Ví dụ 5

Phương pháp điều chế 2-(3-etylsulfonyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-3-flo-4-metyl-6-(triflometyl)-4H-pyrido[3,2-b]pyridin (hợp chất số 3-14)

Công thức hóa học 2



Bổ sung DMF (1 mL) và MeI (1 mL) vào 3-etylsulfonyl-2-(3-flo-6-(triflometyl)-1H-pyrido[3,2-b]pyridin-2-yl)-7-(triflometyl)imidazo[1,2-a]pyridin (13,0 mg, 0,0271 mmol), mà được điều chế theo sơ đồ được mô tả trong các Ví dụ tham khảo từ 1 đến 7, và hỗn hợp được khuấy dưới trạng thái hồi lưu trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được pha loãng với etyl axetat, và lớp hữu cơ được rửa lần lượt với nước và dung dịch nước natri clorua bão hòa. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat khan và được lọc, và phần lọc được cô đặc. Phần còn sót lại được tinh chế bằng sắc ký cột silica gel để cho ra 2-(3-etylsulfonyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-3-flo-4-metyl-6-(triflometyl)-4H-pyrido[3,2-b]pyridin (8,0 mg, 60%).

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

Ví dụ bào chế 1

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

Các thành phần nêu trên được trộn hòa tan đồng nhất để cho ra chế phẩm đặc có thể nhũ hóa.

Ví dụ bào chế 2

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

Các thành phần nêu trên được trộn đồng nhất và sau đó được tán thành bột để cho ra chế phẩm dạng bụi.

Ví dụ bào chế 3

Hợp chất của 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 đồng nhất. Sau khi bổ sung lượng thể tích nước thích hợp, hỗn hợp được nhào trộn, được tạo hạt và được làm khô để cho ra chế phẩm dạng hạt.

Ví dụ bào chế 4

Hợp chất của sáng chế	20 phần
Kaolin và axit silixic tổng hợp có độ phân cao	75 phần
Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi alkylbenzen sulfonat	5 phần

Các thành phần nêu trên được trộn đồng nhất và sau đó được tán thành bột để cho ra chế phẩm dạng bột có thể thấm ướt.

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

Ví dụ thử nghiệm 1

Thử nghiệm đối với hiệu quả kiểm soát với *Myzus persicae*

Các cây cải bắp Trung Quốc được trồng ở trong các chậu nhựa (đường kính: 8 cm, chiều cao: 8 cm), Rệp đào xanh (*Myzus persicae*) được gây giống ở trên cây, và số lượng rệp đào xanh sống sót trong mỗi bình được đếm. Các

hợp chất dị vòng ngưng tụ được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc các muối của chúng được phân tán riêng biệt trong nước và được pha loãng đến 500 ppm. Các hệ phân tán hóa nông được áp dụng lên tán lá của các cây cải bắp Trung Quốc được trồng trong chậu. Sau khi các cây được làm khô bằng không khí, các chậu được giữ trong nhà kính. Ở thời điểm 6 ngày sau khi áp dụng lên tán lá, số lượng rệp đào xanh còn sống sót trên cây cải bắp Trung Quốc trong mỗi chậu được đếm, tỷ lệ kiểm soát được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và hiệu quả kiểm soát được đánh giá theo tiêu chuẩn được thể hiện dưới đây.

Công thức toán học 1

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

Ta: số lượng cá thể sống sót trước khi áp dụng lên tán lá trong khu vực xử lý

T: số lượng cá thể sống sót sau khi áp dụng lên tán lá trong khu vực xử lý

Ca: số lượng cá thể sống sót trước khi áp dụng lên tán lá trong khu vực không xử lý

C: số lượng cá thể sống sót sau khi áp dụng lên tán lá trong khu vực không xử lý

Tiêu chuẩn

A: tỷ lệ kiểm soát là 100%.

B: tỷ lệ kiểm soát là từ 90 đến 99%.

C: tỷ lệ kiểm soát là từ 80 đến 89%.

D: tỷ lệ kiểm soát là từ 50 đến 79%.

