



(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)



1-0035414

(51)^{2019.01} C07D 213/82; A01P 7/04; A01M 1/20; (13) B
A01N 43/40

(21) 1-2019-06583

(22) 25/04/2018

(86) PCT/JP2018/016844 25/04/2018

(87) WO/2018/199175 01/11/2018

(30) 2017-088847 27/04/2017 JP

(45) 25/04/2023 421

(43) 25/02/2020 383A

(73) ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (JP)

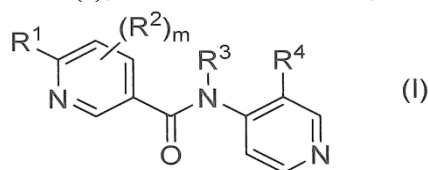
3-15, Edobori 1-chome, Nishi-ku, Osaka-shi, Osaka 5500002 (JP)

(72) YONEDA Tetsuo (JP); YOSHIDA Kotaro (JP); TAZAWA Yuta (JP); KANI Tatsuya (JP); CHO Yoko (JP); MURAI Yuto (JP).

(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) HỢP CHẤT N-(4-PYRIDYL)NICOTINAMIT HOẶC MUỐI CỦA NÓ, CHẤT PHÒNG NGỪA SINH VẬT GÂY HẠI VÀ PHƯƠNG PHÁP ĐỂ PHÒNG NGỪA SINH VẬT GÂY HẠI

(57) Mặc dù nhiều chất phòng ngừa sinh vật gây hại khác nhau đã được sử dụng trong nhiều năm qua, nhiều trong số các chất phòng ngừa sinh vật gây hại đó có rất nhiều vấn đề, như là sự hiệu quả chưa đủ, và giới hạn trong việc sử dụng của nó do tính kháng của các sinh vật gây hại, và hợp chất tương tự. Vì vậy, có mong muốn là phát triển chất phòng ngừa sinh vật gây hại mới ít có khả năng có các khuyết điểm đó. Một trong các mục tiêu của sáng chế là cung cấp hợp chất hoạt tính cao hoặc muối của nó để chống lại sinh vật gây hại. Sáng chế đề cập đến hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamit được biểu diễn bởi công thức (I) dưới đây (trong công thức (I), với mỗi nhóm thế, xem phần mô tả) hoặc muối của nó.



Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamit mới hoặc muối của nó. Ngoài ra, sáng chế đề cập đến chất phòng ngừa sinh vật gây hại, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, hoặc thuốc diệt sâu hại trong đất mà bao gồm hợp chất này hoặc muối của nó làm thành phần hoạt tính. Hơn nữa, sáng chế đề cập đến phương pháp phòng ngừa sinh vật gây hại bằng cách sử dụng lượng hữu hiệu hợp chất này hoặc muối của nó.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Tài liệu sáng chế 1 mô tả phạm vi rộng các hợp chất heteroarylamit cho các ứng dụng thuốc trừ sâu và tài liệu sáng chế 2 mô tả phạm vi rộng các hợp chất có khung pyridin cho các ứng dụng được phẩm. Bên cạnh đó, tài liệu sáng chế 3 mô tả phạm vi rộng các hợp chất heteroarylamit cho các ứng dụng được phẩm.

Danh sách tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: WO2002/070483

Tài liệu sáng chế 2: WO2005/115986

Tài liệu sáng chế 3: JP-A-2003-73357

Vấn đề cần giải quyết của sáng chế

Mặc dù số lượng lớn các chất phòng ngừa sinh vật gây hại đã được sử dụng trong nhiều năm qua, nhiều chất trong số các chất phòng ngừa sinh vật gây hại này có các vấn đề khác nhau như là hiệu quả và giới hạn sử dụng của nó chưa đủ do tính kháng của các sinh vật gây hại, và hợp chất tương tự. Vì vậy, có mong muốn là phát triển chất phòng ngừa sinh vật gây hại mới ít có khả năng có các khuyết điểm đó.

Mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất có hoạt tính cao hoặc muối của nó để chống lại sinh vật gây hại, đề xuất chất phòng ngừa sinh vật gây hại, thuốc trừ sâu

dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, hoặc thuốc diệt sâu hại trong đất mà sử dụng hợp chất hoặc muối của nó, và đề xuất phương pháp phòng ngừa sinh vật gây hại bằng cách sử dụng hợp chất hoặc muối của nó.

Ngẫu nhiên là, các hợp chất được mô tả trong tài liệu sáng chế 1 và các hợp chất được mô tả trong tài liệu sáng chế 2 là khác với các hợp chất của sáng chế. Ngoài ra, trong tài liệu sáng chế 3, chỉ có phần mô tả chi tiết của hợp chất mà R^4 là nguyên tử hydro trong công thức (I) được mô tả dưới đây.

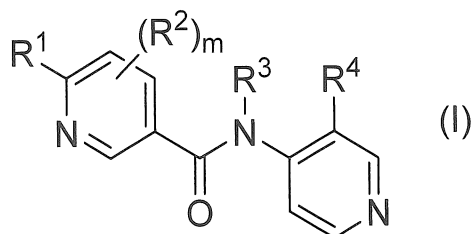
Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Giải quyết vấn đề

Để tìm ra chất phòng ngừa sinh vật gây hại ưu việt hơn, các tác giả sáng chế đã nghiên cứu chuyên sâu các hợp chất pyridin. Kết quả là, đã phát hiện ra là hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamit mới hoặc muối của nó có hiệu quả phòng ngừa rất cao các sinh vật gây hại ở liều thấp.

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

[1] Hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamit được biểu diễn bởi công thức (I):



trong đó R^1 là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, amino, monoalkylamino, dialkylamino, aryloxy, xyno, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, haloalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxy carbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, xycloalkylcarbonyl, alkoxy carbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl;

m là số nguyên từ 0 đến 3; và

các R^2 có thể giống hoặc khác nhau khi có nhiều R^2 , hoặc muối của nó.

[2] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, monoalkylamino, dialkylamino, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl; và

m là 0 hoặc 1.

[3] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, alkoxy, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl; và

m là 0 hoặc 1.

[4] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, monoalkylamino, dialkylamino, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nitơ, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl; và

m là 0 hoặc 1.

[5] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, alkoxy, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nitơ, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl; và

m là 0 hoặc 1.

[6] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, hoặc haloalkoxy;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, amino, monoalkylamino, hoặc dialkylamino;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, xycloalkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl;

m là số nguyên từ 0 đến 3; và

Các R^2 có thể giống hoặc khác nhau khi có nhiều R^2 .

[7] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, hoặc haloalkoxy;

R^2 là alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, monoalkylamino, hoặc dialkylamino;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkoxycarbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl; và

m là 0 hoặc 1.

[8] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là alkyl, haloalkyl, hoặc haloalkoxy;

R^2 là alkyl, haloalkyl, hoặc amino;

R^3 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkoxy, alkoxycarbonyl, hoặc pyrazolyl;

và

m là 0 hoặc 1.

[9] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục từ 1 đến 8 ở trên, trong đó, trong công thức (I),

R^1 là haloalkyl; R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, hoặc alkoxy; R^4 là alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl; và m là 0.

[10] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^1 là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl.

[11] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [1] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^1 là alkyl, haloalkyl, hoặc haloalkoxy.

[12] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], [10], hoặc [11] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl.

[13] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1] và từ [10] đến [12] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^2 là alkyl, haloalkyl, hoặc amino.

[14] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], từ [10] đến [13], trong đó, trong công thức (I), R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, alkoxy, hoặc alkoxy carbonyl.

[15] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], từ [10] đến [14], trong đó, trong công thức (I), R^3 là nguyên tử hydro hoặc alkyl.

[16] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], từ [10] đến [15], trong đó, trong công thức (I), R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkyl carbonyl, alkoxy carbonyl, (alkylthio) carbonyl, hoặc pyrazolyl.

[17] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], từ [10] đến [16], trong đó, trong công thức (I), R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkoxy, alkoxy carbonyl, (alkylthio) carbonyl, hoặc pyrazolyl.

[18] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục [1], từ [10] đến [17], trong đó, trong công thức (I), m là 0 hoặc 1.

[19] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [6] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^1 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, hoặc haloalkoxy; R^2 là alkyl, haloalkyl, alkoxy, amino, monoalkylamino, hoặc dialkylamino; R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, alkoxyalkyl, alkyl carbonyl, hoặc alkoxy carbonyl; R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkoxy carbonyl, (alkylthio) carbonyl, hoặc pyrazolyl; và m là 0 hoặc 1.

[20] Hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục [6] ở trên, trong đó, trong công thức (I), R^1 là alkyl, haloalkyl, hoặc haloalkoxy; R^2 là alkyl, haloalkyl, hoặc amino; R^3 là nguyên tử hydro hoặc alkyl; R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkoxy, alkoxy carbonyl, hoặc pyrazolyl; và m là 0 hoặc 1.

[21] Chất phòng ngừa sinh vật gây hại bao gồm hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [20] ở trên như thành phần hoạt tính.

[22] Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, hoặc thuốc diệt sâu hại trong đất bao gồm hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [20] ở trên như thành phần hoạt tính.

[23] Thuốc trừ sâu nông nghiệp bao gồm hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [20] ở trên như thành phần hoạt tính.

[24] Phương pháp để phòng ngừa sinh vật gây hại bằng cách sử dụng lượng hữu hiệu hợp chất hoặc muối của nó như được mô tả theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [20] ở trên.

Hiệu quả đạt được của sáng chế

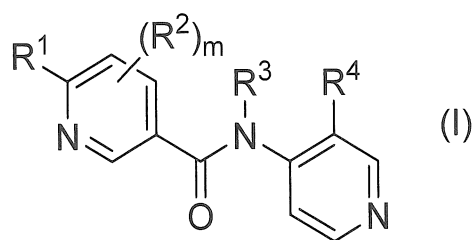
Chất phòng ngừa sinh vật gây hại bao gồm hợp chất được biểu diễn bởi công thức (I) ở trên hoặc muối của nó có hiệu quả kiểm soát rất cao chống lại các sinh vật gây hại ở liều thấp.

Mô tả chi tiết phương án thực hiện sáng chế

Ở dưới đây, sáng chế được mô tả chi tiết, nhưng chúng chỉ đơn thuần thể hiện các ví dụ được ưu tiên và sáng chế không nên được hiểu là được giới hạn ở đó.

Ngẫu nhiên là, trong phần mô tả sáng chế, “Cn” (n là số tự nhiên) có ý nghĩa giống như “số cacbon n” (n là số tự nhiên). Khi “ppm” được mô tả cho nồng độ, nó nghĩa là “ppm theo trọng lượng”.

Sáng chế đề cập đến hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamit được biểu diễn bởi công thức (I) dưới đây:



trong đó R^1 là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aryloxy, hoặc haloalkylaryl;

R^2 là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, amino, monoalkylamino, dialkylamino, aryloxy, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R^3 là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, haloalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylcarbonyl, hoặc alkoxy carbonyl;

R^4 là nguyên tử halogen, nitơ, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, xycloalkylcarbonyl, alkoxy carbonyl, (alkylthio)carbonyl, hoặc pyrazolyl;

m là số nguyên từ 0 đến 3; và

các R^2 có thể giống hoặc khác nhau khi có nhiều R^2 ,

hoặc muối của nó (ở dưới đây, trong một số trường hợp, tất cả chúng được gọi là “hợp chất của sáng chế”).

Là Khi nguyên tử halogen hay halogen là nhóm thế trong công thức (I) ở trên, mỗi nguyên tử flo, clo, brom, hoặc iot có thể được đề cập đến. Số lượng nguyên tử halogen là nhóm thế có thể là 1 hoặc 2 hoặc nhiều hơn. Trong trường hợp 2 hoặc nhiều hơn, các nguyên tử halogen riêng lẻ có thể giống hoặc khác nhau. Ngoài ra, vị trí thế của nguyên tử halogen có thể là bất kỳ vị trí nào.

