



(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)



1-0036574

(51)⁸ C07D 401/04; C07D 213/74; C07D 215/48; C07D 519/00; C07D 471/04; C07D 487/04; C07D 491/056; C07D 498/04; A61P 33/00; C07D 413/04 (13) B

(21) 1-2018-01674

(22) 21/10/2016

(86) PCT/EP2016/075365 21/10/2016

(87) WO2017/072039 04/05/2017

(30) 15191440.5 26/10/2015 EP

(45) 25/08/2023 425

(43) 27/08/2018 365A

(73) BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT (DE)

Alfred-Nobel-Straße 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany

(72) FISCHER, Rüdiger (DE); HAGER, Dominik (DE); HOFFMEISTER, Laura (DE);

KAUSCH-BUSIES, Nina (DE); WILCKE, David (DE); WILLOT, Matthieu (FR);

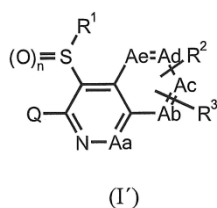
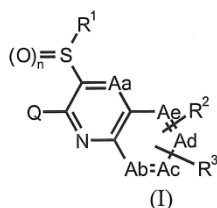
GÖRGENS, Ulrich (DE); ILG, Kerstin (DE); MOSRIN, Marc (FR); PORTZ, Daniela

(DE); TURBERG, Andreas (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT DẪN XUẤT DỊ VÒNG HAI VÒNG NGỪNG TỤ LÀM CHẤT DIỆT SINH VẬT GÂY HẠI, CHẾ PHẨM HÓA NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ HỢP CHẤT TRUNG GIAN ĐỂ ĐIỀU CHẾ HỢP CHẤT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc (I')



trong đó R¹, R², R³, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, Q và n có ý nghĩa như đã đưa ra trong bản mô tả, hữu dụng làm chất diệt ve bét và/hoặc chất diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại, và các quy trình và các hợp chất trung gian để điều chế chúng. Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm hóa nông chứa các hợp chất theo sáng chế và phương pháp phòng trừ động vật gây hại.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ có công thức (I) hoặc có công thức (I'), việc sử dụng chúng làm chất diệt ve bét và/hoặc chất diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại, cụ thể là động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng và nhện, và quy trình và hợp chất trung gian để điều chế chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ với đặc tính diệt côn trùng đã được mô tả trong tài liệu, chẳng hạn trong WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, EP 15153943.4, EP 15153948.3 và WO 2015/121136.

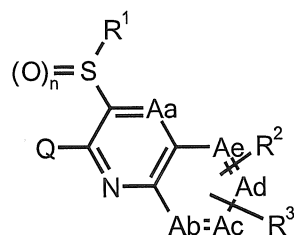
Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ với đặc tính diệt côn trùng cũng đã được mô tả trong tài liệu, chẳng hạn trong WO2016/091731, WO2016/039444; WO2015/198859, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286 và WO 2016/046071.

Tuy nhiên, các thành phần hoạt tính đã biết theo các tài liệu được viện dẫn trên đây có nhược điểm khi ứng dụng ở mức độ nhất định, do chúng chỉ có phạm vi ứng dụng hẹp hoặc vì chúng không hoạt tính diệt côn trùng hoặc trừ nhện thỏa đáng.

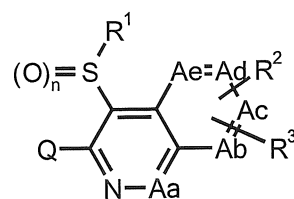
Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ mới đã được phát hiện, các hợp chất này có ưu điểm hơn so với các hợp chất đã biết, ví dụ bao gồm các đặc tính sinh học và hoặc môi trường tốt hơn, nhiều phương pháp áp dụng, hoạt tính diệt côn trùng hoặc trừ nhện tốt hơn, và khả năng tương thích với cây trồng tốt. Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ này có thể được sử dụng kết hợp với các chất khác để cải thiện hiệu lực, đặc biệt là hiệu lực chống lại côn trùng khó phòng trừ.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, sáng chế đề xuất các hợp chất mới có công thức (I) hoặc (I')



(I)



(I')

trong đó (cấu hình 1)

Aa là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab là nitơ hoặc =C(H)-,

Ac là nitơ hoặc =C(H)-,

Ad là nitơ hoặc =C(H)-,

Ae là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

R¹ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl,

C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, aminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl-(C₁-C₆)alkyl,

hoặc (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, mỗi nhóm tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, trong đó aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl mỗi nhóm có thể tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl hoặc benzyl, hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, mỗi nhóm được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp heteroxyclyl) và (=O)₂ (chỉ trong trường hợp heteroxyclyl),

R², R³ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl,

(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino hoặc NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcarbonylamino),

R⁷ là hydro, xyano, halogen, axetyl, hydroxyl, amino, (C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl hoặc (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl,

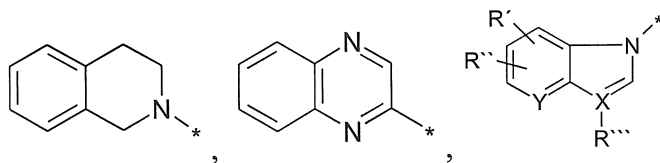
Q là hệ dị vòng hoặc dị vòng thơm 8-, 9-, 10-, 11- hoặc 12- cạnh hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ no hoặc không no từng phần, trong đó ít nhất một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó hệ vòng này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-

C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycacbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkylcacbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocacbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkylcacbonyl, (C₁-C₆)alkoxycacbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocacbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocacbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocacbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocacbonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocacbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocacbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcacbonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ phenyl hoặc di vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng này có thể tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, trong trường hợp đơn vị cấu trúc A4, Q không phải là một trong số các hệ vòng sau:



giống hoặc khác nhau, là cacbon hoặc nitơ, R''' là hydro, aldehyt, oxim hoặc $-C(O)O-R_a$, với điều kiện X là cacbon, trong đó R_a là C_1-C_6 -alkyl, R' và R'', mà có thể giống hoặc khác nhau, là hydro, halogen, xyano, nitro, C_1-C_6 -alkyl hoặc C_1-C_6 -alkoxy,

và, ngoài ra, nếu Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

Ngoài ra, cũng đã phát hiện ra rằng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') có hiệu lực rất tốt làm chất diệt sinh vật gây hại, tốt hơn là chất diệt côn trùng và/hoặc chất diệt ve bét, nói chung thêm nữa chúng có độ tương thích rất tốt với thực vật, đặc biệt là đối với cây trồng.

Các hợp chất theo sáng chế được xác định theo các thuật ngữ chung bởi công thức (I) hoặc (I'). Các phần tử thể được ưu tiên hoặc phạm vi của các gốc được liệt kê trong các công thức nêu trên và dưới đây được minh họa sau đây:

Cấu hình 2

Aa tốt hơn là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab tốt hơn là nitơ hoặc $=C(H)-$,

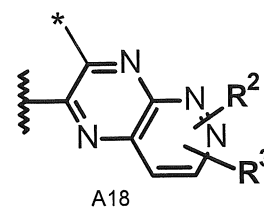
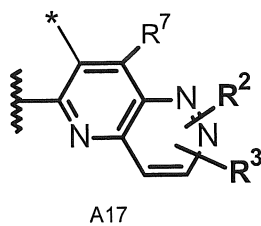
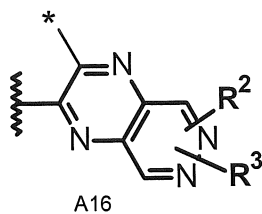
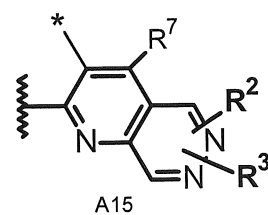
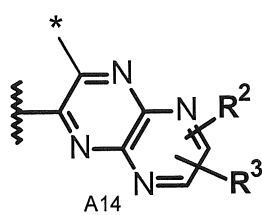
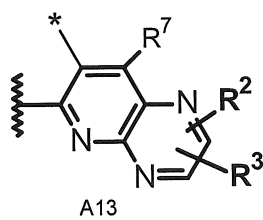
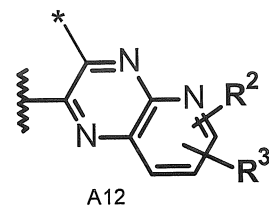
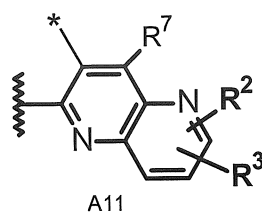
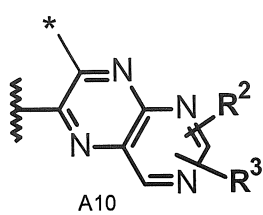
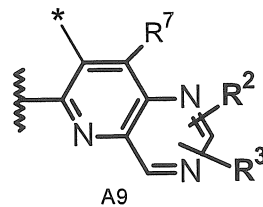
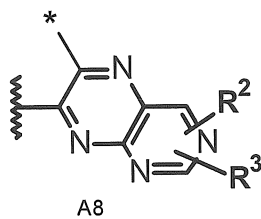
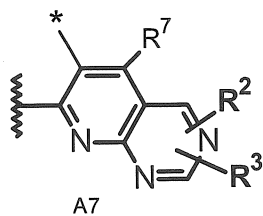
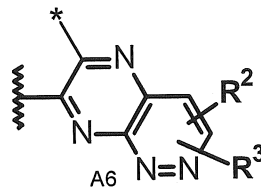
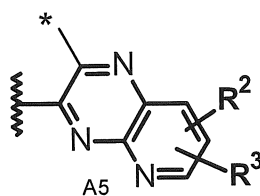
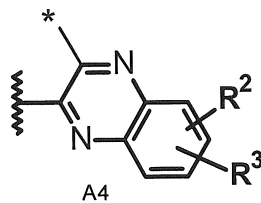
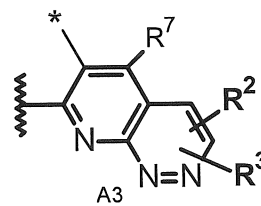
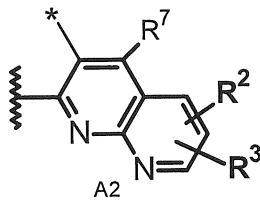
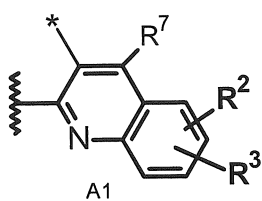
Ac tốt hơn là nitơ hoặc $=C(H)-$,