Kết quả là, các hợp chất 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14, 3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-36, 3-43, 3-44, 3-45 và 3-46 của sáng chế đã thể hiện mức độ hoạt tính được

đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 2

Thử nghiệm trừ sâu với *Laodelphax striatellus*

Các hợp chất di vòng ngưng tụ được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế hoặc các muối của chúng được phân tán riêng biệt trong nước và được pha loãng đến 500 ppm. Các cây lúa giống (giống: Nihonbare) được nhúng vào trong các hệ phân tán hóa nông trong 30 giây. Sau khi làm khô bằng không khí, mỗi cây giống được đặt vào trong ống nghiệm bằng thủy tinh riêng biệt và được cấy với muỗi ấu trùng *Laodelphax striatellus* lột xác 3 lần, và sau đó các ống nghiệm bằng thủy tinh được bịt lại bằng các nút bông. Ở thời điểm 8 ngày sau khi cấy, số lượng ấu trùng sống sót và ấu trùng bị chết được đếm, tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và hiệu quả trừ sâu được đánh giá theo tiêu chuẩn được thể hiện dưới đây.

Công thức toán học 2

Tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh (%)

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

Tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh

A: tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh là 100%.

B: tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh là từ 90 đến 99%.

C: tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh là từ 80 đến 89%.

D: tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh là từ 50 đến 79%.

Kết quả là, các hợp chất 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14, 3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-

36, 3-43, 3-44, 3-45 và 3-46 của sáng chế đã thể hiện mức độ hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 3

Thử nghiệm trừ sâu với *Plutella xylostella*

Các cá thể *Plutella xylostella* trưởng thành được thả lên trên các cây giống cải bắp Trung Quốc và được cho đẻ trứng lên trên đó. Ở thời điểm 2 ngày sau khi thả các cá thể trưởng thành, các cây giống cải bắp Trung Quốc có trứng được nhúng trong khoảng 30 giây vào trong các hệ phân tán hóa nông được pha loãng đến 500 ppm, mà mỗi hệ phân tán hóa nông này chứa hợp chất dị vòng ngưng tụ khác nhau được biểu diễn bằng công thức chung (1) của sáng chế làm thành phần hoạt tính. Sau khi làm khô bằng không khí, các cây giống được giữ trong buồng ôn nhiệt ở 25°C. Ở thời điểm 6 ngày sau khi xử lý nhúng, số lượng ấu trùng đã nở trên mỗi khu vực được đếm, tỷ lệ tử vong được tính theo công thức được thể hiện dưới đây, và hiệu quả trừ sâu được đánh giá theo tiêu chuẩn của Ví dụ thử nghiệm 2, Thử nghiệm này được thực hiện ba lần mà sử dụng 10 cá thể *Plutella xylostella* trưởng thành trên mỗi khu vực.

Công thức toán học 3

Tỷ lệ tử vong hiệu chỉnh (%)

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

Kết quả là, các hợp chất 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14, 3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-36, 3-43, 3-44, 3-45 và 3-46 của sáng chế đã thể hiện mức độ hoạt tính được

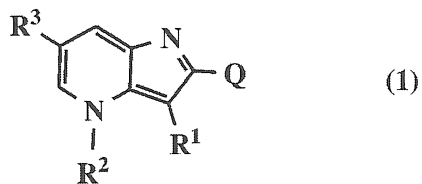
đánh giá là A.

Khả năng áp dụng công nghiệp

Các hợp chất của sáng chế có hiệu quả cao trong việc kiểm soát ở một phạm vi lớn các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt và do đó các hợp chất này là có lợi.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất 4H-pyrolopyridin được biểu diễn bằng công thức chung (1):



trong đó

R^1 là

- (a1) nguyên tử hydro;
- (a2) nguyên tử halogen;
- (a3) nhóm xyano;
- (a4) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (a5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (a6) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl; hoặc
- (a7) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl,