Ngẫu nhiên là, “haloalkyl” được sử dụng trong phần mô tả sáng chế nghĩa là alkyl có ít nhất một nguyên tử hydro của nó được thế bởi (nhiều) nguyên tử halogen. Tương tự, “haloalkoxy”, “haloalkylaryl” và “haloalkylcarbonyl” nghĩa là alkoxy, alkylaryl và alkylcarbonyl có ít nhất một nguyên tử hydro của mỗi nhóm được thế bởi (nhiều) nguyên tử halogen, một cách tương ứng. Nguyên tử halogen thế cho nguyên tử hydro trong haloalkyl, haloalkoxy, haloalkylaryl hoặc haloalkylcarbonyl này được đề cập đến như “halogen là nhóm thế”.

Các ví dụ về alkyl hoặc phần alkyl trong công thức (I) ở trên bao gồm các nhóm C₁-C₆ mạch thẳng hoặc mạch nhánh như là methyl, ethyl, propyl thông thường, isopropyl, butyl thông thường, isobutyl, butyl bậc hai, butyl bậc ba, pentyl thông thường, isopentyl, neopentyl, hexyl thông thường, hoặc neohexyl.

Các ví dụ về alkenyl hoặc phần alkenyl trong công thức (I) ở trên bao gồm các nhóm C₂-C₆ mạch thẳng hoặc mạch nhánh như là vinyl, 1-propenyl, 2-propenyl, isopropenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 2-methyl-2-butenyl, 1-hexenyl, hoặc 2,3-dimethyl-2-butenyl.

Các ví dụ về alkynyl hoặc phần alkynyl trong công thức (I) ở trên bao gồm các nhóm C₂-C₆ mạch thẳng hoặc mạch nhánh như là etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, 3-butylnyl, 1-methyl-2-propynyl, 2-methyl-3-butylnyl, 3,3-dimethyl-1-butylnyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, hoặc 5-hexynyl.

Các ví dụ về cycloalkyl hoặc phần cycloalkyl trong công thức (I) ở trên bao gồm các nhóm C₃-C₆ như là cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, hoặc cyclohexyl.

Các ví dụ về aryl hoặc phần aryl trong công thức (I) ở trên bao gồm các nhóm C₆-C₁₀ như là phenyl và naphthyl.

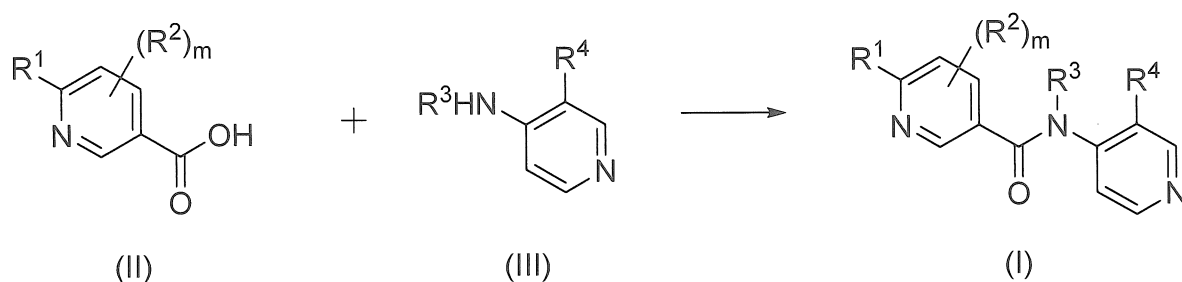
Khi muối của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (I) ở trên, có thể bao gồm muối bất kỳ miễn là chúng có thể được chấp nhận trong lĩnh vực kỹ thuật được đề cập. Các ví dụ về nó bao gồm các muối amoni như là dimetylamoni và trietylamoni; các muối vô cơ như là hydroclorit, peclorat, sulfat, và nitrat; các muối hữu cơ như là axetat, trifloaxetat, oxalat, p-toluensulfonat, và metansulfonat; và hợp chất tương tự hợp chất tương tự.

Có trường hợp mà các đồng phân như là các đồng phân quang học có thể được thể hiện là hợp chất của sáng chế, và cả các đồng phân riêng lẻ và hỗn hợp đồng phân được bao gồm trong hợp chất của sáng chế. Trong phần mô tả sáng chế, các đồng phân được mô tả như là hỗn hợp trừ phi được trình bày cụ thể. Ngẫu nhiên là, trong phạm vi kiến thức kỹ thuật chung trong lĩnh vực kỹ thuật được đề cập, các đồng phân khác nhau khác với các đồng phân ở trên cũng được bao gồm trong hợp chất của sáng chế. Ngoài ra, phụ thuộc vào loại đồng phân, có trường hợp mà chúng có cấu trúc hóa học khác với cấu trúc hóa học của hợp chất của sáng chế nhưng, do người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật có thể đủ nhận biết là chúng trong sự liên quan đến đồng phân, rõ ràng là chúng nằm trong phạm vi sáng chế.

Hợp chất của sáng chế có thể được tạo ra theo các phương pháp sản xuất dưới đây và các phương pháp sản xuất thông thường của các muối, nhưng các phương pháp không được giới hạn với các phương pháp này.

Phương pháp sản xuất [1]

Hợp chất được biểu diễn bởi công thức (I) ở trên có thể được tạo ra bởi phản ứng của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II) dưới đây với hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III) dưới đây khi có mặt chất ngưng tụ tách nước hoặc bazơ. Ngẫu nhiên là, các sản phẩm có mặt trên thị trường có thể được sử dụng làm hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II) dưới đây và hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III) dưới đây, và các hợp chất cũng có thể được sản xuất bởi các phương pháp đã biết.



Trong công thức của phương pháp sản xuất [1], R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , và m là như đề cập ở trên.

Chất ngưng tụ tách nước được giới hạn cụ thể không được giới hạn cụ thể nhưng các ví dụ về nó bao gồm 1-etyl-3-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimide hydroclorid, 1,3-dicyclohexylcarbodiimide, O-(7-azabenzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium hexafluorophosphat, và hợp chất tương tự.

Phản ứng có thể được thực hiện nhờ bổ sung các chất phụ gia, như yêu cầu. Các ví dụ về chất phụ gia bao gồm 1-hydroxybenzotriazol, N-hydroxysuccinimide, N,N-dimethyl-4-aminopyridin, và hợp chất tương tự.

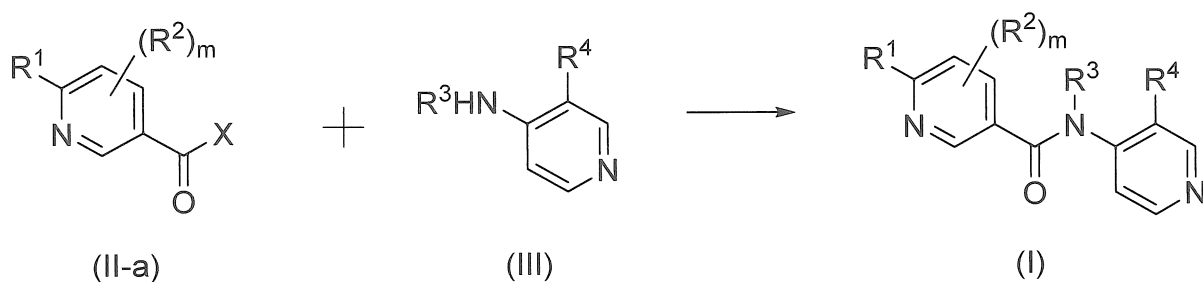
Bazơ không được giới hạn cụ thể nhưng các ví dụ về nó bao gồm các amin bậc ba như là triethylamin, 4-methylmorpholin, và diisopropyletylamin, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undecen, pyridin, 4-(dimethylamino)pyridin, 2,6-lutidin, và hợp chất tương tự.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt dung môi, như yêu cầu. Dung môi không được giới hạn cụ thể nhưng, ví dụ, ở đây có thể là một hoặc hai dung môi được sử dụng hoặc nhiều hơn được lựa chọn hợp lý từ các ete như là diethyl ete, butyl methyl ete, tetrahydrofuran, etylen glycol dimethyl ete, 1,4-dioxan, và dimethoxyetan; các hydrocarbon béo được halogen hóa như là metylen clorua, dicloetan, và cloroform; các hydrocarbon thơm như là benzen, toluen, xylen, và clobenzen; các dung môi phân cực không proton như là N,N-dimethylformamid, N,N-dimethylacetamid, N-methyl-2-pyrrolidon, dimethyl sulfoxide, và sulfolan; các nitril như là axetonitril và propionitril; các este như là etyl axetat và etyl propionat; các hydrocarbon béo như là pentan, hexan, heptan, octan, và cyclohexan; các keton như là axeton và etyl methyl keton; nước; và hợp chất tương tự hoặc hỗn hợp của nó có thể được sử dụng.

Về phần nhiệt độ phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ mà tại đó hệ thống phản ứng được hồi lưu bởi sự đun nóng. Về phần thời gian phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong vài phút đến 24 tiếng.

Phương pháp sản xuất [2]

Hợp chất được biểu diễn bởi công thức (I) ở trên có thể được sản xuất bởi phản ứng của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II-a) dưới đây với hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III) dưới đây khi có mặt bazơ.



Trong công thức của phương pháp sản xuất [2], R¹, R², R³, R⁴, và m là như được đề cập ở trên; X là nguyên tử halogen.

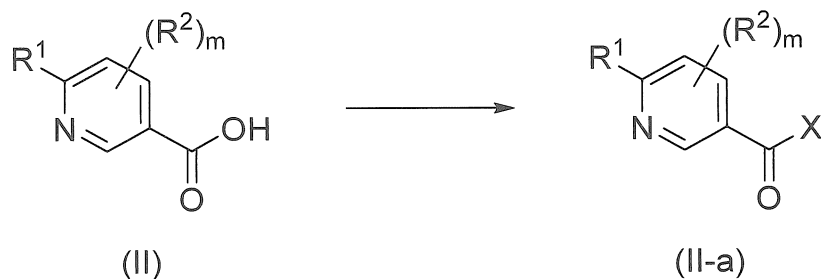
Bazơ có thể là bazơ hữu cơ hoặc bazơ vô cơ. Bazơ hữu cơ không được giới hạn cụ thể nhưng ví dụ của nó bao gồm các bazơ amin như là trietylamin và diisopropyletylamin. Bazơ vô cơ không được giới hạn cụ thể nhưng các ví dụ về nó bao gồm các muối carbonat kim loại kiềm như là natri carbonat, kali carbonat, và xesi carbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt dung môi, như yêu cầu. Dung môi không được giới hạn cụ thể nhưng, ví dụ, ở đây có thể là một hoặc hai dung môi được sử dụng hoặc nhiều hơn được lựa chọn hợp lý từ các ete như là dietyl ete, butyl metyl ete, tetrahydrofuran, etylen glycol dimetyl ete, 1,4-dioxan, và dimetoxyetan; các hydrocarbon béo được halogen hóa như là metylen clorua, dicloetan, và cloroform; các hydrocarbon thơm như là benzen, toluen, xylen, và clobenzen; các dung môi phân cực không proton như là N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylxetamit, N-metyl-2-pyrrolidon, dimetyl sulfoxit, và sulfolan; các nitril như là axetonitril và propionitril; các este như là etyl axetat và etyl propionat; các hydrocarbon béo như là pentan, hexan,

heptan, octan, và xyclohexan; các keton như là axeton và etyl metyl keton; nước; và hợp chất tương tự, hoặc hỗn hợp của nó có thể được sử dụng.

Về phần nhiệt độ phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ mà tại đó hệ thống phản ứng được hồi lưu bởi sự đun nóng. Về phần thời gian phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong vài phút đến 24 tiếng.

Sản phẩm có thể thương mại được có thể được sử dụng như hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II-a) ở trên, và ngoài ra hợp chất có thể được sản xuất bởi phản ứng của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II) ở trên với tác nhân halogen hóa như được biểu diễn trong công thức dưới đây.