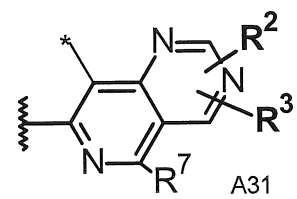
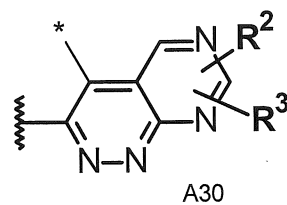
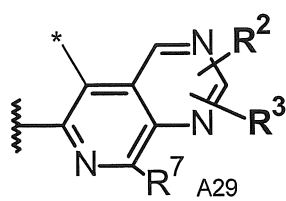
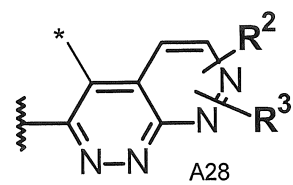
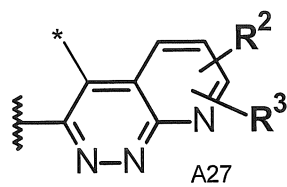
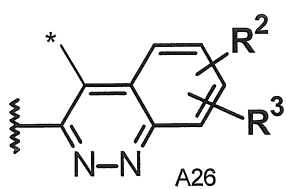
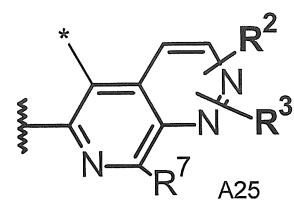
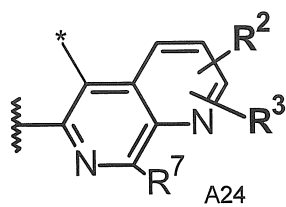
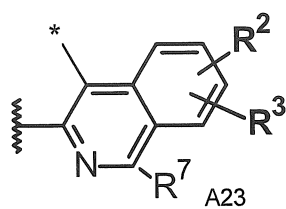
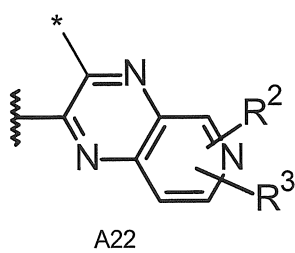
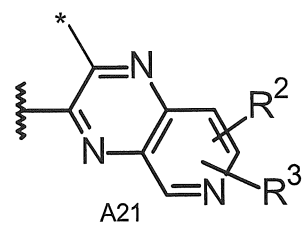
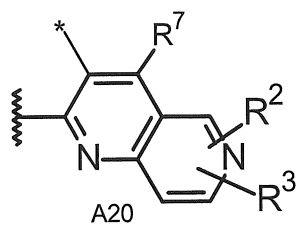
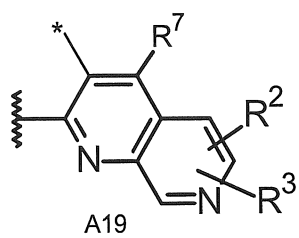
Ad tốt hơn là nitơ hoặc $=C(H)-$,

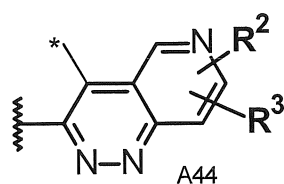
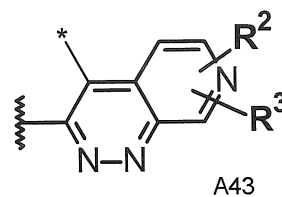
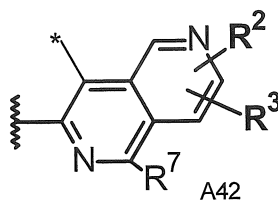
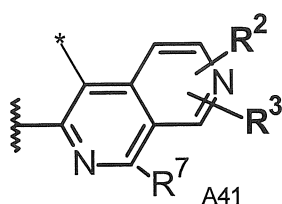
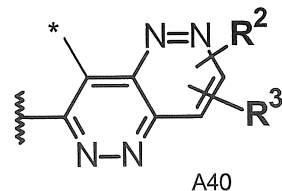
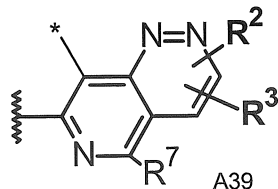
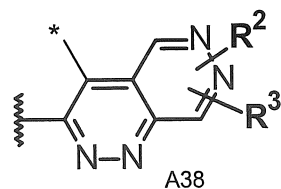
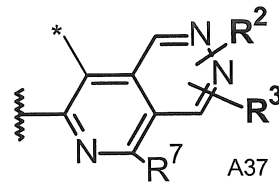
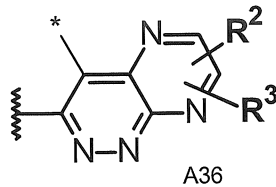
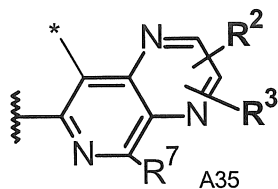
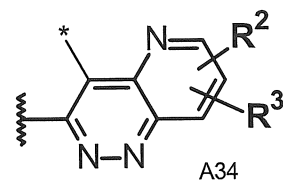
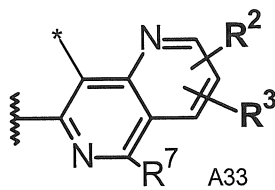
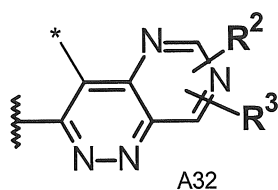
Ae tốt hơn là nitơ hoặc $=C(H)-$,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

tốt hơn là dẫn đến các đơn vị cấu trúc A1 đến A44 sau:







trong đó liên kết với phân tử thể Q được nhận dạng bằng đường lượn sóng và liên kết với nguyên tử lưu huỳnh được nhận dạng bằng dấu hoa thị *,

R¹ tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-

C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, (C₃-C₆)xycloalkylamino, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino,

hoặc là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, mỗi nhóm tùy ý được thể một hoặc hai lần giống hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl và heterocyclyl, trong đó aryl, hetaryl và heterocyclyl mỗi nhóm có thể tùy ý được thể một hoặc hai lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, aminosulphonyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₄)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, hoặc

R¹ tốt hơn là aryl, hetaryl hoặc heterocyclyl, mỗi nhóm tùy ý được thể một hoặc hai lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphimino, (C₁-C₄)alkylsulphoximino, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₃-C₄)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp heterocyclyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp heterocyclyl),

R², R³ độc lập tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,

aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, aminothiocarbonyl or NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino),

R⁷ tốt hơn là hydro, xyano, halogen, axetyl, hydroxyl, amino, (C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl or (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl,

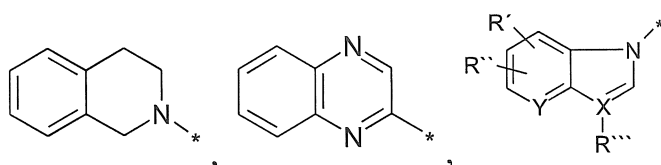
Q tốt hơn là hệ dị vòng thơm hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ 8-, 9-, 10-, 11- hoặc 12- cạnh, trong đó hệ vòng này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphinyl, (C₁-C₆)alkylsulphinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-

C₆)alkylsulphonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulphonyl, (C₁-C₆)alkylsulphoximino, aminothiocabonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcabonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ phenyl hoặc dị vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng này có thể tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

n tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, trong trường hợp đơn vị cấu trúc A4, Q không phải là một trong số các hệ vòng sau:



trong đó X và Y, mà có thể

giống hoặc khác nhau, là cacbon hoặc nitơ, R''' là hydro, aldehyt, oxim hoặc -C(O)O-R_a, với điều kiện X là cacbon, trong đó R_a là C₁-C₆-alkyl, R' và R'', mà có thể giống hoặc khác nhau, là hydro, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆-alkyl hoặc C₁-C₆-alkoxy,

và, ngoài ra, nếu Aa là =C(H)-, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

Cấu hình 3-1

Aa tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C(H)-,

Ac tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C(H)-,

Ad tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C(H)-,

Ae tốt hơn nữa là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

tốt hơn nữa là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1, A2, A3, A4, A5, A7,

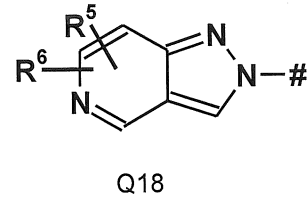
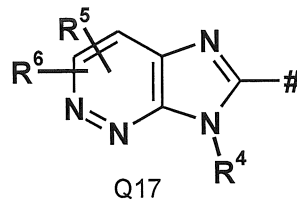
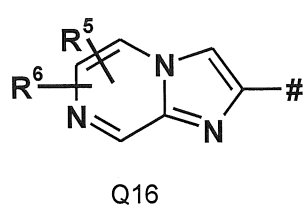
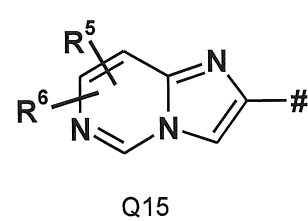
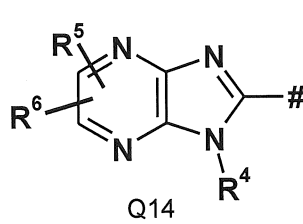
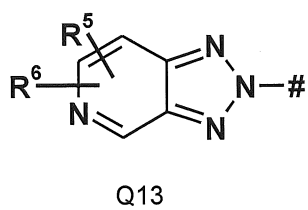
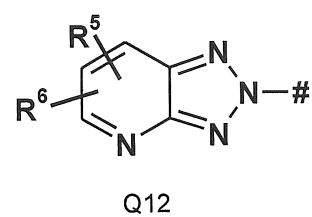
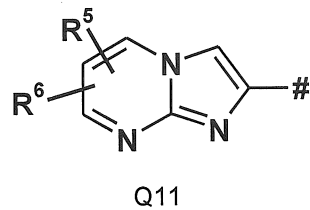
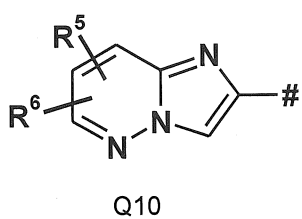
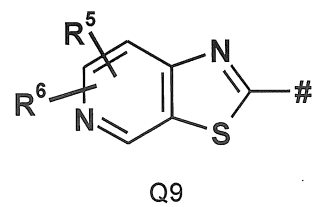
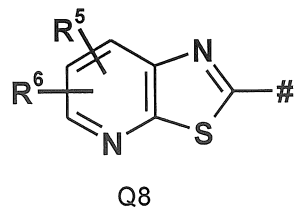
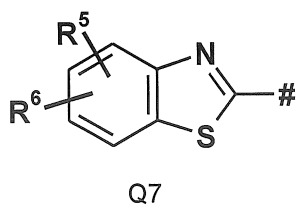
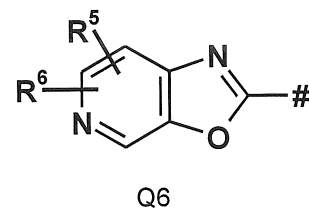
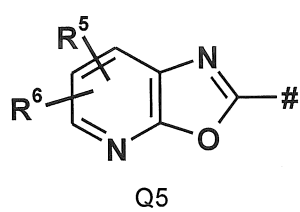
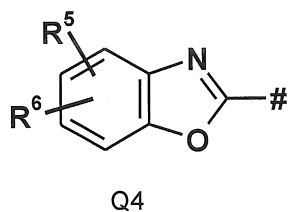
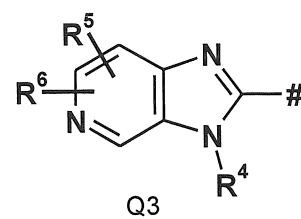
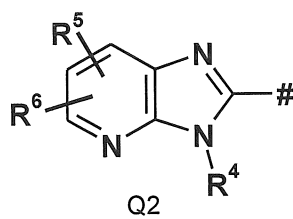
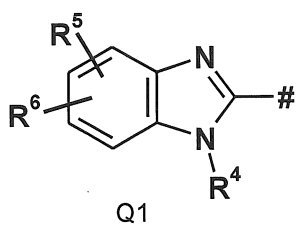
A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A17, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A39, A41, A42, A43, A44,