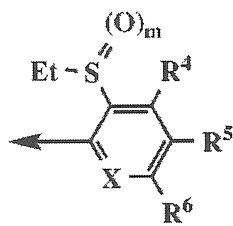
R^2 là

- (b1) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (b2) nhóm xyano (C₁-C₆) alkyl;
- (b3) nhóm (C₂-C₆) alkenyl;
- (b4) nhóm (C₂-C₆) alkynyl;
- (b5) nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl;
- (b6) nhóm (C₁-C₆) alkylthio (C₁-C₆) alkyl;
- (b7) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, hoặc
- (b8) nhóm xycloalkyl (C₃-C₆) alkyl

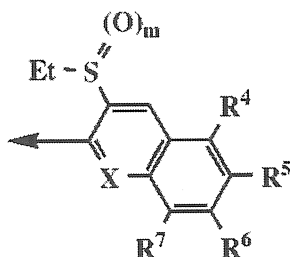
R^3 là

- (c1) nguyên tử halogen;
- (c2) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (c3) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (c4) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (c5) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl; hoặc
- (c6) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl,

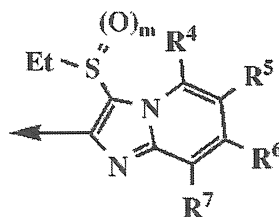
Q là vòng được biểu diễn bằng công thức cấu tạo bất kỳ dưới đây Q-A, Q-B, Q-C



Q-A



Q-B



Q-C

trong đó

X là nhóm CH hoặc nguyên tử nitơ,

R^4 , R^5 , R^6 và R^7 có thể giống hoặc khác nhau, và là

- (d1) nguyên tử hydro;
- (d2) nguyên tử halogen;
- (d3) nhóm formyl;
- (d4) nhóm xyno;
- (d5) nhóm (C₁-C₆) alkyl;
- (d6) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;
- (d7) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkyl;
- (d8) nhóm (C₁-C₆) alkoxy;
- (d9) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;
- (d10) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy;
- (d11) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio;
- (d12) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl;
- (d13) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl;
- (d14) N(R²⁰)(R²¹) (trong đó R²⁰ là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkoxy, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl, và R²¹ là nguyên tử hydro, nhóm (C₁-C₆) alkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl, nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl hoặc nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl);
- (d15) C(R²⁰)=NO(R²¹) (trong đó R²⁰ và R²¹ như được định nghĩa ở trên);

(d16) nhóm aryl;

(d17) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl hoặc (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(d18) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy;

(d19) nhóm aryl (C₁-C₆) alkoxy có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl;

(d20) nhóm dị vòng; hoặc

(d21) nhóm dị vòng có, ở trong vòng, 1 hoặc 2 các nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl,

Z là O, S hoặc N-R⁸ (trong đó R⁸ là (e1) nguyên tử hydro, (e2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (e3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl nhóm hoặc (e4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y¹ là C-R⁹ (trong đó R⁹ là (f1) nguyên tử hydro, (f2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl hoặc (f4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y² là C-R¹⁰ (trong đó R¹⁰ là (g1) nguyên tử hydro, (g2) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (g3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl hoặc (g4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl),

Y³, Y⁴, Y⁵ và Y⁸ là nhóm CH hoặc N,

Y⁶ và Y⁷ có thể giống hoặc khác nhau, và là C-R¹¹ (trong đó

R¹¹ là

(h1) nguyên tử halogen;

(h2) nhóm (C₁-C₆) alkyl;

(h3) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl;

(h4) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl;

(h5) nhóm aryl; hoặc

(h6) nhóm aryl có, ở trong vòng, từ 1 đến 5 nhóm thế mà có thể giống hoặc khác nhau và được chọn từ (a) nguyên tử halogen, (b) nhóm xyano, (c) nhóm nitro, (d) nhóm formyl, (e) nhóm (C₁-C₆) alkyl, (f) nhóm halo (C₁-C₆) alkyl, (g) nhóm (C₁-C₆) alkoxy, (h) nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy, (i) nhóm (C₃-C₆) xycloalkyl (C₁-C₆) alkoxy, (j) nhóm (C₁-C₆) alkylthio, (k) nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio, (l) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (m) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (n) nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (o) nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl, (p) nhóm (C₁-C₆) alkylcacbonyl, (q) nhóm cacboxyl và (r) nhóm (C₁-C₆) alkoxycacbonyl),

mỗi mũi tên là liên kết vào vòng 4H-pyrollopyridin,

m là 0, 1 hoặc 2; và

Et đại diện cho nhóm etyl)},

hoặc muối của nó.

2. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm hợp chất 4H-pyrollopyridin hoặc muối theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.

3. Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, bao gồm bước xử lý cây hoặc đất với thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt bao gồm hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối của nó theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.
4. Phương pháp kiểm soát các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt, bao gồm cho các loài gây hại trong nông nghiệp và trồng trọt tiếp xúc với lượng hữu hiệu thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt được xác định theo điểm 2.
5. Tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật bao gồm hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.
6. Phương pháp kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật, bao gồm cho vật ngoại ký sinh trên động vật tiếp xúc với lượng hữu hiệu của tác nhân kiểm soát vật ngoại ký sinh trên động vật theo điểm 5.
7. Hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 1, trong đó nhóm aryl là nhóm hydrocacbon thơm chứa 6 đến 10 nguyên tử cacbon
8. Hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 7, trong đó nhóm aryl được chọn từ nhóm chỉ bao gồm nhóm phenyl, nhóm 1-naphthyl và nhóm 2-naphthyl.
9. Hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 7, trong đó nhóm aryl là nhóm phenyl.
10. Hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 1, trong đó nhóm dị vòng là nhóm thơm đơn vòng 5 hoặc 6 cạnh hoặc nhóm dị vòng không thơm đơn vòng 4 đến 6 cạnh có chứa, dưới dạng nguyên tử vòng, một hoặc nhiều nguyên tử cacbon và 1 đến 4 dị nguyên tử được chọn từ nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh và nguyên tử nitơ, hoặc nhóm dị vòng thơm ngưng tụ được tạo thành bằng cách ngưng tụ dị vòng thơm đơn vòng với vòng benzen; và nhóm dị vòng thơm ngưng tụ được tạo thành bằng cách ngưng tụ vòng thơm đơn vòng như vậy với vòng benzen.
11. Hợp chất 4H-pyrrolopyridin hoặc muối theo điểm 10, trong đó nhóm dị vòng là nhóm dị vòng thơm.

12. Hợp chất 4H-pyrolOPYRIDIN hoặc muối theo điểm 11, trong đó nhóm dị vòng thơm được chọn từ nhóm chỉ bao gồm furyl, thienyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl và triazinyl; và các nhóm dị vòng thơm ngưng tụ như quinolyl, isoquinolyl, quinazolyl, quinoxalyl, benzofuranyl, benzothienyl, benzoxazolyl, benzisoxazolyl, benzothiazolyl, benzimidazolyl, benzotriazolyl, indolyl, indazolyl, pyrrolopyrazinyl, imidazopyridinyl, imidazopyrazinyl, pyrazolopyridinyl, pyrazolothienyl và pyrazolotriazinyl.

13. Hợp chất 4H-pyrolOPYRIDIN hoặc muối theo điểm 10, trong đó nhóm dị vòng là nhóm dị vòng không thơm.

14. Hợp chất 4H-pyrolOPYRIDIN hoặc muối theo điểm 13, trong đó nhóm dị vòng không thơm được chọn từ nhóm chỉ bao gồm oxetanyl, thietanyl, azetidiny, pyrrolidinyl, pyrrolidinyl-2-on, piperidinyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, piperazinyl, hexametyleneiminyl, 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, pyranyl, tetrahydropyranyl, thiopyranyl, tetrahydrothiopyranyl, 1-oxit tetrahydrothiopyranyl, 1,1-dioxit tetrahydrothiopyranyl, tetrahydrofuranyl, dioxanyl, pyrazolidinyl, pyrazolinyl, tetrahydropyrimidinyl, dihydrotriazolyl và tetrahydrotriazolyl.

15. Hợp chất 4H-pyrolOPYRIDIN hoặc muối theo điểm 1, trong đó nhóm dị vòng được chọn từ nhóm chỉ bao gồm isoxazolyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridyl, pyrazolyl, thiazoyl, thienyl, pyrrolyl, benzimidazolyl, benzofuranyl, benzothienyl và pyrrolidinyl-2-on.