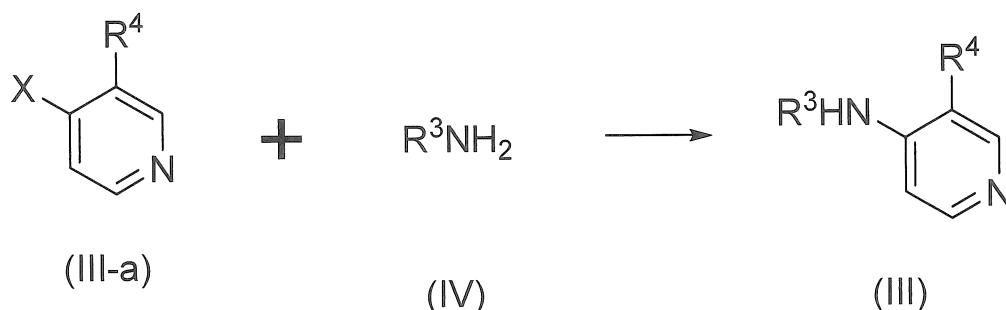
Trong công thức của phương pháp sản xuất của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (II-a) ở trên, R¹, R², X, và m là như được đề cập ở trên.

Tác nhân halogen hóa không được giới hạn cụ thể nhưng các ví dụ về nó bao gồm thionyl clorua, oxalyl clorua, phosphoryl clorua, sulfuryl clorua, phospho triclorea, phospho pentaclorua, và hợp chất tương tự.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt dung môi, như yêu cầu. Dung môi không được giới hạn cụ thể nhưng, ví dụ, ở đây có thể là một hoặc hai dung môi được sử dụng hoặc nhiều hơn được lựa chọn hợp lý từ các ete như là dietyl ete, butyl metyl ete, tetrahydrofuran, etylen glycol dimetyl ete, 1,4-dioxan, và dimetoxietan; các hydrocarbon béo được halogen hóa như là metylen clorua, dicloetan, và cloroform; các hydrocarbon thơm như là benzen, toluen, xylen, và clobenzen; các dung môi phân cực không proton như là N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit, N-metyl-2-pyrrolidon, dimetyl sulfoxit, và sulfolan; các nitril như là axetonitril và propionitril; các este như là etyl axetat và etyl propionat; các hydrocarbon béo như là pentan, hexan, heptan, octan, và xyclohexan; các keton như là axeton và etyl metyl keton; và hợp chất tương tự, hoặc hỗn hợp của nó có thể được sử dụng.

Về phần nhiệt độ phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ mà tại đó hệ thống phản ứng được hồi lưu bởi sự đun nóng. Về phần thời gian phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong vài phút đến 24 tiếng.

Hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III) ở trên có thể được sản xuất bởi phản ứng của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III-a) dưới đây với hợp chất được biểu diễn bởi công thức (IV) dưới đây. Các sản phẩm có mặt trên thị trường có thể được sử dụng như hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III-a) dưới đây và hợp chất được biểu diễn bởi công thức (IV) dưới đây, và các hợp chất cũng có thể được sản xuất bởi các phương pháp đã biết.



Trong công thức của phương pháp sản xuất của hợp chất được biểu diễn bởi công thức (III) ở trên, R³, R⁴, và X là như đề cập ở trên.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt bazơ, như yêu cầu. Các ví dụ về bazơ bao gồm hydrid kim loại kiềm như là natri hydrua; các muối carbonat kim loại kiềm như là natri carbonat, kali carbonat, và xesi carbonat; các hydroxit kim loại kiềm như là lithi hydroxit, natri hydroxit, và kali hydroxit; amin bậc ba như là trietylamin, 4-metylmorpholin, và diisopropyletylamin; 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undecen, pyridin, 4-(dimethylamino)pyridin, 2,6-lutidin, và hợp chất tương tự.

Phản ứng có thể được thực hiện khi có mặt dung môi, như yêu cầu. Dung môi không được giới hạn cụ thể nhưng, ví dụ, ở đây có thể là một hoặc hai dung môi được sử dụng hoặc nhiều hơn được lựa chọn hợp lý từ các ete như là dietyl ete, butyl methyl ete, tetrahydrofuran, etylen glycol dimetyl ete, 1,4-dioxan, và dimetoxietan; các hydrocarbon béo được halogen hóa như là metylen clorua, dicloetan, và cloroform; các hydrocarbon thơm như là benzen, toluen, xylen, và clobenzen; các dung môi phân cực không proton như là N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit, N-metyl-2-pyrrolidon, dimetyl sulfoxit, và sulfolan; các nitril như là axetonitril và propionitril; các

este như là etyl axetat và etyl propionat; các hydrocarbon béo như là pentan, hexan, heptan, octan, và xyclohexan; các keton như là axeton và etyl metyl keton; nước; và hợp chất tương tự, hoặc hỗn hợp của nó có thể được sử dụng.

Về phần nhiệt độ phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ mà tại đó hệ thống phản ứng được hồi lưu bởi sự đun nóng. Về phần thời gian phản ứng, phản ứng có thể thường được thực hiện trong vài phút đến 24 tiếng.

Các phương án được ưu tiên của chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính sẽ được mô tả dưới đây.

Chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính hữu ích, ví dụ, như các chất phòng ngừa các sinh vật gây hại, ve, giun tròn, hoặc các sinh vật gây hại trong đất vốn là vấn đề trong lĩnh vực nông nghiệp và trồng trọt, cụ thể, các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, hoặc các thuốc diệt sâu hại trong đất và vân vân. Ngoài ra, các tác nhân hữu ích như các chất dùng cho các sinh vật ký sinh ở động vật, cụ thể, các tác nhân tiêu diệt sinh vật ký sinh ở động vật.

Các hợp chất của sáng chế là hữu ích để phòng ngừa các sinh vật gây hại, ví dụ, các loài rệp vừng như là rệp vừng đào xanh (*Myzus persicae*) và rệp vừng bông (*Aphis gossypii*); các sinh vật gây hại nông nghiệp như là sâu tơ (*Plutella xylostella*), sâu keo cải bắp (*Mamestra brassicae*), sâu ngài đêm thông thường (*Spodoptera litura*), bướm đêm Codling (*Laspeyresia pomonella*), sâu tai ngô (*Heliothis zea*), sâu ăn chồi thuốc lá (*Heliothis virescens*), bướm đêm Gypsy (*Lymantria dispar*), sâu cuốn lá lúa (*Cnaphalocrocis medinalis*), bướm sâu cuốn lá chè nhỏ hơn (*Adoxophyes honmai*), bọ cánh cứng khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), bọ cánh cứng lá bí (*Aulacophora femoralis*), một quả nang (*Anthonomus grandis*), rầy như là rầy nâu (*Nilaparvata lugens*), rầy xanh, rệp vảy, bọ xít, bọ cánh phấn như là bọ cánh phấn khoai lang (*Bemisia tabaci*), bọ trĩ, châu chấu, ruồi Anthomyiid, bọ hung Scarabaeidae, sâu ngài đêm đen (*Agrotis ipsilon*), sâu ngài đêm củ cải (*Agrotis segetum*), và kiến; các loài chân bụng như là sên lãi và ốc sên; các sinh vật gây hại vệ sinh như là ve chuột nhiệt đới (*Ornithonyssus bacoti*), gián, ruồi nhà (*Musca domestica*), và muỗi nhà thông thường (*Culex pipiens*); các sinh vật gây hại các hạt được bảo quản như là bướm hạt

angoumois (*Sitotroga cerealella*), mọt đậu đỏ (*Callosobruchus chinensis*), bọ cánh cứng phân đỏ (*Tribolium castaneum*), và các loài sâu bột; các sinh vật gây hại trong nhà như là bướm áo (*Tinea translucens*), bọ cánh cứng đục gỗ đen (*Attagenus unicolor*), và mối; và hợp chất tương tự, ve, ví dụ, các loài ve ký sinh ở thực vật như là nhện ve hai đốm (*Tetranychus urticae*), nhện ve đỏ (*Tetranychus cinnabarinus*), nhện ve vàng (*Tetranychus kanzawai*), nhện đỏ (*Panonychus citri*), nhện đỏ châu Âu (*Panonychus ulmi*), nhện trắng (*Polyphagotarsonemus latus*), nhện rỉ sắt cam hồng (*Aculops pelekassi*), và nhện hành tỏi (*Rhizoglyphus echinopus*); mạt bụi nhà như là mạt bụi (*Tyrophagus putrescentiae*), *Dermatophagoides farinae*, và *Chelacaropsis moorei*; và hợp chất tương tự, giun tròn, ví dụ, giun tròn ký sinh ở thực vật như là giun tròn ở rễ cây, giun tròn nang, giun tròn nốt sần vùng rễ cây, giun tròn ở ngọn cây lúa (*Aphelenchoides besseyi*), giun tròn ở chồi dâu tây (*Nothotylenchus acris*), và giun tròn trong gỗ thông (*Bursaphelenchus lignicolus*); và hợp chất tương tự, các sinh vật gây hại trong đất, ví dụ, các loài chân giống như là mối (*Armadillidium vulgare*) và rận gỗ (*Porcellio scaber*); và hợp chất tương tự.

Chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính là đặc biệt hiệu quả trong việc phòng ngừa các loài ve ký sinh ở thực vật, các sinh vật gây hại nông nghiệp, giun tròn ký sinh ở thực vật, và hợp chất tương tự. Trong số chúng, các hợp chất biểu hiện hiệu quả xuất sắc hơn trong việc phòng ngừa các loài ve ký sinh ở thực vật và các sinh vật gây hại nông nghiệp, nên các hợp chất này rất hữu ích như là thuốc trừ sâu và thuốc diệt ve.

Hơn nữa, các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, và các thuốc diệt sâu hại trong đất mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính cũng hiệu quả trong việc phòng ngừa các sinh vật gây hại khác nhau mà có tính kháng các chất hóa học như là các chất phospho hữu cơ, các chất carbamat, các chất pyrethroid tổng hợp, các chất neonicotinoid và vân vân.

Ngoài ra, các hợp chất của sáng chế có các tính chất ảnh hưởng đến toàn thân, và vì vậy, bằng cách sử dụng các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, hoặc các thuốc diệt sâu hại trong đất mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính để xử lý đất, các sinh vật

gây hại trong đất, ve, giun tròn, các loài chân bụng, và các loài chân giống và, cùng lúc đó, các sinh vật gây hại lá có thể được phòng ngừa.

Như là các phương án ưu tiên khác của chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính, có thể có các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, và các thuốc diệt sâu hại trong đất đã được đề cập mà phòng ngừa hết nhóm các loài ve ký sinh ở thực vật, các sinh vật gây hại nông nghiệp, giun tròn ký sinh ở thực vật, các loài chân bụng, các sinh vật gây hại trong đất đã được mô tả ở trên, và hợp chất tương tự.

Chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính thường được tạo ra bằng cách trộn hợp chất với các chất phụ gia khác nhau và được sử dụng theo hình thức chế phẩm như là bụi, hạt, các hạt phân tán trong nước, bột thấm nước, dịch cô đặc huyền phù chủ yếu là nước, dịch cô đặc huyền phù chủ yếu là dầu, hạt có thể hòa tan trong nước, bột có thể hòa tan trong nước, dịch cô đặc nhũ hóa, dịch cô đặc hòa tan, bột nhão, son khí, hoặc các chế phẩm có thể tích cực thấp. Tuy nhiên, miễn là nó thích hợp cho mục tiêu của sáng chế, nó có thể được điều chế theo bất kỳ dạng nào của chế phẩm vốn thường được sử dụng trong lĩnh vực kỹ thuật được đề cập này.