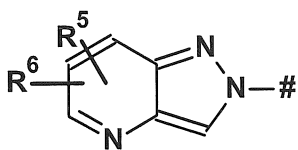
R¹ tốt hơn nữa là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl or (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R², R³ độc lập tốt hơn nữa là hydro, xyano, halogen, nitro, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcacbonylamino),

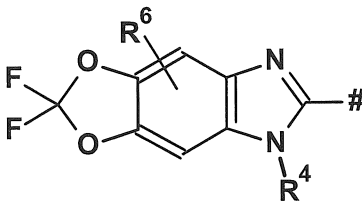
R⁷ tốt hơn nữa là hydro, halogen, xyano, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl,

Q tốt hơn nữa là hệ dị vòng thơm 9 hoặc 12 cạnh hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1 đến Q20,





Q19



Q20

R^4 tốt hơn nữa là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R^5 , R^6 độc lập tốt hơn nữa là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulphonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulphonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulphonyl hoặc di-(C₁-C₄)alkylaminosulphonyl,

n tốt hơn nữa là 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 3-2

Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , Q, R^5 , R^6 và n như được xác định trong cấu hình 3-1 và

R^4 tốt hơn nữa là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-

(C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

trong đó, nếu Aa là =C(H)-, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

Cấu hình 4-1

Aa còn tốt hơn nữa là nitor hoặc =C(R⁷)-,

Ab còn tốt hơn nữa là nitor hoặc =C(H)-,

Ac còn tốt hơn nữa là nitor hoặc =C(H)-,

Ad còn tốt hơn nữa là nitor hoặc =C(H)-,

Ae còn tốt hơn nữa là nitor hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitor,

còn tốt hơn nữa là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1, A2, A4, A5, A7, A9, A11, A12, A13, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A26, A27, A29, A31, A33, A34, A35, A41, A42, A43, A44,

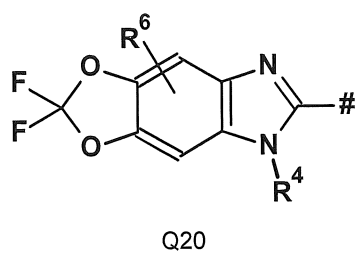
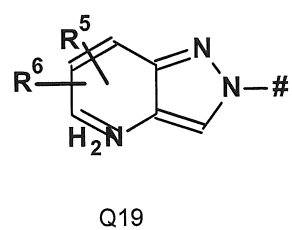
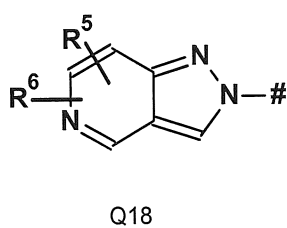
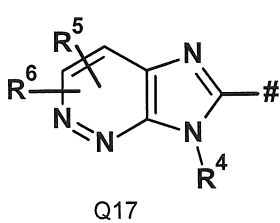
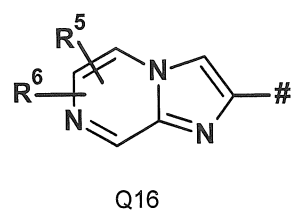
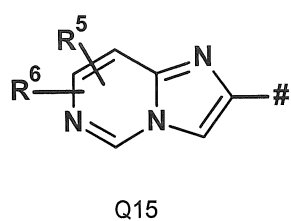
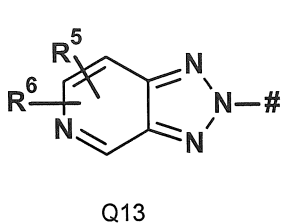
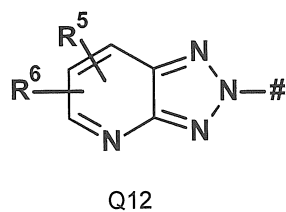
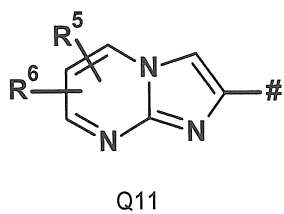
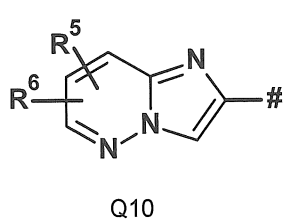
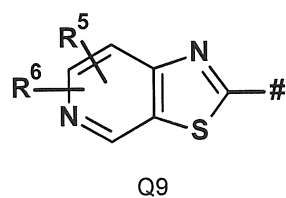
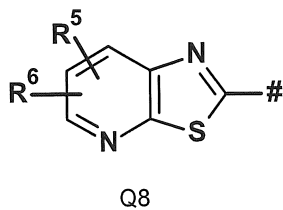
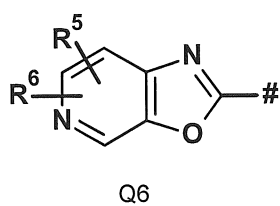
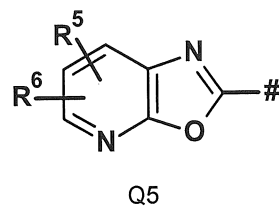
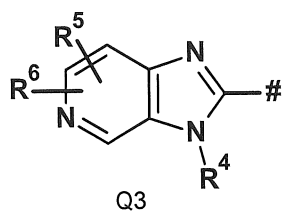
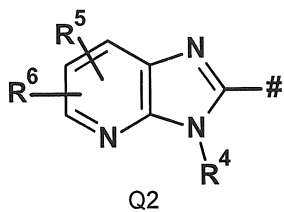
R¹ còn tốt hơn nữa là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R², R³ độc lập còn tốt hơn nữa là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulphinyl, (C₁-C₄)alkylsulphonyl, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)haloalkylsulphinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulphonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino),

R⁷ còn tốt hơn nữa là hydro, halogen, xyano hoặc (C₁-C₄)alkyl,

Q còn tốt hơn nữa là hệ dị vòng thơm 9 hoặc 12 cạnh hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13,

Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 or Q20,



R^4 còn tốt hơn nữa là (C_1-C_4) -alkyl hoặc (C_1-C_4) -alkoxy- (C_1-C_4) -alkyl,

R^5 còn tốt hơn nữa là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) alkylsulphinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulphinyl, (C_1-C_4) alkylsulphonyl, (C_1-C_4) haloalkylsulphonyl, (C_1-C_4) alkylcacybonyl, (C_1-C_4) haloalkylcacybonyl, (C_1-C_4) alkylaminocacybonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminocacybonyl, (C_1-C_4) alkylsulphonylamino, (C_1-C_4) alkylaminosulphonyl hoặc di- (C_1-C_4) alkylaminosulphonyl,

R^6 còn tốt hơn nữa là hydro,

ncòn tốt hơn nữa là 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 4-2

Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R^1 , R^5 , R^6 và n như được xác định trong cấu hình 4-1 và

R^2 , R^3 độc lập còn tốt hơn nữa là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkylsulphinyl, (C_1-C_4) alkylsulphonyl, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) haloalkylsulphinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulphonyl hoặc $NHCO-(C_1-C_4)$ alkyl ((C_1-C_4)alkylcacybonylamino),

R^7 còn tốt hơn nữa là hydro, halogen, xyano, (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) haloalkyl,

Q còn tốt hơn nữa là hệ dị vòng thơm 9 hoặc 12 cạnh hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 hoặc Q20,

R^4 còn tốt hơn nữa là hydro, (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) -alkoxy- (C_1-C_4) alkyl,

trong đó, nếu Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

Cấu hình 5-1

Aa cụ thể là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab cụ thể là nitor hoặc $=C(H)-$,

Ac cụ thể là nitor hoặc $=C(H)-$,

Ad cụ thể là nitor hoặc $=C(H)-$,

Ae cụ thể là nitor hoặc $=C(H)-$,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitor,

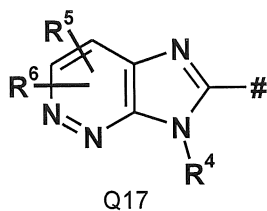
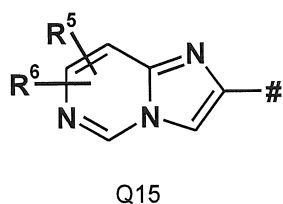
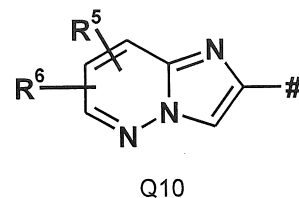
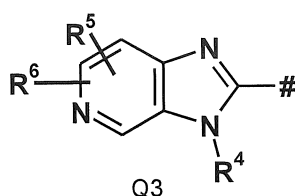
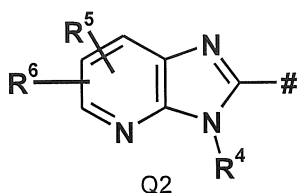
cụ thể là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1, A2, A4, A11, A13, A19, A20, A23, A24, A26, A33, A35, A41, A42,

R^1 cụ thể là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^2, R^3 độc lập cụ thể là hydro, flo, clo, brom, iot, xyano, metyl, etyl, metoxy, triflometyl, triflometoxy hoặc triflometylthio,

R^7 cụ thể là hydro, flo, clo, brom, xyano, metyl, etyl hoặc triflometyl,

Q cụ thể là hệ dị vòng thơm 9 cạnh hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q2, Q3, Q10, Q15 và Q17



R^4 cụ thể là metyl, etyl, isopropyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R^5 cụ thể là flo, clo, brom, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl (CH_2CFH_2 , $CHFCH_3$), difloetyl (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , $CHFCFH_2$), trifloetyl, (CH_2CF_3 , $CHFCHF_2$, CF_2CFH_2), tetrafloetyl ($CHFCF_3$, CF_2CHF_2), pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy hoặc triflometylthio,

R^6 cụ thể là hydro,

ncụ thể là 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 5-2

Aa cụ thể là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab cụ thể là $=C(H)-$,

Ac cụ thể là $=C(H)-$,

Ad cụ thể là $=C(H)-$,

Ae cụ thể là nitơ hoặc $=C(H)-$,

cụ thể là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1, A4, A23, A26, A33,

R^1 cụ thể là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^2, R^3 độc lập cụ thể là hydro, flo, clo, brom, iot, xyano, metyl, etyl, metoxy, triflometyl, triflometoxy hoặc triflometylthio,

R^7 cụ thể là hydro, flo, clo, brom, xyano, metyl, etyl hoặc triflometyl,

Q cụ thể là hệ dị vòng thom 9 hoặc 12 cạnh hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q16, Q17 hoặc Q20,

R^4 cụ thể là hydro, metyl, etyl, isopropyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R^5 cụ thể là flo, clo, brom, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl (CH_2CFH_2 , $CHFCH_3$), difloetyl (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , $CHFCH_2$), trifloetyl, (CH_2CF_3 , $CHFCHF_2$, CF_2CFH_2), tetrafloetyl ($CHFCH_3$, CF_2CHF_2), pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulphanyl hoặc triflometylsulphanyl,

R^6 cụ thể là hydro,

ncụ thể là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q17.

Cấu hình 6-1

Aa đặc biệt là nitor hoặc $=C(R^7)-$,

Ab đặc biệt là $=C(H)-$,

Ac đặc biệt là $=C(H)-$,

Ad đặc biệt là $=C(H)-$,

Ae đặc biệt là $=C(H)-$,

đặc biệt là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1 hoặc A4,

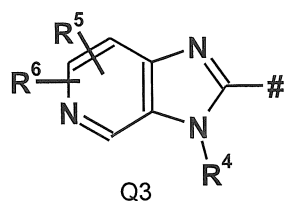
R^1 đặc biệt là etyl,

R^2, R^3 đặc biệt là hydro,

R^7 đặc biệt là hydro,

Q đặc biệt là hệ dị vòng thơm 9 cạnh hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm

Q3



R^4 đặc biệt là metyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

đặc biệt là 0 hoặc 2.

Cấu hình 6-2

Aa đặc biệt là nitor hoặc $=C(R^7)-$,

Ab đặc biệt là $=C(H)-$,

Ac đặc biệt là $=C(H)-$,

Ad đặc biệt là $=C(H)-$,

Ae đặc biệt là nitor hoặc $=C(H)-$,

đặc biệt là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A1, A4, A23, A26, A33

R¹ đặc biệt là metyl hoặc etyl,

R² đặc biệt là hydro, clo, metoxy hoặc triflometyl,

R³ đặc biệt là hydro,

R⁷ đặc biệt là hydro,

Q đặc biệt là hệ dị vòng thơm 9 hoặc 12 cạnh hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q16, Q17, Q20,

R⁴ đặc biệt là hydro hoặc metyl,

R⁵ đặc biệt là triflometyl hoặc pentafluoretyl,

R⁶ đặc biệt là hydro,

nđặc biệt là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Aa là =C(H)-, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q17.

Cấu hình 6-3

Aa đặc biệt là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab đặc biệt là =C(H)-,

Ac đặc biệt là =C(H)-,

Ad đặc biệt là =C(H)-,

Ae đặc biệt là nitơ hoặc =C(H)-,

tốt hơn là đặc biệt dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A23, A26, A33,

R¹ đặc biệt là metyl hoặc etyl,

R² đặc biệt là hydro hoặc triflometyl,

R³ đặc biệt là hydro,

R⁷ đặc biệt là hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q17,

R⁴ đặc biệt là metyl,

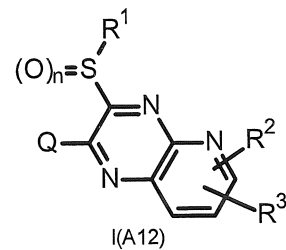
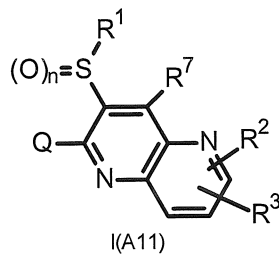
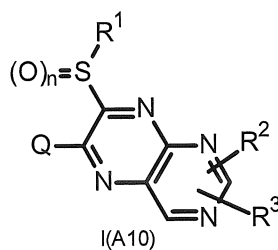
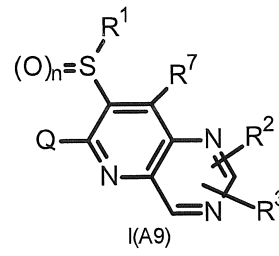
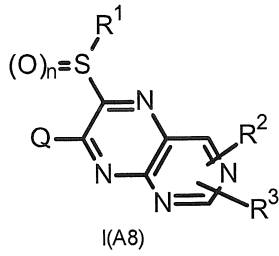
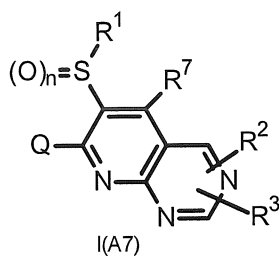
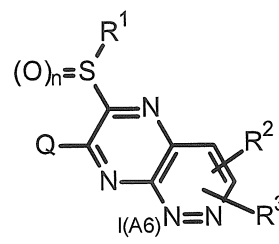
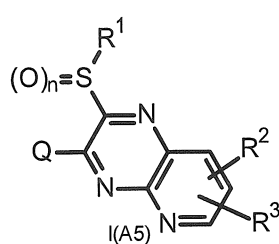
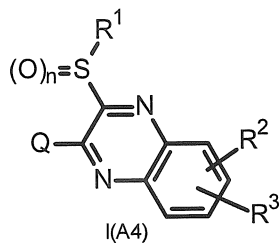
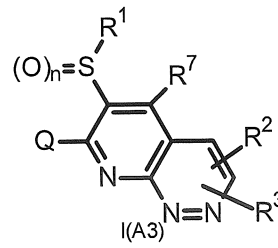
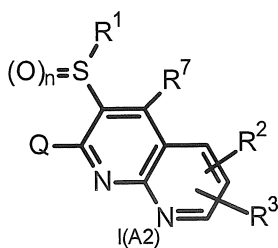
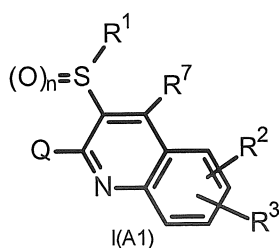
R^5 đặc biệt là triflometyl hoặc pentafluetyl,

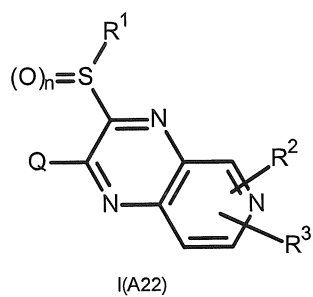
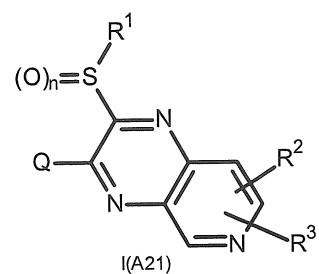
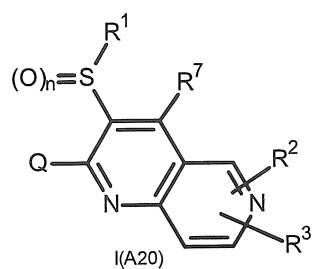
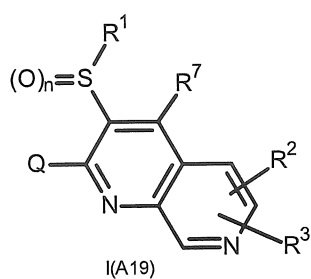
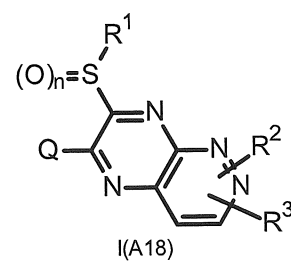
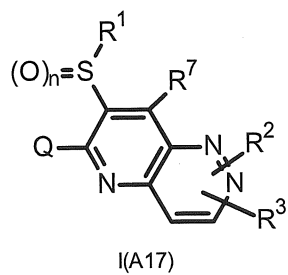
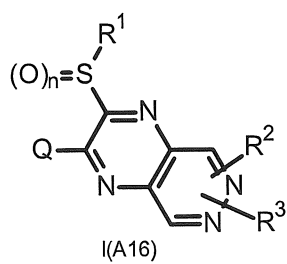
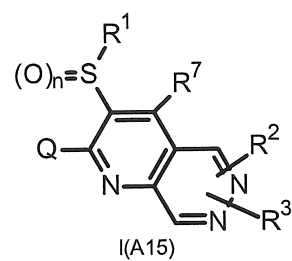
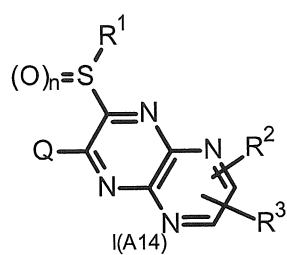
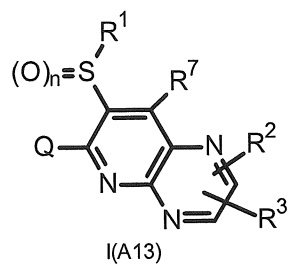
R^6 đặc biệt là hydro,