Các chất phụ gia được sử dụng cho chế phẩm bao gồm các chất mang rắn như là đất diatome, vôi phong hóa, canxi carbonat, đá tan, cacbon trắng, cao lanh, bentonit, caolinit, serixit, đất sét, natri carbonat, natri bicarbonat, mirabilit, zeolit, và tinh bột; các dung môi như là nước, toluen, xylen, dung môi naphtha, dioxan, axeton, isophoron, metyl isobutyl keton, clobenzen, xyclohexan, dimetyl sulfoxit, N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylaxetamit, N-metyl-2-pyrrolidon, và rượu; các chất hoạt động bề mặt anion như là các muối của axit béo, benzoat, alkylsulfosuccinat, dialkylsulfosuccinat, polycacboxylat, các muối của este của axit alkylsulfuric, alkyl sulfat, alkylaryl sulfat, alkyl diglycol ete sulfat, các muối của este của axit rượu sulfuric, alkylsulfonat, alkylarylsulfonat, arylsulfonat, lignin sulfonat, alkylidiphenyl ete disulfonat, polystyren sulfonat, các muối của este của axit alkylphosphoric, alkylaryl phosphat, styrylaryl phosphat, các muối của este của axit polyoxyetylen alkyl ete sulfuric, polyoxyetylen alkylaryl ete sulfat, các muối của este của axit polyoxyetylen alkylaryl ete sulfuric, polyoxyetylen alkyl ete phosphat, các muối của este của axit

polyoxyetylen alkylaryl phosphoric, và các muối ngưng tụ của naphtalen sulfonat với formaldehyt; các chất hoạt động bề mặt không phân ly ion như là este của axit béo sorbitan, este của axit béo glyxerin, axit béo polyglyxerit, ete polyglycol của rượu axit béo, axetylen glycol, rượu axetylen, polyme chặn oxyalkylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkylaryl ete, polyoxyetylen styrylaryl ete, polyoxyetylen glycol alkyl ete, polyetylen glycol, este của axit béo polyoxyetylen, este của axit béo polyoxyetylen sorbitan, este của axit béo polyoxyetylen glyxerin, dầu thầu dầu được hydro hóa polyoxyetylen, và este của axit béo polyoxypropylen; và các dầu thực vật và dầu khoáng như là dầu ôliu, dầu bông gạo, dầu thầu dầu, dầu cọ, dầu hoa trà, dầu dừa, dầu vừng, dầu ngô, dầu cám gạo, dầu lạc, dầu hạt bông, dầu đậu nành, dầu hạt cải, dầu hạt lanh, dầu trẩu, và dầu parafin; và hợp chất tương tự.

Về phần các thành phần của các chất phụ gia này, một hoặc hai hoặc nhiều hơn có thể có thể được lựa chọn hợp lý để sử dụng, miễn là mục tiêu của sáng chế bằng cách đây có thể được hoàn thành. Ngoài ra, ngoài các chất phụ gia được mô tả ở trên, một vài chất phụ gia có thể được lựa chọn hợp lý từ các chất phụ gia đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật được đề cập này, và được sử dụng. Ví dụ, các chất phụ gia khác nhau mà thường được sử dụng, như là chất độn, chất cô đặc, chất chống lắng, chất chống đông, chất ổn định phân tán, chất giảm độc hại ở thực vật, và chất chống mốc cũng có thể được sử dụng.

Tỷ lệ pha trộn (tỷ lệ theo trọng lượng) của hợp chất của sáng chế với các chất phụ gia khác nhau là từ 0,001:99,999 đến 95:5, tốt nhất là từ 0,005:99,995 đến 90:10. Trong thực thể sử dụng chế phẩm này, nó có thể được sử dụng như trên, hoặc có thể được pha loãng đến nồng độ định trước với chất pha loãng như nước, như yêu cầu, được bổ sung với các chất phân tán khác nhau (chất hoạt động bề mặt, dầu thực vật, dầu khoáng, v.v.), và sau đó được sử dụng.

Việc sử dụng các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, và các thuốc diệt sâu hại trong đất mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính không thể được xác định thông thường, khi mà nó thay đổi phụ thuộc vào các điều kiện thời tiết, loại chế phẩm, thời gian sử dụng, vị trí sử dụng, các loại và mức độ bộc phát của các dịch bệnh và các sinh vật gây hại. Tuy nhiên, nó thường được sử dụng với nồng độ của thành phần hoạt tính

là từ 0,05 đến 800 000 ppm, tốt nhất là từ 0,5 đến 500 000 ppm, và liều của nó trên đơn vị diện tích là sao cho hợp chất của sáng chế là từ 0,05 đến 50 000 g, tốt nhất là từ 1 đến 30 000 g, trên hecta.

Ngoài ra, sáng chế cũng bao gồm phương pháp để phòng ngừa các sinh vật gây hại bằng các phương pháp sử dụng trên, đặc biệt là, phương pháp để phòng ngừa các sinh vật gây hại, ve, giun tròn hoặc các sinh vật gây hại trong đất vốn là vấn đề trong lĩnh vực nông nghiệp và trồng trọt, cụ thể là, phương pháp để phòng ngừa các loài ve ký sinh ở thực vật, các sinh vật gây hại nông nghiệp, hoặc giun tròn ký sinh ở thực vật.

Các chế phẩm khác nhau của các chất phòng ngừa sinh vật gây hại mà bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính hoặc các chế phẩm pha loãng của chúng có thể được sử dụng bằng các phương pháp sử dụng mà thường được sử dụng, như là làm phân tán (như là xịt, phun sương, phun mù, phân tán hạt, hoặc áp dụng lên bề mặt nước), áp dụng lên đất (như là trộn hoặc tưới), áp dụng lên bề mặt (như là phủ, phủ bụi, hoặc che), hoặc sử dụng môi được tẩm độc. Ngoài ra, có thể cho các súc vật trong nhà ăn thức ăn trong đó thành phần hoạt tính ở trên được pha trộn để bằng cách đây phòng ngừa sự bộc phát và sinh sôi của các sinh vật gây hại độc hại, cụ thể là các côn trùng độc hại, nhờ phân của các động vật. Ngoài ra, chất cũng có thể được sử dụng bằng phương pháp sử dụng được gọi là thể tích rất thấp. Trong phương pháp này, chất có thể bao gồm 100% thành phần hoạt tính.

Ngoài ra, các thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, và các thuốc diệt sâu hại trong đất bao gồm các hợp chất của sáng chế làm thành phần hoạt tính có thể được pha trộn với hoặc có thể được sử dụng trong sự kết hợp với các hóa chất nông nghiệp khác, phân bón, hoặc các chất giảm độc hại ở thực vật, và hợp chất tương tự, và trong trường hợp này, các hiệu quả hoặc hoạt động xuất sắc hơn đôi lúc có thể thu được. Các hóa chất nông nghiệp khác bao gồm thuốc diệt cỏ, thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt sâu hại trong đất, thuốc diệt nấm, chất kháng virus, chất thu hút côn trùng, kháng sinh, hoóc môn, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, và hợp chất tương tự. Đặc biệt là, chế phẩm thuốc trừ sâu, chế phẩm thuốc diệt ve, chế phẩm thuốc diệt giun tròn, hoặc chế phẩm thuốc diệt sâu hại trong đất mà có hợp chất của sáng chế vốn được trộn với hoặc được sử dụng trong sự kết hợp với một hoặc hai hoặc nhiều hơn các hợp chất có thành phần

hoạt tính của các hóa chất nông nghiệp khác có thể cải thiện khoảng sử dụng, thời gian sử dụng chất, các hoạt động phòng ngừa, và hợp chất tương tự đến các định hướng được ưu tiên. Hợp chất của sáng chế và các hợp chất hoạt tính của các hóa chất nông nghiệp khác có thể được điều chế riêng rẽ và chúng có thể được pha trộn để sử dụng tại thời điểm sử dụng, hoặc cả hai có thể được điều chế cùng nhau để sử dụng. Sáng chế cũng bao gồm chế phẩm thuốc trừ sâu, chế phẩm thuốc diệt ve, chế phẩm thuốc diệt giun tròn, hoặc chế phẩm thuốc diệt sâu hại trong đất này.

Các ví dụ về các hợp chất có thành phần hoạt tính (các tên thông thường, một vài tên vẫn trong giai đoạn sử dụng, hoặc các mã thử nghiệm của Hiệp hội bảo vệ thực vật Nhật Bản (Japan Plant Protection Association)) của các thuốc trừ sâu, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt giun tròn, hoặc các thuốc diệt sâu hại trong đất trong các hóa chất nông nghiệp khác được mô tả ở trên bao gồm:

các hợp chất phosphat hữu cơ chủ yếu là este như là profenofos, diclorvos, fenamiphos, fenitrothion, EPN (O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat), diazinon, clorpyrifos, clorpyrifos-metyl, axephat, prothiofos, fosthiazat, cadusafos, disulfoton, isoxathion, isofenphos, ethion, etrimfos, quinalphos, dimethylvinphos, dimetoat, sulprofos, thiometon, vamitothion, pyraclofos, pyridaphenthion, pirimiphos-metyl, propaphos, phosalon, formothion, malathion, tetraclovinphos, clorfenvinphos, xyanophos, triclofon, methidathion, phenthoat, ESP (oxydeprofos), azinphos-metyl, fenthion, heptenophos, metoxyclo, parathion, phosphocarb, demeton-S-metyl, monocrotophos, methamitophos, imicyafos, parathion-metyl, terbufos, phosphamiton, phosmet, phorat, phoxim, và triazophos;

các hợp chất carbamat như là carbaryl, propoxur, aldicarb, carbofuran, thiodicarb, metomyl, oxamyl, ethiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfan, benfuracarb, bendiocarb, furathiocarb, isoprocarb, metolcarb, xylylcarb, XMC (3,5-xylyl metylcarbamate), và fenothiocarb;

các dẫn xuất nereistoxin như là cartap, thiocyclam, bensultap, thiosultap-natri, thiosultap-dinatri, monosultap, bisultap, và thiocyclam hydrogen oxalat;

các hợp chất clo hữu cơ như là dicofol, tetradifon, endosulfan, dienoclor, và dieldrin;

các hợp chất kim loại hữu cơ như là fenbutatin oxit và xyhexatin;

các hợp chất pyrethroid như là fenvalerat, permetrin, xypermetrin, deltametrin, xyhalothrin, tefluthrin, ethofenprox, flufenprox, xyfluthrin, fenpropathrin, fluxythrinat, fluvalinat, xycloprothrin, lambda-xyhalothrin, pyrethrin, esfenvalerat, tetrametrin, resmetrin, protrifenbut, bifenthrin, zeta-xypermetrin, acrinathrin, alpha-xypermetrin, allethrin, gamma-xyhalothrin, theta-xypermetrin, tau-fluvalinat, tralometrin, profluthrin, beta-xypermetrin, beta-xyfluthrin, metofluthrin, phenothrin, flumetrin, và decametrin;

các hợp chất benzoylurea như là diflubenzuron, clorfluazuron, teflubenzuron, flufenoxuron, triflumuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, bistrifluron, và fluazuron;

các hợp chất giống hoóc môn kích thích như là metopren, pyriproxyfen, fenoxycarb, và diofenolan;

các hợp chất pyridazinon như là pyridaben;

các hợp chất pyrazol như là fenpyroximate, fipronil, tebufenpyrad, ethiprol, tolfenpyrad, axetoprol, pyrafluprol, và pyriprol;

các hợp chất neonicotinoid như là imidacloprid, nitenpyram, axetamiprid, thiacloprid, thiametoxam, clothianidin, nidinotefuran, dinotefuran, và nithiazin;

các hợp chất hydrazin như là tebufenozit, metoxyfenozit, chromafenozit, và halofenozit;

các hợp chất pyridin như là pyridalyl và flonicamit;

các hợp chất xyclic keto enol như là spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, và spiropidion;

các hợp chất strobilurin như là fluacrypyrim;

các hợp chất pyridinamito như là flufenerim;

các hợp chất dinitro, các hợp chất lưu huỳnh hữu cơ, các hợp chất ure, các hợp chất triazin, các hợp chất hydrazon, và, như các hợp chất khác, ở đây có thể là các hợp chất đã được đề cập như là flometoquin, buprofezin, hexythiazox, amitraz, clordimeform, silaflofen, triazamat, pymetrozin, pyrimidifen, clorfenapyr, indoxacarb, axequinocyl, etoxazol, cyromazin, 1,3-diclopropen, diafenthiuron, benclothiaz, bifenazat, propargit, clofentezin, metaflumizon, flubendiamit, xyflumetofen, clorantraniliprol, xyantraniliprol, xyclaniliprol, xyenopyrafen, pyrifluquinazon,

fenazaquin, amitoflomet, sulfluramit, hydrametylnon, metaldehyd, ryanodin, verbutin, clobenzoat, thiazolylcinnanonitril, sulfoxaflor, fluensulfon, triflumezopyrim, afidopyropen, flupyradifuron, fluxametamit, tetraniliprol, fluralaner, broflanilid, pyflubumid, diclomezotiaz, fluhexafon, tioxazafen, fluazaindolin, acynonapyr, benzpyrimoxan, oxazosulfyl, flupyrimin, và tyclopyrazoflor.