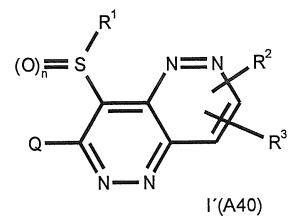
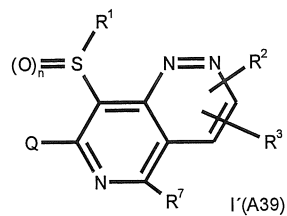
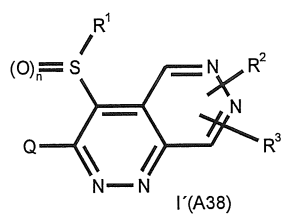
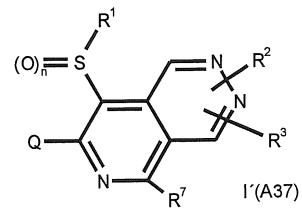
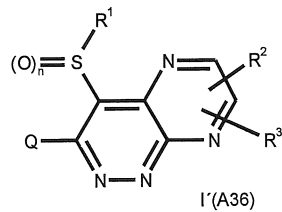
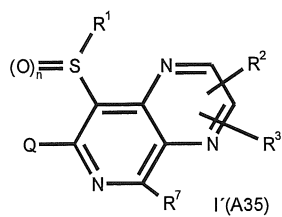
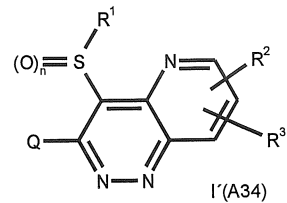
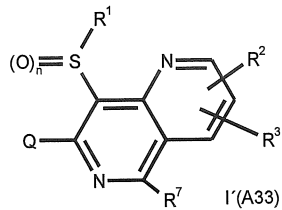
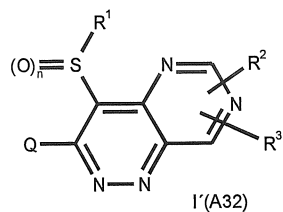
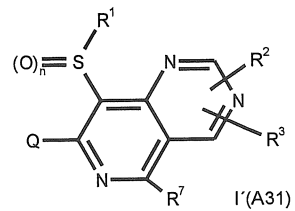
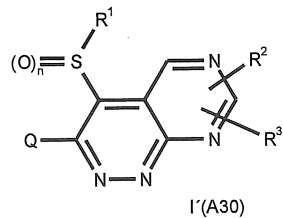
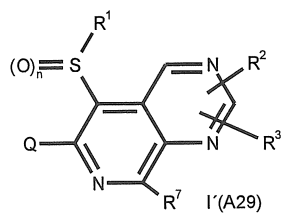
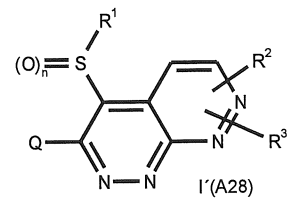
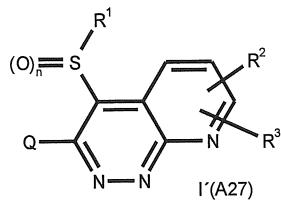
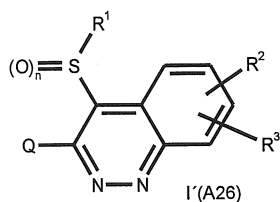
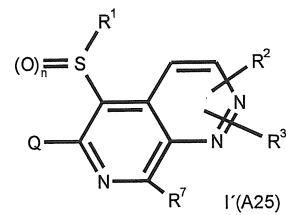
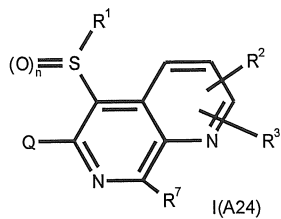
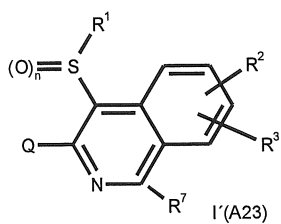
n đặc biệt là 0, 1 hoặc 2,

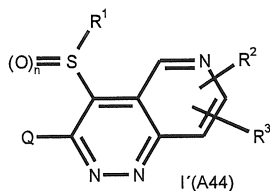
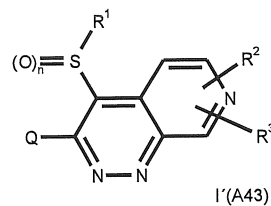
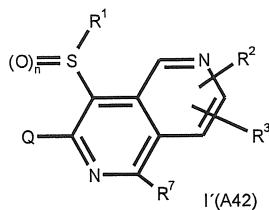
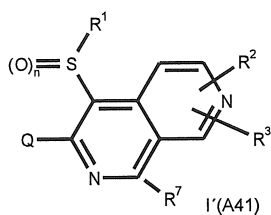
trong đó, nếu Aa là =C(H)-, trong trường hợp các hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q17.

Bằng cách đưa vào các đơn vị cấu trúc từ A1 đến A44, điều này dẫn đến các cấu trúc chính có công thức (I) hoặc công thức (I') sau đây:









trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , Q và n có ý nghĩa như đã đưa ra trên đây.

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , Q , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae và n như được xác định trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , Q , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^7 , Q , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae và n như được xác định trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , Q , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q_1 và R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q2 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q3 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q4 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q5 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q6 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q7 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I)

trong đó Q là Q8 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q9 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q10 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q11 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q12 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q13 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q14 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác

định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q15 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q16 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q17 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q18 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q19 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q20 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc

cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q1 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q2 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q3 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q4 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q5 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q6 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cầu hình (3-1) hoặc cầu hình (3-2) hoặc cầu hình (4-1) hoặc cầu hình (4-2) hoặc cầu hình (5-1) hoặc cầu hình (5-2) hoặc cầu hình (6-1) hoặc cầu hình (6-2) hoặc cầu hình (6-3).

hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q7 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q8 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q9 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q10 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q11 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q12 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q13 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q14 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q15 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q16 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q17 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q18 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I')

trong đó Q là Q19 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q20 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) với đơn vị cấu trúc A1 và trong đó Q là Q16 hoặc Q20 và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) với đơn vị cấu trúc A4 và trong đó Q, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) với đơn vị cấu trúc A23 và trong đó Q, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) với đơn vị cấu trúc A26 và trong đó Q, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) với đơn vị cấu trúc A33 và trong đó Q, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ và n như được xác định

trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I') trong đó

Aa là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab là $=C(H)-$,

Ac là $=C(H)-$,

Ad là $=C(H)-$,

Ae là nitơ hoặc $=C(H)-$,

tốt hơn là dẫn đến các đơn vị cấu trúc sau: A23, A26, A33,

R^1 là methyl hoặc ethyl,

R^2 là hydro hoặc triflometyl,

R^3 là hydro,

R^7 là hydro,

Q là hệ vòng từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q17,

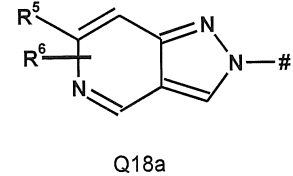
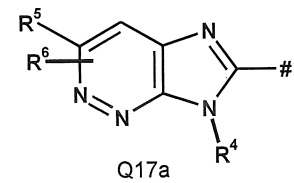
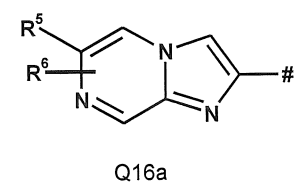
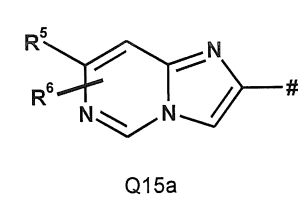
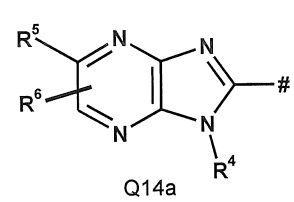
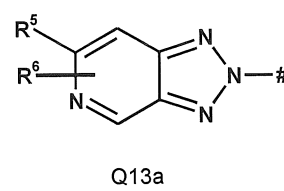
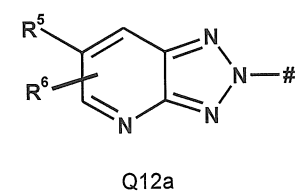
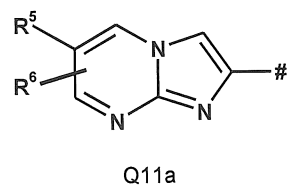
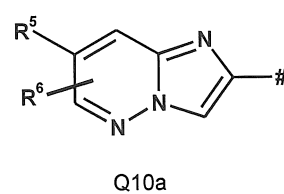
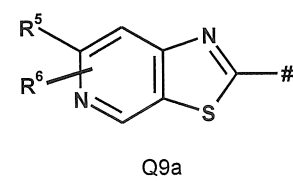
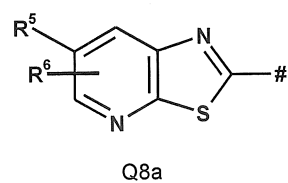
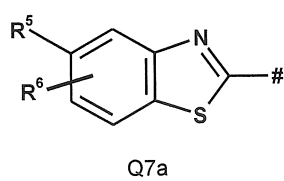
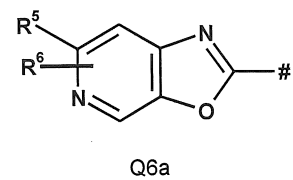
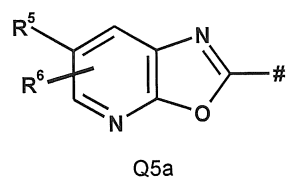
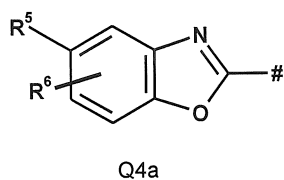
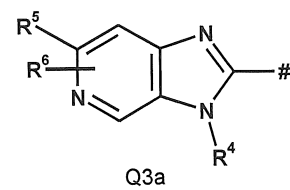
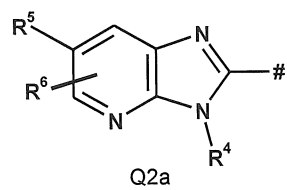
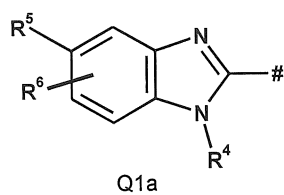
R^4 là methyl,

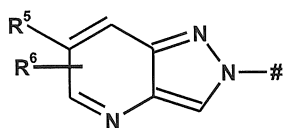
R^5 là triflometyl hoặc pentafluoretyl,

R^6 là hydro,

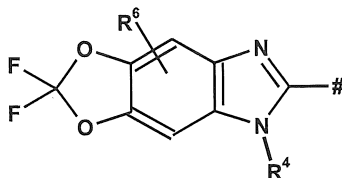
n là 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó Q là các hệ vòng sau:





Q19a



Q20a

trong đó R^6 là hydro và $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trong cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2) hoặc cấu hình (6-3).

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong các định nghĩa được ưu tiên, trừ khi có quy định khác,

halogen là được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn nếu lần lượt từ nhóm bao gồm flo, clo và brom,

Trong các định nghĩa được ưu tiên đặc biệt, trừ khi có quy định khác,

halogen là được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn nếu lần lượt từ nhóm bao gồm flo, clo và brom,

Trong văn cảnh của sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkyl", một mình nó hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ haloalkyl, được hiểu có nghĩa là gốc của nhóm hydrocacbon béo, bão hòa, có 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể là mạch nhánh hoặc không phân nhánh. Ví dụ về các gốc C_1 - C_{12} -alkyl là methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 1-ethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodexyl. Trong số các gốc alkyl này, đặc biệt ưu tiên các gốc C_1 - C_6 -alkyl. Đặc biệt được ưu tiên là các gốc C_1 - C_4 -alkyl.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkenyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C_2 - C_{12} -alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-

hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₂-C₆-alkenyl và được ưu tiên cụ thể là các gốc C₂-C₄-alkenyl.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkynyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C₂-C₁₂-alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₃-C₆-alkynyl và được ưu tiên cụ thể là các gốc C₃-C₄-alkynyl. Gốc alkynyl cũng có thể chứa ít nhất một liên kết đôi.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "xycloalkyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C₃-C₈-xycloalkyl, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₃-C₆-xycloalkyl.

Thuật ngữ "alkoxy", đơn độc hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ haloalkoxy, được hiểu nghĩa là gốc O-alkyl, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định trên đây.

Các gốc được thế halogen, ví dụ, haloalkyl, được halogen hóa một hoặc nhiều lần, lên đến số phần tử thế có thể có tối đa. Trong trường hợp halogen hóa nhiều lần, các nguyên tử halogen có thể giống hoặc khác nhau. Trong trường hợp này, halogen là flo, clo, brom hoặc iot, đặc biệt là flo, clo hoặc brom.

Trừ khi có quy định khác, các gốc tùy ý được thế có thể được thế một lần hoặc nhiều lần, trong đó các phần tử thế trong trường hợp thế nhiều lần có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các định nghĩa hoặc giải thích về các gốc đưa ra trên đây theo kiểu thuật ngữ chung hoặc trong phạm vi ưu tiên áp dụng cho sản phẩm cuối cùng và tương ứng áp dụng cho các nguyên liệu ban đầu và các chất trung gian. Các định nghĩa về các gốc này có thể kết hợp với nhau nếu muốn, nghĩa là bao gồm tổ hợp nằm trong các khoảng ưu tiên tương ứng.

Theo sáng chế ưu tiên sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó có mặt tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây như được ưu tiên.

Theo sáng chế, đặc biệt ưu tiên sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó có mặt tổ hợp các định nghĩa liệt kê trên đây như được ưu tiên đặc biệt.

Theo sáng chế, rất đặc biệt ưu tiên sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó có mặt tổ hợp các định nghĩa liệt kê trên đây như còn được ưu tiên hơn nữa.

Theo sáng chế, cụ thể ưu tiên sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó có mặt tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây như cụ thể được ưu tiên.

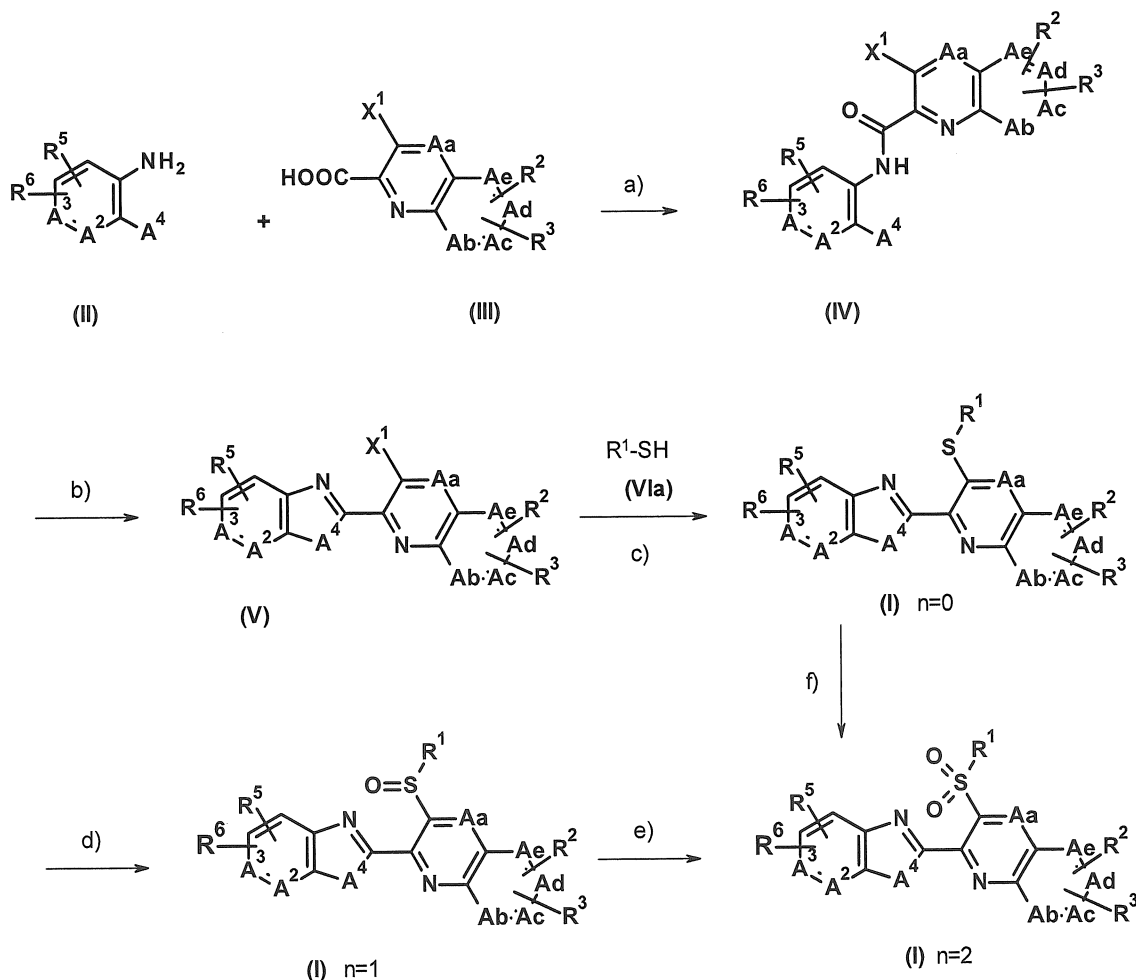
Theo sáng chế, đặc biệt ưu tiên sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') trong đó có mặt tổ hợp các định nghĩa nêu trên như đặc biệt được ưu tiên đặc biệt.

Tùy thuộc vào bản chất của các phân tử thể, các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') có thể ở dạng chất đồng phân hình học và/hoặc chất đồng phân quang hoạt hoặc hỗn hợp đồng phân tương ứng theo các thành phần khác nhau. Các chất đồng phân lập thể này là, ví dụ, chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atrop hoặc chất đồng phân hình học. Do đó, sáng chế bao gồm cả các chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ mong muốn của các chất đồng phân này.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo sáng chế có thể thu được bằng các quy trình được thể hiện trong các sơ đồ sau đây:

Quy trình A-1

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q1 đến Q9 hoặc Q20 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 và WO2015/121136.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Aa, Ab, Ac, Ad, Ae và n như được xác định trên đây, A^2 và A^3 là CH hoặc N (trong đó A^2 và A^3 có thể đều là N), A^4 là O-H, S-H hoặc N(H) R^4 , A^4 cũng có thể là clo, và X^1 là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (IV) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong US5576335 bằng phản ứng giữa các hợp chất có công thức (II) với các axit carboxylic có công thức (III) với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/69257, WO2006/65703, WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 hoặc WO2015/000715.

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong quy trình F.

Phản ứng giữa các hợp chất có công thức (II) với các axit carboxylic có công thức (III) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các chất làm ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, các carbodiimmit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimmit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimmit.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Ưu tiên là sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các hydrocacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Đặc biệt được ưu tiên ở đây là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất chuẩn và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (V) có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (IV), ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 và WO2015/121136.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (V) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ

các dung môi thông thường mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyetan, tert-butyl methyl ete; các hydrocarbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocarbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ, axit, bazơ hoặc tác nhân clo hóa.

Ví dụ về các chất làm ngưng tụ thích hợp là các carbodiimitt như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimitt hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimitt; các anhydrit như anhydrit axetic, anhydrit trifloaxetic; hỗn hợp của triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetracloerua, hoặc hỗn hợp của triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

Ví dụ về các axit thích hợp mà có thể được sử dụng trong phản ứng được mô tả là các axit sulphonit như axit para-toluensulphonit; các axit carboxylic như axit axetic, hoặc các axit polyphosphoric.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); các amin bậc ba như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; các bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrua.

Ví dụ về tác nhân clo hóa thích hợp là phospho oxycloerua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước c)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức (V) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ.

Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ methyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả

trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulphoxit.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây Ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan, ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung bazơ khác. Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Trong phản ứng được mô tả, X^1 tốt hơn là nguyên tử flo hoặc clo.

Tương tự, nếu R^2 hoặc R^3 là halogen (ví dụ clo hoặc flo), ví dụ bằng việc sử dụng methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, cũng có thể thực hiện việc trao đổi nhiều lần với alkyl mercaptan cũng như thế một lần X^1 .