Ngoài ra, các hợp chất của sáng chế có thể được pha trộn với hoặc được sử dụng trong sự kết hợp với các hóa chất vi sinh nông nghiệp như là các độc tố protein tinh thể được tạo ra bởi *Bacillus thuringiensis* như là *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, hoặc *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, các tác nhân virus gây bệnh ở sâu bọ, các tác nhân nấm sợi gây bệnh ở côn trùng, và các tác nhân nấm sợi gây bệnh ở giun tròn; các thuốc kháng sinh và các thuốc kháng sinh bán tổng hợp như là avermectin, emamectin benzoat, milbemectin, milbemycin, spinosad, ivermectin, lepimectin, DE-175, abamectin, emamectin, và spinetoram; các sản phẩm tự nhiên như là azadirachtin và rotenon; các thuốc xua đuổi côn trùng như là deet; và hợp chất tương tự.

Các ví dụ về các hợp chất có thành phần hoạt tính (các tên thông thường, một vài tên vẫn trong giai đoạn sử dụng, hoặc các mã thử nghiệm của Hiệp hội bảo vệ thực vật Nhật Bản) của các thuốc diệt nấm trong các hóa chất nông nghiệp khác được mô tả ở trên bao gồm:

các hợp chất anilinopyrimidin như mepanipyrim, pyrimethanil, cyprodinil, và ferimzon;

các hợp chất triazolopyrimidine như 5-clo-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin;

các hợp chất pyridinamito như fluazinam;

các hợp chất azol như là triadimefon, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, myclobutanil, xyproconazol, tebuconazol, hexaconazol, furconazol-cis, procloraz, metconazol, epoxiconazol, tetraconazol, oxpoconazol fumarat, sipconazol, prothioconazol, triadimenol, flutriafol, difenoconazol, fluquinconazol, fenbuconazol, bromuconazol, diniconazol, tricyclazol, probenazol, simeconazol, pefurazoat, ipconazol, và imibenconazol;

các hợp chất quinoxalin như là quinomethionat;

các hợp chất dithiocarbamat như là maneb, zineb, mancozeb, polycarbamat, metiram, propineb, và thiram;

các hợp chất clo hữu cơ như là fthalit, clothalonil, và quintozen;

các hợp chất imidazol như là benomyl, xyazofamit, thiophanat-metyl, carbendazim, thiabendazol, và fuberiazol;

các hợp chất xyanoaxetamit như là xymoxanil;

các hợp chất anilit như là metalaxyl, metalaxyl-M, mefenoxam, oxadixyl, ofurace, benalaxyl, benalaxyl-M (tên khác: kiralaxyl hoặc chiralaxyl), furalaxyl, cyprofuram, carboxin, oxycarboxin, thifluzamit, boscalid, bixafen, isothianil, tiadinil, và sedaxan;

các hợp chất sulfamit như là diclofluanid;

các hợp chất đồng như là đồng (II) hydroxit và đồng oxin;

các hợp chất isoxazol như là hymexazol;

các hợp chất photpho hữu cơ như là fosetyl-Al, tolclofos-metyl, S-benzyl O, O-diisopropyl phosphorothioat, O-etyl S, S-diphenyl phosphorodithioat, nhôm etyl hydrogen phosphonat, edifenphos, và iprobenfos;

các hợp chất phthalimit như là captan, captafol, và folpet;

các hợp chất dicacboxyimit như là procymidon, iprodion, và vinclozolin;

các hợp chất benzanilit như là flutolanil và mepronil;

các hợp chất amit như là penthiopyrad, hỗn hợp 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(1RS,4SR,9RS)-1,2,3,4-tetrahydro-9-isopropyl-1,4-metanonaphtalen-5-yl]pyrazol-4-cacboxamit và 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(1RS,4SR,9SR)-1,2,3,4-tetrahydro-9-isopropyl-1,4-metanonaphtalen-5-yl]pyrazol-4-cacboxamit (isopyrazam), silthiopham, fenoxanil, và furametpyr;

các hợp chất benzamit như là flopyram và zoxamit;

các hợp chất piperadin như là triforin;

các hợp chất pyridin như là pyrifenox;

các hợp chất carbinol như là fenarimol;

các hợp chất piperidin như là fenpropidin;

các hợp chất morpholin như là fenpropimorph và tridemorph;

các hợp chất organotin như là fentin hydroxit và fentin axetat;

các hợp chất ure như là penxycuron;
 các hợp chất axit xinnamic như là dimetomorph và flumorph;
 các hợp chất phenylcarbamate như là diethofencarb;
 các hợp chất xyanopyrrol như là fludioxonil và fenpiclonil;
 các hợp chất strobilurin như là azoxystrobin, kresoxim-metyl, metominostrobin, trifloxystrobin, picoxystrobin, oryzastrobin, dimoxystrobin, pyraclostrobin, và floxastrobin;
 các hợp chất oxazolidinon như là famoxadon;
 các hợp chất thiazolcarboxamid như là ethaboxam;
 các hợp chất amit valin như là iprovalicarb và benthiavalicarb-isopropyl;
 các hợp chất axit acrylamino như là metyl N-(isopropoxycarbonyl)-L-valyl-(3RS)-3-(4-clophenyl)- β -alaninat (valiphenalat);
 các hợp chất imidazolinon như là fenamiton;
 các hợp chất hydroxylanilit như là fenhexamid;
 các hợp chất benzensulfonamid như là flusulfamid;
 các hợp chất oxim ete như là xyflufenamid;
 các hợp chất anthraquinon;
 các hợp chất axit crotonic;
 các thuốc kháng sinh như là validamycin, kasugamycin, và polyoxin;
 các hợp chất guanidin như là iminoctadin và dodin;
 các hợp chất quinolin như là 6-bậc ba butyl-8-flo-2,3-dimetylquinolin-4-yl axetat (tebufloquin);
 các hợp chất thiazolidin như là (Z)-2-(2-flo-5-(triflometyl)phenylthio)-2-(3-(2-metoxypheyl)thiazolidin-2-yliden)axetonitril (flutianil); và
 như các hợp chất khác, ở đây có thể là pyribencarb, isoprothiolan, pyroquilon, diclomezin, quinoxifen, propamocarb hydroclorua, clopicrin, dazomet, metam-natri, nicobifen, metrafenon, UBF-307, diclocymet, proquinazid, amisulbrom (tên khác: amibromdol), 3-(2,3,4-trimetoxy-6-metylbenzoyl)-5-clo-2-metoxy-4-metylpyridin, 4-(2,3,4-trimetoxy-6-metylbenzoyl)-2,5-diclo-3-triflometylpyridin, pyriofenon, isofetamid, mandipropamid, flocipolit, carpropamid, meptyldinocap,

spiroxamino, fenpyrazamino, mandestrobin, ZF-9646, BCF-051, BCM-061, BCM-062 đã được đề cập, và hợp chất tương tự.

Bên cạnh đó, khi các hóa chất nông nghiệp có khả năng được trộn với hoặc được sử dụng trong sự kết hợp với các hợp chất của sáng chế, ví dụ, ở đây là các hợp chất có thành phần hoạt tính của các thuốc diệt cỏ được mô tả trong The Pesticide Manual (15th edition), cụ thể là các loại trong xử lý đất, và hợp chất tương tự.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ của sáng chế sẽ được mô tả dưới đây nhưng sáng chế không nên được hiểu như chỉ được giới hạn ở đó. Đầu tiên, các ví dụ tổng hợp các hợp chất của sáng chế sẽ được mô tả.

Ví dụ tổng hợp 1

Tổng hợp methyl 4-(6-(triflometyl)nicotinamit)nicotinat (Hợp chất số I-9)

Metyl 4-aminonicotinat (366 mg, 2,4 mmol), O-(7-azabenzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetrametyluroni hexaflophosphat (997 mg, 2,6 mmol), và trietylamino (1,22 mL, 8,7 mmol) được bổ sung vào dung dịch của 6-(triflometyl)nicotinic acid (418 mg, 2,2 mmol) trong N,N-dimetylformamit (15 mL), sau đó được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 24 tiếng. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (50 mL) và chất rắn thu được được lọc ra để thu được sản phẩm mong muốn (426 mg, hiệu suất: 60%).

Ví dụ tổng hợp 2

Tổng hợp methyl 4-(N-etyl-6-(triflometyl)nicotinamit)nicotinat (Hợp chất số I-11)

(1) Dung dịch etylamino 70% chứa nước (9,9 g, 153,9 mmol) được bổ sung vào dung dịch của methyl 4-clonicotinat (3,3 g, 19,2 mmol) trong N,N-dimetylformamit (40 mL), sau đó được khuấy ở 70°C trong 2 tiếng. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (200 mL), sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch muối bão hòa, được làm khô bởi natri sulfat khan, và được lọc. Dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm để thu được methyl 4-(etylamino)nicotinat (3,0 g, hiệu suất: 87%).

(2) Hỗn hợp của metyl 4-(etylamin)nicotinat (300 mg, 1,7 mmol) và diisopropyletylamino (0,85 mL, 5,0 mmol) trong tetrahydrofuran (6 mL) được bổ sung axit 6-(triflometyl)nicotinic clorua (350 mg, 1,7 mmol), sau đó được khuấy ở 65°C trong 5 tiếng. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (20 mL), sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch muối bão hòa, được làm khô bởi natri sulfat khan, và được lọc. Sau khi dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm, phần còn lại được tinh sạch bằng sắc ký cột nhanh (dung môi rửa giải hấp: n-heptan/etyl axetat) để thu được sản phẩm mong muốn (437 mg, hiệu suất: 74%).

Ví dụ tổng hợp 3

Tổng hợp metyl 4-(N-metoxi-6-(triflometyl)-nicotinamit)nicotinat (Hợp chất số I-131)

(1) Nước (13 mL), natri hydroxit (2,7 g, 67,0 mmol), và trietylamin (4,7 mL, 33,5 mmol) lần lượt được bổ sung vào dung dịch của O-metylhydroxylamino hydroclorit (8,4 g, 100,5 mmol) trong N-metyl-2-pyrrolidon (67 mL), sau đó được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 15 phút. Metyl 4-clonicotinat (5,75 g, 33,5 mmol) được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng, sau đó được khuấy ở 75°C trong 15 tiếng. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (300 mL), sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch muối bão hòa, được làm khô bởi natri sulfat khan, và được lọc. Sau khi dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm, phần còn lại được tinh sạch bằng sắc ký cột nhanh (dung môi rửa giải hấp: n-heptan/etyl axetat) để thu được metyl 4-(metoxyamino)nicotinat (1,7 g, hiệu suất: 28%).

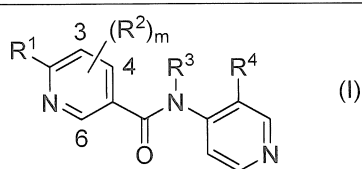
(2) Hỗn hợp của metyl 4-(metoxyamino)nicotinat (500 mg, 2,7 mmol) và diisopropyletylamino (1,44 mL, 8,2 mmol) trong tetrahydrofuran (9 mL) được bổ sung axit 6-(triflometyl)nicotinic clorua (863 mg, 4,1 mmol), sau đó được khuấy ở 65°C trong 16 tiếng. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (45 mL), sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng dung dịch muối bão hòa, được làm khô bởi natri sulfat khan, và được lọc. Sau khi dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm, phần còn lại được tinh sạch bằng sắc ký cột nhanh (dung môi rửa giải hấp: n-heptan/etyl axetat) để thu được sản phẩm mong muốn (330 mg, hiệu suất: 34%).