Bước d)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic hoặc natri periodat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 1. Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocarbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước f)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 cũng có thể được điều chế theo quy trình một bước bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocarbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

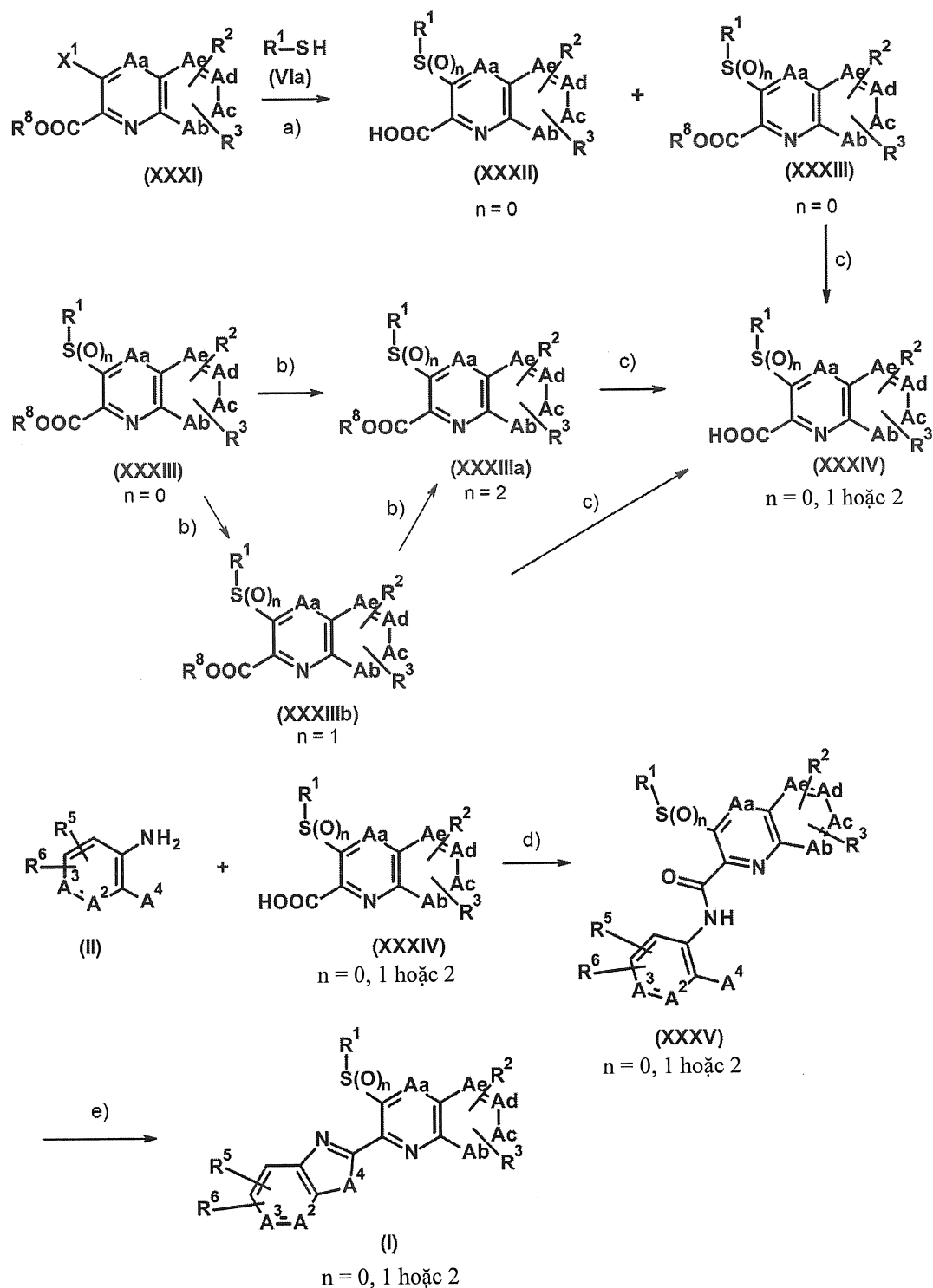
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q_1 đến Q_9 hoặc Q_{20} có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình A-1, bắt đầu từ các axit carboxylic tương ứng có công thức (III^{-A}) hoặc (III^{-B}), các phương pháp điều chế khả dụng đối với các hợp chất này được mô tả trong quy trình G và H.

Tương tự, nếu R^2 hoặc R^3 là alkylsulphanyl, có thể sử dụng tác nhân oxy hóa thích hợp, ví dụ hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic, cũng như bằng cách oxy hóa nguyên tử lưu huỳnh sát cạnh R^1 thành sulphon, để oxy hóa thêm phần tử thế

alkylsulphanyl thành alkylsulphonyl.

Quy trình A-2



Các gốc Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R², R³, R⁵, R⁶ và n như được xác định trên đây, A² và A³ là CH hoặc N, X¹ là halogen, A⁴ là O-H, S-H hoặc N(H)R⁴, A⁴ cũng có thể là

clo, và R⁸ là (C₁-C₄)alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXXII) và (XXXIII) có thể điều chế được bằng cách cho các hợp chất có công thức (XXXI) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ.

Các hợp chất có công thức (XXXI) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ từ các dẫn xuất 2-aminopyridin theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong WO2011/41713 hoặc theo cách tương tự như quy trình F-1 và F-2.

Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XXXII) và (XXXIII) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi; tốt hơn nếu phản ứng này thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulphoxit.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây Ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan, ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung bazơ khác.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XXXIIIb) có thể điều chế được bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (XXXIII). Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Các hợp chất có công thức (XXXIIIa) có thể được điều chế theo cách tương tự bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (XXXIII).

Các hợp chất có công thức (XXXIIIa) có thể được điều chế theo cách tương tự bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (XXXIIIb).

Bước c)

Các hợp chất có công thức (XXXIV) trong đó n là 2 có thể điều chế được bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXXIIIa) với sự có mặt của bazơ. Phản ứng thủy phân này thường được thực hiện trong dung môi. Ưu tiên sử dụng các rượu như metanol hoặc etanol; nước; ete ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xilen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulphoxit; hoặc hỗn hợp của các dung môi đã nêu.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 200°C .

Các hợp chất có công thức (XXXIV) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cách tương tự bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXXIII).

Các hợp chất có công thức (XXXIV) trong đó n là 1 có thể được điều chế theo cách tương tự bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXXIIIb).

Việc chuyển hóa tiếp chất có công thức (XXXIV) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như quy trình A-1.

Bước d)

Các hợp chất có công thức (XXXV) có thể điều chế được bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (XXXIV) với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/069257, US2012/0319050, WO2011/107998 hoặc WO2010/91310.

Phản ứng giữa hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (XXXIV) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xilen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các tác nhân ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI), 1,3-dixyclohexylcarbodiimit, thionyl clorua hoặc oxalyl clorua.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Ưu tiên là sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các hydrocacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Đặc biệt được ưu tiên ở đây là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất chuẩn và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (XXXV) với sự có mặt của bazơ.

Phản ứng chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxietan, tert-butyl methyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

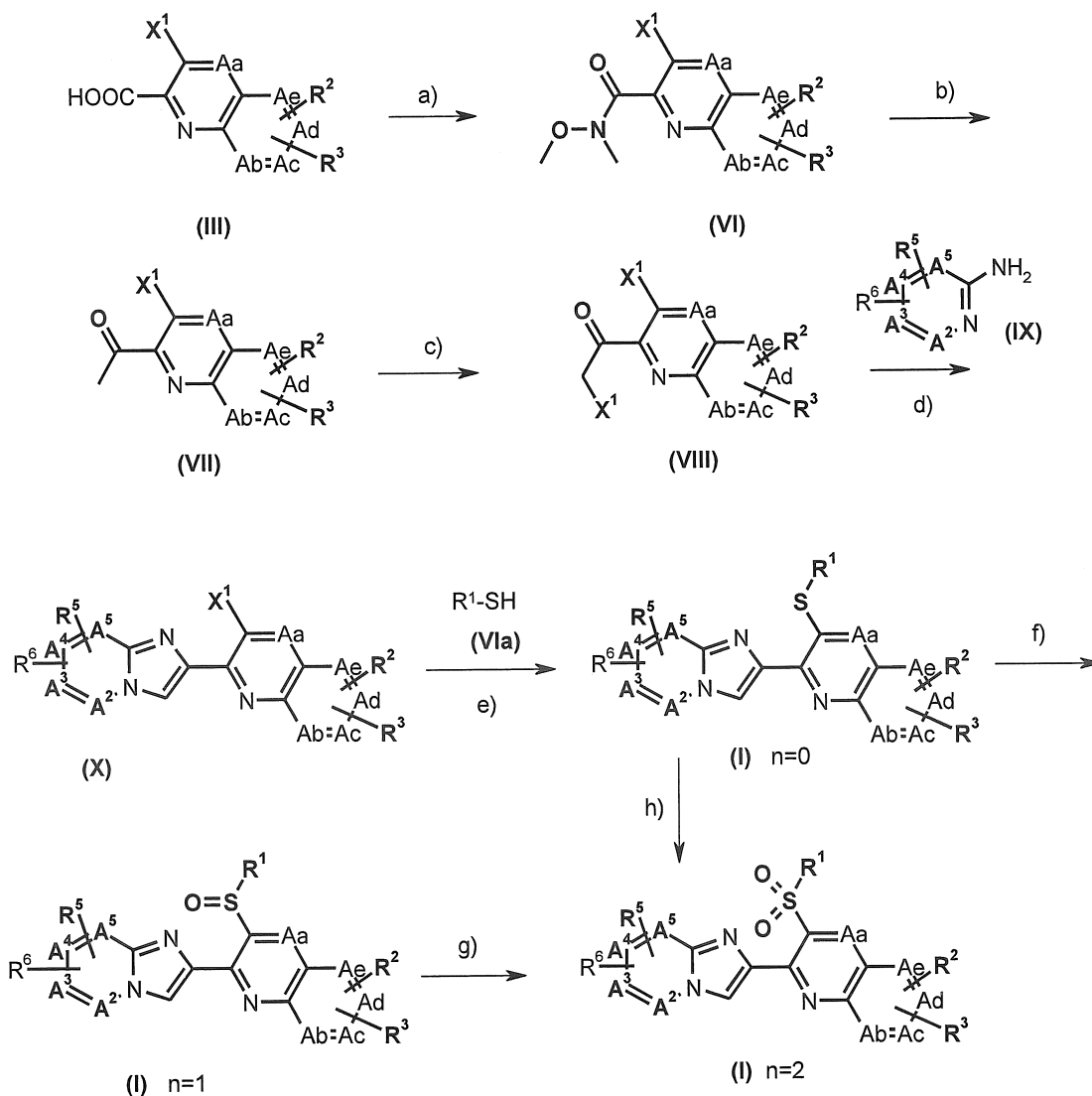
Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Ưu tiên là sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các hydrocacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Đặc biệt được ưu tiên ở đây là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q1 đến Q9 hoặc Q20 có thể điều chế được theo cách tương tự với quy trình A-2.

Quy trình B

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q10, Q11, Q15 hoặc Q16 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298, WO2016/071214 hoặc J. Med. Chem. **31**, (1988) 1590-1595.



Các gốc $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ và n như được xác định trên đây. A^2, A^3, A^4 và A^5 là CH hoặc N (trong đó A^2, A^3, A^4 và A^5 không đều là N) và X^1 là halogen.

Bước a)

Các axit carboxylic có công thức (III) được chuyển đổi theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643 hoặc EP2671582 với sự có mặt của O,N-dimethylhydroxylamin hydroclorua thành amit Weinreb có công thức (VI).

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong quy trình F.