Bây giờ, các ví dụ đặc trưng về các hợp chất được biểu diễn bởi công thức (I) theo sáng chế sẽ được minh họa trong bảng 1. Các hợp chất này có thể được tổng hợp phù hợp với các ví dụ tổng hợp được mô tả ở trên hoặc nhiều phương pháp sản xuất được mô tả ở trên. Trong bảng 1, các trị số được mô tả trong cột tính chất vật lý biểu diễn các điểm nóng chảy ($^{\circ}\text{C}$) và, về phần các hợp chất với bản mô tả của "NMR", dữ liệu quang phổ ^1H -NMR của nó được minh họa trong bảng 2.

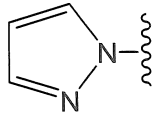
Ngẫu nhiên là, "Số" trong bảng 1 biểu diễn số hợp chất. Ngoài ra, trong bảng, Me biểu diễn nhóm methyl, Et biểu diễn nhóm ethyl, Pr biểu diễn nhóm propyl, Bu biểu diễn nhóm butyl, "cyc-" biểu diễn "xyclo", "i-" biểu diễn "iso", "t-" biểu diễn "bậc ba", và "n-" biểu diễn "thông thường", một cách tương ứng.

Hơn nữa, trong cột của $(\text{R}^2)_m$, ví dụ, hợp chất được mô tả như "6-NH₂" biểu diễn là nó được thế bởi R^2 chỉ tại vị trí thế gắn với công thức cấu trúc hóa học trong bảng, cụ thể, nó là hợp chất của "m=1" mà nó được thế bởi amin chỉ tại vị trí 6. Mặt khác, hợp chất được mô tả như "m=0" biểu diễn hợp chất mà không bị thế bởi R^2 . Các bản mô tả tương tự khác theo sau nó.

Trong quang phổ ^1H -NMR của hợp chất số I-54, cách đỉnh tương ứng được đo lường như hỗn hợp của các đồng phân quang học.



Bảng 1

Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-1	CF ₃	m=0	H	Me	129,2
I-2	CF ₃	m=0	H	F	157,1
I-3	CF ₃	m=0	H	Cl	NMR
I-4	CF ₃	m=0	H	Br	NMR
I-5	CF ₃	m=0	H	I	170,7
I-6	CF ₃	m=0	H	NO ₂	110,2
I-7	CF ₃	m=0	H	OEt	165,4
I-8	CF ₃	6-NH ₂	H	OEt	NMR
I-9	CF ₃	m=0	H	CO ₂ Me	120,9
I-10	CF ₃	m=0	Me	CO ₂ Me	105-106
I-11	CF ₃	m=0	Et	CO ₂ Me	98-99
I-12	CF ₃	6-Me	H	CO ₂ Me	171,9
I-13	CF ₃	6-Et	H	CO ₂ Me	135,9
I-14	CF ₃	6-i-Pr	H	CO ₂ Me	138,6
I-15	CF ₃	6-CF ₃	H	CO ₂ Me	140-153,5
I-16	CF ₃	m=0	H	COSMe	134,0
I-17	Cl	m=0	H	CO ₂ Me	NMR
I-18	Cl	m=0	H	OEt	
I-19	Me	m=0	H	CO ₂ Me	NMR
I-20	Me	m=0	H	OEt	
I-21	OMe	m=0	H	CO ₂ Me	121,8
I-22	OMe	m=0	H	OEt	
I-23	CF ₃	6-OMe	H	CO ₂ Me	NMR
I-24	CF ₃	6-OMe	H	OEt	
I-25	CF ₃	m=0	H		286,5
I-26	OCH ₂ CF ₃	m=0	H	Br	NMR
I-27	OCH ₂ CF ₃	m=0	H	CO ₂ Me	NMR
I-28	OCH ₂ CF ₃	m=0	H	OEt	
I-29	t-Bu	m=0	H	I	NMR
I-30	t-Bu	m=0	H	CO ₂ Me	239,5
I-31	t-Bu	m=0	H	OEt	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-32	CF ₃	6-NHMe	H	CO ₂ Me	
I-33	CF ₃	6-NMe ₂	H	CO ₂ Me	
I-34	CF ₃	m=0	CH ₂ OMe	CO ₂ Me	
I-35	CF ₃	m=0	COMe	CO ₂ Me	
I-36	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	CO ₂ Me	NMR
I-37	CF ₃	m=0	H	CF ₃	77,6
I-38	CF ₃	m=0	H	SEt	128,2
I-39	H	3-CF ₃	H	CO ₂ Me	127,4
I-40	CF ₃	m=0	H	CO ₂ -i-Pr	122
I-41	i-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ Me	118,4
I-42	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ Me	
I-43	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ Me	90,5
I-44	H	3-CF ₃	Et	CO ₂ Me	71,7
I-45	Me	m=0	Et	CO ₂ Me	93,7
I-46	(4-CF ₃)Ph	m=0	H	CO ₂ Me	274
I-47	CF ₃	6-Cl	H	CO ₂ Me	138,7
I-48	n-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ Me	106,4
I-49	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ Me	
I-50	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ Me	NMR
I-51	OPh	m=0	Et	CO ₂ Me	NMR
I-52	CF ₃	6-Me	Et	CO ₂ Me	104,3
I-53	H	4-CF ₃	H	CO ₂ Me	
I-54	H	4-CF ₃	Et	CO ₂ Me	NMR
I-55	CF ₃	3-Br	H	CO ₂ Me	173,4
I-56	CF ₃	3-F	H	CO ₂ Me	NMR
I-57	CF ₃	6-SEt	H	CO ₂ Me	130
I-58	n-C ₃ F ₇	m=0	H	OEt	108,7
I-59	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	OEt	
I-60	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	OEt	
I-61	C ₂ F ₅	m=0	H	OEt	140,6
I-62	C ₂ F ₅	m=0	Me	OEt	
I-63	C ₂ F ₅	m=0	Et	OEt	
I-64	C ₂ F ₅	m=0	H	CO ₂ Me	113
I-65	C ₂ F ₅	m=0	Me	CO ₂ Me	
I-66	C ₂ F ₅	m=0	Et	CO ₂ Me	92,8
I-67	CF ₃	4-SEt	H	CO ₂ Me	177,8
I-68	CF ₃	4-SOEt	H	CO ₂ Me	155,7
I-69	CF ₃	4-SO ₂ Et	H	CO ₂ Me	182,7

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-70	CF ₃	m=0	Me	OE _t	128,2
I-71	CF ₃	m=0	Et	OE _t	NMR
I-72	CF ₃	m=0	Me	SE _t	92,5
I-73	CF ₃	m=0	Et	SE _t	68,8
I-74	CF ₃	m=0	H	OMe	138,6
I-75	CF ₃	m=0	Me	OMe	85,5
I-76	CF ₃	m=0	Et	OMe	NMR
I-77	CF ₃	m=0	H	O-n-Pr	137,7
I-78	CF ₃	m=0	Me	O-n-Pr	
I-79	CF ₃	m=0	Et	O-n-Pr	
I-80	C ₂ F ₅	m=0	H	SE _t	
I-81	C ₂ F ₅	m=0	Me	SE _t	
I-82	C ₂ F ₅	m=0	Et	SE _t	
I-83	CF ₃	m=0	H	COMe	235,5
I-84	CF ₃	m=0	H	COEt	169,7
I-85	CF ₃	m=0	H	COCF ₃	
I-86	CF ₃	m=0	H	COC ₂ F ₅	
I-87	CF ₃	3-Me	H	CO ₂ Me	119,2
I-88	CF ₃	3-CN	H	CO ₂ Me	NMR
I-89	CF ₃	4-Me	H	CO ₂ Me	133,9
I-90	CF ₃	4-CN	H	CO ₂ Me	
I-91	CF ₃	m=0	H	CO ₂ Et	123,1
I-92	CF ₃	m=0	H	CO ₂ n-Pr	101,9
I-93	CF ₃	m=0	H	Et	
I-94	CF ₃	m=0	H	n-Pr	128,1
I-95	CF ₃	m=0	H	i-Bu	
I-96	CF ₃	m=0	H	CH ₃ - C(CH ₃)=CH-	197,3
I-97	CF ₃	m=0	Me	CO ₂ Et	86,6
I-98	CF ₃	m=0	Me	CO ₂ n-Pr	
I-99	CF ₃	m=0	Me	CO ₂ i-Pr	
I-100	CF ₃	m=0	Me	COMe	
I-101	CF ₃	m=0	Me	COEt	
I-102	CF ₃	m=0	Me	CO _n -Pr	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-103	CF ₃	m=0	Me	COi-Pr	
I-104	CF ₃	m=0	Me	Et	
I-105	CF ₃	m=0	Me	n-Pr	
I-106	CF ₃	m=0	Me	i-Bu	
I-107	CF ₃	m=0	Me	CH ₂ =CH-CH ₂ -	
I-108	CF ₃	m=0	Et	CO ₂ Et	NMR
I-109	CF ₃	m=0	Et	CO ₂ n-Pr	
I-110	CF ₃	m=0	Et	CO ₂ i-Pr	
I-111	CF ₃	m=0	Et	COMe	
I-112	CF ₃	m=0	Et	COEt	
I-113	CF ₃	m=0	Et	CO _n -Pr	
I-114	CF ₃	m=0	Et	COi-Pr	
I-115	CF ₃	m=0	Et	Et	
I-116	CF ₃	m=0	Et	n-Pr	
I-117	CF ₃	m=0	Et	i-Bu	
I-118	CF ₃	m=0	Et	CH ₂ =CH-CH ₂ -	
I-119	CF ₃	m=0	n-Pr	CO ₂ Me	98,2
I-120	CF ₃	m=0	n-Pr	CO ₂ Et	
I-121	CF ₃	m=0	n-Pr	CO ₂ n-Pr	
I-122	CF ₃	m=0	n-Pr	CO ₂ i-Pr	
I-123	CF ₃	m=0	n-Pr	COMe	
I-124	CF ₃	m=0	n-Pr	COEt	
I-125	CF ₃	m=0	n-Pr	OMe	
I-126	CF ₃	m=0	n-Pr	OEt	
I-127	CF ₃	m=0	n-Pr	O-n-Pr	
I-128	CF ₃	m=0	n-Pr	Et	
I-129	CF ₃	m=0	n-Pr	n-Pr	
I-130	CF ₃	m=0	n-Pr	i-Bu	
I-131	CF ₃	m=0	OMe	CO ₂ Me	150,9
I-132	CF ₃	m=0	OMe	CO ₂ Et	
I-133	CF ₃	m=0	OMe	CO ₂ n-Pr	
I-134	CF ₃	m=0	OMe	CO ₂ i-Pr	
I-135	CF ₃	m=0	OMe	COMe	
I-136	CF ₃	m=0	OMe	COEt	
I-137	CF ₃	m=0	OMe	OMe	
I-138	CF ₃	m=0	OMe	OEt	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-139	CF ₃	m=0	OMe	O-n-Pr	
I-140	CF ₃	m=0	OMe	Et	
I-141	CF ₃	m=0	OMe	n-Pr	
I-142	CF ₃	m=0	OMe	i-Bu	
I-143	CF ₃	m=0	COMe	CO ₂ Et	
I-144	CF ₃	m=0	COMe	CO ₂ n-Pr	
I-145	CF ₃	m=0	COMe	CO ₂ i-Pr	
I-146	CF ₃	m=0	COMe	COMe	
I-147	CF ₃	m=0	COMe	COEt	
I-148	CF ₃	m=0	COMe	OMe	
I-149	CF ₃	m=0	COMe	OEt	
I-150	CF ₃	m=0	COMe	O-n-Pr	
I-151	CF ₃	m=0	COMe	Et	
I-152	CF ₃	m=0	COMe	n-Pr	
I-153	CF ₃	m=0	COMe	i-Bu	
I-154	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	CO ₂ Et	
I-155	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	CO ₂ n-Pr	
I-156	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	CO ₂ i-Pr	
I-157	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	COMe	
I-158	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	COEt	
I-159	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	OMe	
I-160	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	OEt	
I-161	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	O-n-Pr	
I-162	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	Et	
I-163	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	n-Pr	
I-164	CF ₃	m=0	CO ₂ Me	i-Bu	
I-165	CF ₃	m=0	COi-Pr	CO ₂ Me	
I-166	CF ₃	m=0	COi-Pr	CO ₂ Et	
I-167	CF ₃	m=0	COi-Pr	CO ₂ n-Pr	
I-168	CF ₃	m=0	COi-Pr	CO ₂ i-Pr	
I-169	CF ₃	m=0	COi-Pr	COMe	
I-170	CF ₃	m=0	COi-Pr	COEt	
I-171	CF ₃	m=0	COi-Pr	OMe	
I-172	CF ₃	m=0	COi-Pr	OEt	
I-173	CF ₃	m=0	COi-Pr	O-n-Pr	
I-174	CF ₃	m=0	COi-Pr	Et	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-175	CF ₃	m=0	COi-Pr	n-Pr	
I-176	CF ₃	m=0	COi-Pr	i-Bu	
I-177	C ₂ F ₅	m=0	H	CO ₂ Et	
I-178	C ₂ F ₅	m=0	H	CO ₂ n-Pr	
I-179	C ₂ F ₅	m=0	H	CO ₂ i-Pr	
I-180	C ₂ F ₅	m=0	H	COMe	
I-181	C ₂ F ₅	m=0	H	COEt	
I-182	C ₂ F ₅	m=0	H	OMe	
I-183	C ₂ F ₅	m=0	H	O-n-Pr	
I-184	C ₂ F ₅	m=0	H	Et	
I-185	C ₂ F ₅	m=0	H	n-Pr	
I-186	C ₂ F ₅	m=0	H	i-Bu	
I-187	C ₂ F ₅	m=0	Me	CO ₂ Et	
I-188	C ₂ F ₅	m=0	Me	CO ₂ n-Pr	
I-189	C ₂ F ₅	m=0	Me	CO ₂ i-Pr	
I-190	C ₂ F ₅	m=0	Me	COMe	
I-191	C ₂ F ₅	m=0	Me	COEt	
I-192	C ₂ F ₅	m=0	Me	OMe	
I-193	C ₂ F ₅	m=0	Me	O-n-Pr	
I-194	C ₂ F ₅	m=0	Me	Et	
I-195	C ₂ F ₅	m=0	Me	n-Pr	
I-196	C ₂ F ₅	m=0	Me	i-Bu	
I-197	C ₂ F ₅	m=0	Et	CO ₂ Et	
I-198	C ₂ F ₅	m=0	Et	CO ₂ n-Pr	
I-199	C ₂ F ₅	m=0	Et	CO ₂ i-Pr	
I-200	C ₂ F ₅	m=0	Et	COMe	
I-201	C ₂ F ₅	m=0	Et	COEt	
I-202	C ₂ F ₅	m=0	Et	OMe	
I-203	C ₂ F ₅	m=0	Et	O-n-Pr	
I-204	C ₂ F ₅	m=0	Et	Et	
I-205	C ₂ F ₅	m=0	Et	n-Pr	
I-206	C ₂ F ₅	m=0	Et	i-Bu	
I-207	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	CO ₂ Me	
I-208	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	CO ₂ Et	
I-209	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	CO ₂ n-Pr	
I-210	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	CO ₂ i-Pr	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-211	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	COMe	
I-212	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	COEt	
I-213	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	OMe	
I-214	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	OEt	
I-215	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	O-n-Pr	
I-216	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	Et	
I-217	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	n-Pr	
I-218	C ₂ F ₅	m=0	n-Pr	i-Bu	
I-219	C ₂ F ₅	m=0	OMe	CO ₂ Me	
I-220	C ₂ F ₅	m=0	OMe	CO ₂ Et	
I-221	C ₂ F ₅	m=0	OMe	CO ₂ n-Pr	
I-222	C ₂ F ₅	m=0	OMe	CO ₂ i-Pr	
I-223	C ₂ F ₅	m=0	OMe	COMe	
I-224	C ₂ F ₅	m=0	OMe	COEt	
I-225	C ₂ F ₅	m=0	OMe	OMe	
I-226	C ₂ F ₅	m=0	OMe	OEt	
I-227	C ₂ F ₅	m=0	OMe	O-n-Pr	
I-228	C ₂ F ₅	m=0	OMe	Et	
I-229	C ₂ F ₅	m=0	OMe	n-Pr	
I-230	C ₂ F ₅	m=0	OMe	i-Bu	
I-231	n-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ Et	
I-232	n-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ n-Pr	
I-233	n-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ i-Pr	
I-234	n-C ₃ F ₇	m=0	H	COMe	
I-235	n-C ₃ F ₇	m=0	H	COEt	
I-236	n-C ₃ F ₇	m=0	H	OMe	
I-237	n-C ₃ F ₇	m=0	H	O-n-Pr	
I-238	n-C ₃ F ₇	m=0	H	Et	
I-239	n-C ₃ F ₇	m=0	H	n-Pr	
I-240	n-C ₃ F ₇	m=0	H	i-Bu	
I-241	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ Et	
I-242	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ n-Pr	
I-243	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ i-Pr	
I-244	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	COMe	
I-245	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	COEt	
I-246	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	OMe	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-247	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	O-n-Pr	
I-248	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	Et	
I-249	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	n-Pr	
I-250	n-C ₃ F ₇	m=0	Me	i-Bu	
I-251	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ Et	
I-252	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ n-Pr	
I-253	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ i-Pr	
I-254	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	COMe	
I-255	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	COEt	
I-256	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	OMe	
I-257	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	O-n-Pr	
I-258	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	Et	
I-259	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	n-Pr	
I-260	n-C ₃ F ₇	m=0	Et	i-Bu	
I-261	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	CO ₂ Me	
I-262	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	CO ₂ Et	
I-263	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	CO ₂ n-Pr	
I-264	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	CO ₂ i-Pr	
I-265	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	COMe	
I-266	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	COEt	
I-267	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	OMe	
I-268	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	OEt	
I-269	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	O-n-Pr	
I-270	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	Et	
I-271	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	n-Pr	
I-272	n-C ₃ F ₇	m=0	n-Pr	i-Bu	
I-273	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ Me	
I-274	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ Et	
I-275	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ n-Pr	
I-276	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ i-Pr	
I-277	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	COMe	
I-278	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	COEt	
I-279	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	OMe	
I-280	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	OEt	
I-281	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	O-n-Pr	
I-282	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	Et	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-283	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	n-Pr	
I-284	n-C ₃ F ₇	m=0	OMe	i-Bu	
I-285	i-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ Et	
I-286	i-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ n-Pr	
I-287	i-C ₃ F ₇	m=0	H	CO ₂ i-Pr	
I-288	i-C ₃ F ₇	m=0	H	COMe	
I-289	i-C ₃ F ₇	m=0	H	COEt	
I-290	i-C ₃ F ₇	m=0	H	OMe	
I-291	i-C ₃ F ₇	m=0	H	OEt	
I-292	i-C ₃ F ₇	m=0	H	O-n-Pr	
I-293	i-C ₃ F ₇	m=0	H	Et	
I-294	i-C ₃ F ₇	m=0	H	n-Pr	
I-295	i-C ₃ F ₇	m=0	H	i-Bu	
I-296	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ Et	
I-297	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ n-Pr	
I-298	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	CO ₂ i-Pr	
I-299	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	COMe	
I-300	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	COEt	
I-301	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	OMe	
I-302	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	OEt	
I-303	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	O-n-Pr	
I-304	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	Et	
I-305	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	n-Pr	
I-306	i-C ₃ F ₇	m=0	Me	i-Bu	
I-307	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ Et	
I-308	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ n-Pr	
I-309	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	CO ₂ i-Pr	
I-310	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	COMe	
I-311	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	COEt	
I-312	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	OMe	
I-313	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	OEt	
I-314	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	O-n-Pr	
I-315	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	Et	
I-316	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	n-Pr	
I-317	i-C ₃ F ₇	m=0	Et	i-Bu	
I-318	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ Me	

Bảng 1 (tiếp)					
Số	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	Tính chất vật lý
I-319	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ Et	
I-320	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ n-Pr	
I-321	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	CO ₂ i-Pr	
I-322	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	COMe	
I-323	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	COEt	
I-324	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	OMe	
I-325	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	OEt	
I-326	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	O-n-Pr	
I-327	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	Et	
I-328	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	n-Pr	
I-329	i-C ₃ F ₇	m=0	OMe	i-Bu	
I-330	CF ₃	m=0	cyc-Pr	CO ₂ Me	143,6
I-331	CF ₃	m=0	cyc-Pr	CO ₂ Et	
I-332	CF ₃	m=0	cyc-Pr	CO ₂ n-Pr	
I-333	CF ₃	m=0	cyc-Pr	CO ₂ i-Pr	
I-334	CF ₃	m=0	cyc-Pr	COMe	
I-335	CF ₃	m=0	cyc-Pr	COEt	
I-336	CF ₃	m=0	cyc-Pr	OMe	
I-337	CF ₃	m=0	cyc-Pr	OEt	
I-338	CF ₃	m=0	cyc-Pr	O-n-Pr	
I-339	CF ₃	m=0	cyc-Pr	Et	
I-340	CF ₃	m=0	cyc-Pr	n-Pr	
I-341	CF ₃	m=0	cyc-Pr	i-Bu	

Bảng 2	
Số	Dụng cụ đo ppm trị số δ $^1\text{H-NMR}$: JEOL-ECX(500 MHz), Dung môi: CDCl_3
I-3	9,25 (1H, s), 8,63 (1H, s), 8,51-8,55 (2H, m), 8,43 (2H, dd), 7,90 (1H, d)
I-4	9,25 (1H, s), 8,72 (1H, s), 8,49-8,58 (3H, m), 8,43 (1H, d), 7,89 (1H, d)
I-8	8,57 (1H, brs), 8,35 (1H, d), 8,28 (2H, d), 7,88 (1H, d), 7,05 (1H, d), 6,61 (2H, brs), 4,28 (2H, q), 1,53 (3H, t)
I-17	12,26 (1H, brs), 9,24 (1H, s), 9,07 (1H, s), 8,75 (1H, d), 8,71 (1H, d), 8,27 (1H, dd), 7,52 (1H, d), 4,05 (3H, s)
I-19	12,19 (1H, brs), 9,22 (1H, s), 9,19 (1H, d), 8,78 (1H, d), 8,69 (1H, d), 8,20 (1H, dd), 7,34 (1H, d), 4,02 (3H, s), 2,67 (3H, s)
I-23	9,22 (1H, s), 9,85 (1H, d), 8,66-8,69 (2H, m), 7,46 (1H, d), 4,30 (3H, s), 4,01 (3H, s)
I-26	8,75 (1H, s), 8,69 (1H, s), 8,478-8,51 (3H, m), 8,20 (1H, d), 7,01 (1H, d), 4,85 (2H, q)
I-27	12,18 (1H, s), 9,21 (1H, s), 8,86 (1H, s), 8,75 (1H, d), 8,68 (1H, d), 8,28 (1H, d), 7,00 (1H, d), 4,85 (2H, q), 4,02 (3H, s)
I-29	9,15 (1H, s), 8,87 (1H, s), 8,41-8,52 (3H, m), 8,22 (1H, dd), 7,54 (1H, d), 1,42 (9H, s)
I-36	9,36 (1H, s), 9,05 (1H, s), 8,90 (1H, d), 8,23 (1H, dd), 7,79 (1H, d), 7,30 (1H, d), 3,92 (3H, s), 3,67 (3H, s)
I-50	9,05 (1H, brs), 8,69 (1H, brs), 8,64 (1H, brs), 7,84 (1H, brs), 7,55 (1H, brs), 7,25 (1H, m), 4,15 (2H, q), 3,88 (3H, brs), 1,25 (3H, t)
I-51	9,02 (1H, s), 8,71 (1H, d), 8,07 (1H, br), 7,70 (1H, d), 7,38 (2H, t), 7,19 (2H, m), 7,06 (2H, d), 6,77 (1H, d), 3,93 (2H, br), 3,85 (3H, s), 1,22 (3H, t)
I-54	9,26 9,13 (1H, s), 9,10 8,58 (1H, s), 8,92 8,87 (1H, d), 8,64 8,56 (1H, d), 7,65 7,30 (1H, d), 7,47 6,92 (1H, d), 4,05 3,98 (3H, s), 3,18-4,62 (2H, m), 1,19 1,06 (3H, t)
I-56	9,22 (1H, brs), 9,16 (1H, s), 8,61-8,89 (2H, m) 8,24 (d, 1H), 4,06 (3H, s)
I-71	8,66 (1H, s), 8,22 (1H, d), 8,20 (1H, s), 7,81 (1H, dd), 7,51 (1H, d), 7,07 (1H, d), 4,03 (2H, br), 3,91 (2H, br), 1,41 (3H, t), 1,21 (3H, t)
I-76	8,65 (1H, s), 8,25 (1H, d), 8,22 (1H, s), 7,81 (1H, d), 7,52 (1H, d), 7,08 (1H, d), 3,92 (2H, br), 3,79 (3H, s), 1,20 (3H, t)
I-88	9,49 (1H, d), 9,28 (1H, s), 8,79 (1H, d), 8,75 (1H, d), 8,72 (1H, d), 4,06 (3H, s)
I-108	9,03 (1H, br), 8,74 (1H, br), 8,62 (1H, br), 7,81 (1H, br), 7,52 (1H, br), 7,20 (1H, br), 4,34 (2H, q), 4,12 (2H, q), 1,36 (3H, t), 1,26 (3H, t)

Ví dụ thử nghiệm 1

Kiểm tra hiệu quả chống rầy nâu (*Nilaparvata lugens*)

Cây thóc giống được đưa vào xử lý ngâm trong dung dịch thử nghiệm đã được chuẩn bị sao cho nồng độ của hợp chất của sáng chế là 200 ppm. Sau khi dung dịch thử nghiệm được làm khô trong không khí, cây giống với rễ của nó được bọc với bông hút ẩm, được đặt vào ống nghiệm. Sau đó, các con nhộng ở giai đoạn ấu trùng thứ hai đến thứ ba của rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) được đưa vào trong đó, và ống nghiệm được che phủ bởi lưới rây và được để lại trong buồng có ánh sáng ở 25°C. Vào ngày thứ năm sau khi xử lý, việc sống hay chết của rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) được đánh giá, và tỷ lệ tử vong (%) được xác định bởi phương trình sau. Như kết quả của các hợp chất thử nghiệm số I-4, I-8, I-9, I-10, I-11, và I-94, tỷ lệ tử vong được minh họa là 90% hoặc nhiều hơn cho tất cả các hợp chất.

$$\text{Tỷ lệ tử vong (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng được thả}) \times 100$$

Ví dụ thử nghiệm 2

Kiểm tra hiệu quả chống bọ cánh phân khoai lang (*Bemisia tabaci*)

Các con trưởng thành của loài bọ cánh phân khoai lang (*Bemisia tabaci*) được thả lên cây giống dưa chuột được trồng trong chậu. Sau khi chúng được cho phép đẻ trứng trong 1 ngày, cây giống dưa chuột được lấy ra và để lại trong buồng có ánh sáng ở 25°C. Sau 7 ngày, số lượng nhộng ở giai đoạn ấu trùng thứ nhất đến thứ hai ký sinh trên cây giống dưa chuột được xem xét và dung dịch thử nghiệm đã được chuẩn bị sao cho nồng độ của hợp chất của sáng chế là 200 ppm được xịt bằng bình xịt cầm tay. Sau khi dung dịch thử nghiệm được làm khô trong không khí, cây giống dưa chuột được để vào trong buồng có ánh sáng ở 25°C. Vào ngày thứ bảy sau khi xử lý, số lượng của các nhộng già được xem xét và trị số phòng ngừa được xác định bởi các phương trình sau. Như kết quả của các hợp chất thử nghiệm số I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-25, I-27, I-29, I-30, và I-94, trị số phòng ngừa được minh họa bằng 90% hoặc lớn hơn cho tất cả các hợp chất.

$$\text{Trị số phòng ngừa} = (1 - (Ta \times Cb) / (Tb \times Ca)) \times 100$$

Ta: số lượng các nhộng già sau xử lý trên cây giống dưa chuột đã được xử lý

Tb: số lượng nhộng ở giai đoạn ấu trùng thứ nhất đến thứ hai trước khi xử lý trên cây giống dưa chuột đã được xử lý

Ca: số lượng nhộng già sau xử lý trên cây giống dưa chuột chưa được xử lý

Cb: số lượng nhộng ở giai đoạn ấu trùng thứ nhất đến thứ hai trước khi xử lý trên cây giống dưa chuột chưa được xử lý

Ví dụ thử nghiệm 3

Kiểm tra hiệu quả chống rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*)

5 rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) trưởng thành được thả trên lá cải mà vốn được thêm vào nước trong ống nghiệm. Các con trưởng thành bị loại bỏ sau 1 ngày, số lượng nhộng ký sinh trên lá cải được đếm, được đưa vào xử lý ngâm trong dung dịch thử nghiệm đã được chuẩn bị sao cho nồng độ của hợp chất của sáng chế là 200 ppm. Sau khi dung dịch thử nghiệm được làm khô trong không khí, lá được để vào trong buồng có ánh sáng ở 25°C. Vào ngày thứ năm sau khi xử lý, việc sống hay chết của rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) được đánh giá, và tỷ lệ tử vong được xác định bởi các phương trình sau. Ngẫu nhiên là, các con côn trùng bị loại bỏ và các con côn trùng bất thường được xem như là các con đã tử vong. Như kết quả của các hợp chất thử nghiệm số I-3, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-15, I-25, I-30, và I-94, tỷ lệ tử vong được minh họa là 90% hoặc nhiều hơn cho tất cả các hợp chất.

$$\text{Tỷ lệ tử vong (\%)} = (\text{Số côn trùng chết} / \text{Số côn trùng được thả}) \times 100$$

Dưới đây sẽ mô tả các Ví dụ bào chế.

Ví dụ bào chế 1

(1) Hợp chất của sáng chế	20 phần theo trọng lượng
(2) Đất sét	70 phần theo trọng lượng
(3) Cacbon trắng	5 phần theo trọng lượng
(4) Natri polycarboxylat	3 phần theo trọng lượng
(5) Natri alkyl naphthalensulfonat	2 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều để tạo thành bột thấm nước.

Ví dụ bào chế 2

(1) Hợp chất của sáng chế	5 phần theo trọng lượng
(2) Đá tan	60 phần theo trọng lượng
(3) Canxi carbonat	34,5 phần theo trọng lượng
(4) Dầu parafin	0,5 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều để tạo thành mùn.

Ví dụ bào chế 3

(1) Hợp chất của sáng chế	20 phần theo trọng lượng
(2) N,N-Dimetylaxetamit	20 phần theo trọng lượng
(3) Polyoxyetylen tristyryl phenyl ete	10 phần theo trọng lượng
(4) Canxi dodecylbenzensulfonat	2 phần theo trọng lượng
(5) Xylen	48 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều và được hòa tan để tạo thành dịch cô đặc nhũ hóa.

Ví dụ bào chế 4

(1) Đất sét	68 phần theo trọng lượng
(2) Natri ligninsulfonat	2 phần theo trọng lượng
(3) Polyoxyetylen alkylaryl sulfat	5 phần theo trọng lượng
(4) Cacbon trắng	25 phần theo trọng lượng

Hỗn hợp của các thành phần ở trên và hợp chất của sáng chế được trộn theo tỷ lệ khối lượng là 4:1 để tạo thành bột thấm nước.

Ví dụ bào chế 5

(1) Hợp chất của sáng chế	50 phần theo trọng lượng
(2) Phần ngưng tụ của natri alkylnaphtalensulfonat với formaldehyt	2 phần theo trọng lượng
(3) Dầu silicon	0,2 phần theo trọng lượng
(4) Nước	47,8 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều và nghiền để tạo thành chất lỏng thô. Chất lỏng thô ngoài ra còn được bổ sung

(5) Natri polycarboxylat	5 phần theo trọng lượng
(6) Natri sulfat khan	42,8 phần theo trọng lượng,

Và tất cả được trộn đều, làm thành dạng hạt, và được làm khô để thu được các hạt phân tán trong nước.

Ví dụ bào chế 6

(1) Hợp chất của sáng chế	5 phần theo trọng lượng
---------------------------	-------------------------

(2) Polyoxyetylen octylphenyl ete	1 phần theo trọng lượng
(3) Polyoxyetylen alkyl ete phosphat este	0,1 phần theo trọng lượng
(4) Canxi carbonat dạng hạt	93,9 phần theo trọng lượng

(1) đến (3) ở trên được trộn đều trước và, sau đó được pha loãng với lượng axeton thích hợp, hỗn hợp đã pha loãng được xịt vào (4) và axeton được loại bỏ để tạo thành hạt.

Ví dụ bào chế 7

(1) Hợp chất của sáng chế	2,5 phần theo trọng lượng
(2) N,N-Dimetylaxetamit	2,5 phần theo trọng lượng
(3) Dầu đậu nành	95,0 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều và được hòa tan để tạo thành chế phẩm có thể tích rất thấp.

Ví dụ bào chế 8

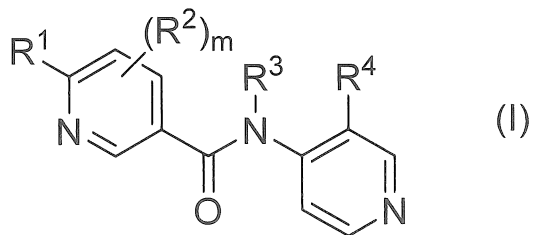
(1) Hợp chất của sáng chế	10 phần theo trọng lượng
(2) Dietylen glycol monoetyl ete	80 phần theo trọng lượng
(3) Polyoxyetylen alkyl ete	10 phần theo trọng lượng

Các chất trên được trộn đều để tạo thành dịch cô đặc hòa tan.

Trong khi sáng chế đã được mô tả chi tiết hay bằng cách viện dẫn đến các phương án cụ thể của nó, nó sẽ được làm rõ bởi chuyên gia thông thường trong lĩnh vực kỹ thuật mà nhiều thay đổi và sửa đổi có thể được thực hiện trong phần mô tả này mà không nằm ngoài tinh thần và phạm vi của sáng chế. Sáng chế là dựa trên Công bố đơn yêu cầu cấp bằng sáng chế Nhật Bản số 2017-088847 được nộp vào ngày 27 tháng 4 năm 2017, và nội dung được kết hợp ở đây bằng cách viện dẫn.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất N-(4-pyridyl)nicotinamid được biểu diễn bởi công thức (I):



trong đó R¹ là haloalkyl;

R² là nguyên tử halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, amino, monoalkylamino, dialkylamino, aryloxy, xyano, alkylthio, alkylsulfinyl, hoặc alkylsulfonyl;

R³ là nguyên tử hydro, alkyl, xycloalkyl, hoặc alkoxy;

R⁴ là alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, hoặc alkoxycarbonyl;

m là số nguyên bằng 0;

hoặc muối của nó.

2. Chất phòng ngừa sinh vật gây hại bao gồm hợp chất hoặc muối của nó theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.

3. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp và trồng trọt, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, hoặc thuốc diệt sâu hại trong đất bao gồm hợp chất hoặc muối của nó theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.

4. Phương pháp để phòng ngừa sinh vật gây hại bằng cách sử dụng lượng hữu hiệu của hợp chất hoặc muối của nó theo điểm 1.