Bước b, c)

Sau đó, các hợp chất có công thức (VI) có thể được chuyển đổi bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643, bằng chất phản ứng Grignard, ví dụ metylmagie bromua thành keton có công thức (VII). Các hợp chất có công thức (VIII) thu được bằng cách halogen hóa sau đó theo cách tương tự, ví dụ, với phương pháp đã biết được mô tả trong US2012/302573.

Bước d)

Các hợp chất có công thức (X) có thể điều chế được bằng cách đóng vòng các hợp chất có công thức (VIII) với các amin có công thức (IX). Phản ứng đóng vòng được thực hiện, ví dụ trong etanol, axetonitril hoặc N,N-dimetylformamit bằng các phương pháp đã biết tương tự, ví dụ, với các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 hoặc J. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595.

Các hợp chất có công thức (IX) có bán trên thị trường.

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức (X) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ. Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ metyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan, ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung bazơ khác.

Bước f, g)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa được thực hiện bằng các phương pháp đã biết bằng cách sử dụng tác nhân oxy hóa thích hợp, ví dụ hydro

peroxit, axit meta-cloperbenzoic hoặc natri periodat.

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 1.

Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước. Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

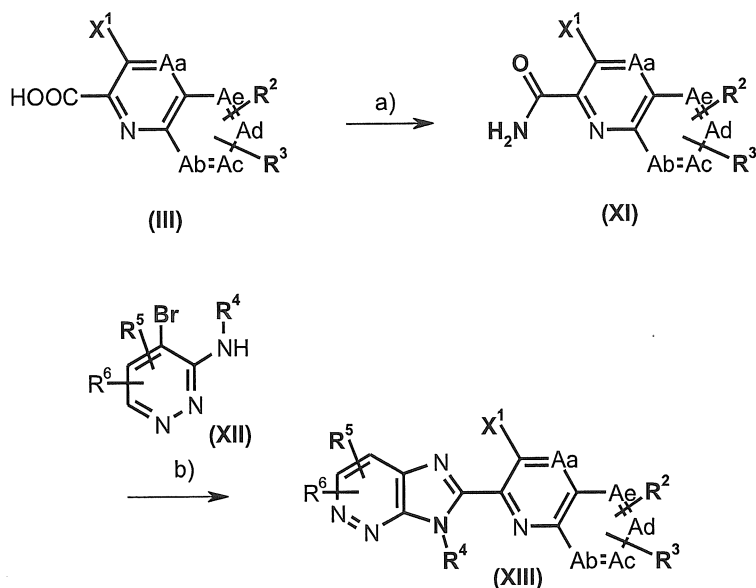
Bước h)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 cũng có thể được điều chế theo quy trình một bước bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước. Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q10, Q11, Q15 và Q16 có thể điều chế được theo cách tương tự với quy trình B.

Quy trình C

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q17 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2014/142292.



Các gốc R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Aa, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. X^1 là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (XI) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu US5374646 hoặc Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096 bằng cách cho hợp chất có công thức (III) phản ứng với nguồn amoniac với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong quy trình F.

Phản ứng của các hợp chất có công thức (III) với nguồn amoniac tốt hơn là được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ dioxan hoặc tetrahydrofuran.

Tác nhân ngưng tụ thích hợp, ví dụ là cacbonyldiimidazol.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 70°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XIII) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy

trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292 bằng cách cho hợp chất có công thức (XI) phản ứng với hợp chất có công thức (XII) với sự có mặt của chất xúc tác paladi trong môi trường bazơ.

Các hợp chất có công thức (XII) có thể được điều chế, ví dụ, theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong WO2014/142292. Chất xúc tác paladi được sử dụng có thể là, ví dụ, [1,1'-bis-(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II). Thông thường các bazơ được sử dụng là bazơ vô cơ như kali tert-butoxit.

Phản ứng được thực hiện trong dung môi. Thông thường toluen được sử dụng.

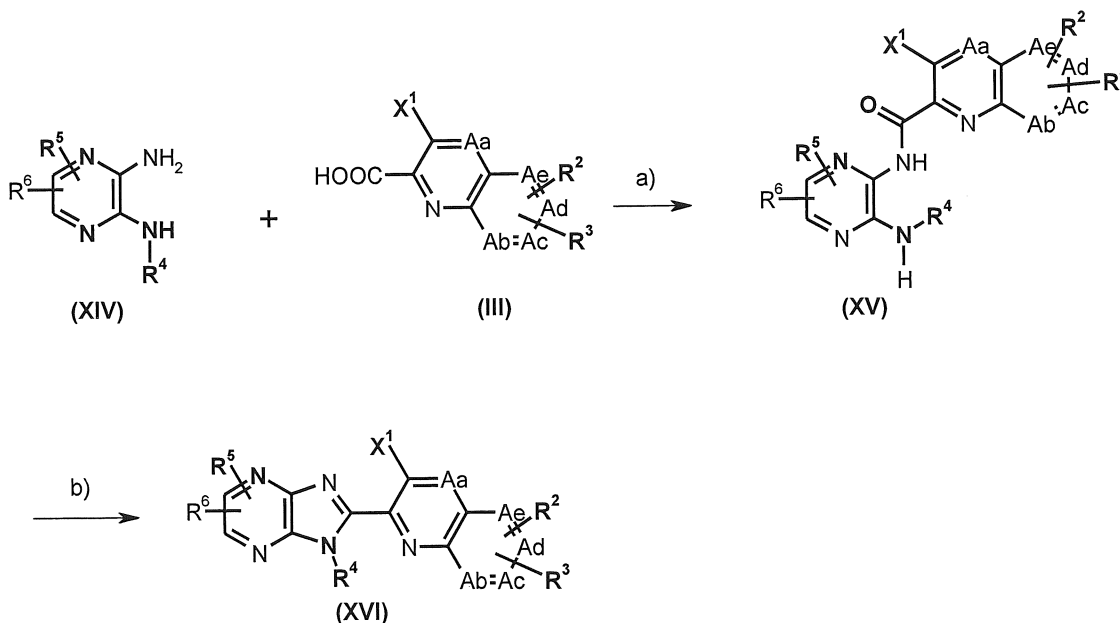
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 110°C.

Việc chuyển hóa tiếp chất có công thức (XIII) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như quy trình A.

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q17 có thể điều chế được theo cách tương tự như quy trình C.

Quy trình D

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q14 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2011/073149.



Các gốc R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Aa, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. X^1 là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XV) có thể điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2011/073149 hoặc US5576335 bằng phản ứng giữa các hợp chất có công thức (XIV) và axit carboxylic có công thức (III) với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (XIV) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2008/51493 hoặc trong tài liệu Bioorganic and Medicinal Chemistry 2014, 22, 13, 3515 – 3526.

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong quy trình F.

Phản ứng giữa hợp chất có công thức (XIV) với axit carboxylic có công thức (III) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các chất làm ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, các carbodiimitt như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimitt hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimitt.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Ưu tiên là sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các hydrocacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại

kiềm thổ. Đặc biệt được ưu tiên ở đây là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất chuẩn và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XVI) có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (XV), ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 và WO2015/000715.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XVI) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracolorua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ, axit, bazơ hoặc tác nhân clo hóa.

Ví dụ về các chất làm ngưng tụ thích hợp là các carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; các anhydrit như anhydrit axetic, anhydrit trifloaxetic; hỗn hợp của triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetracolorua, hoặc hỗn hợp của triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

Ví dụ về các axit thích hợp mà có thể được sử dụng trong phản ứng được mô tả là các axit sulphonie như axit para-toluensulphonie; các axit carboxylic như axit axetic, hoặc các axit polyphosphoric.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); các amin bậc ba như triethylamin và N,N-diisopropyletylamin; các bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrua.

Ví dụ về tác nhân clo hóa thích hợp là phospho oxyclorua.

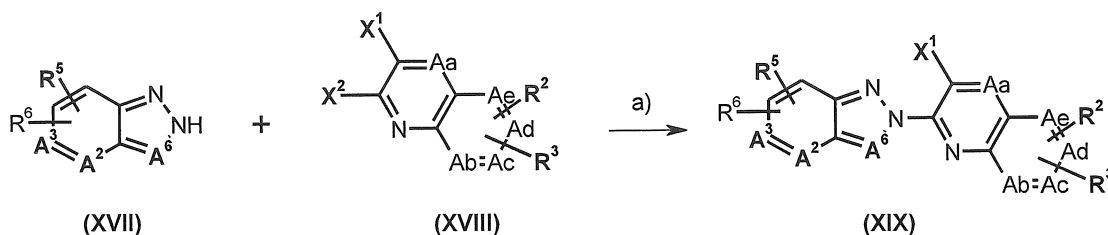
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Việc chuyển hóa tiếp các hợp chất có công thức (XVI) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như quy trình A.

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q14 có thể điều chế được theo cách tương tự như quy trình D.

Quy trình E

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q12, Q13, Q18 hoặc Q19 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2010/091310, WO 2012/66061 hoặc WO2013/099041.



Các gốc R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , Aa, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. A^2 , A^3 và A^6 là CH hoặc N (trong đó A^2 và A^3 không thể đều là N). X^1 và X^2 là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XIX) có thể điều chế được bằng cách cho các hợp chất có công thức (XVII) phản ứng với các hợp chất có công thức (XVIII) trong điều kiện bazơ, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2010/091310, WO 2012/66061, WO2013/099041 hoặc Tetrahedron 1993, 49, 10997-11008.

Các hợp chất có công thức (XVII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2005/100353, WO 2012/66061 hoặc trong tài liệu European Journal

of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214 - 2222.

Các hợp chất có công thức (XVIII) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2013/43518, EP2168965 hoặc trong tài liệu Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 – 1455.

Các bazơ được sử dụng thường là bazơ vô cơ như natri hydrua, kali cacbonat hoặc xeri cacbonat.

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XIX) thường được thực hiện trong dung môi, tốt hơn là nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril, hoặc trong dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon.

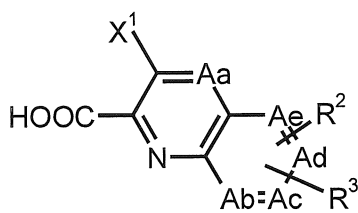
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Theo cách khác, phản ứng của các hợp chất có công thức (XVII) với các hợp chất có công thức (XVIII) để tạo ra các hợp chất có công thức (XIX) cũng có thể được thực hiện bằng cách *N*-aryl hóa có xúc tác paladi, ví dụ theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947.

Việc chuyển hóa tiếp các hợp chất có công thức (XIX) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện theo cách tương tự như quy trình A.

Tương tự, các hợp chất có công thức (I') trong đó Q là Q12, Q13, Q18 và Q19 có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình E.

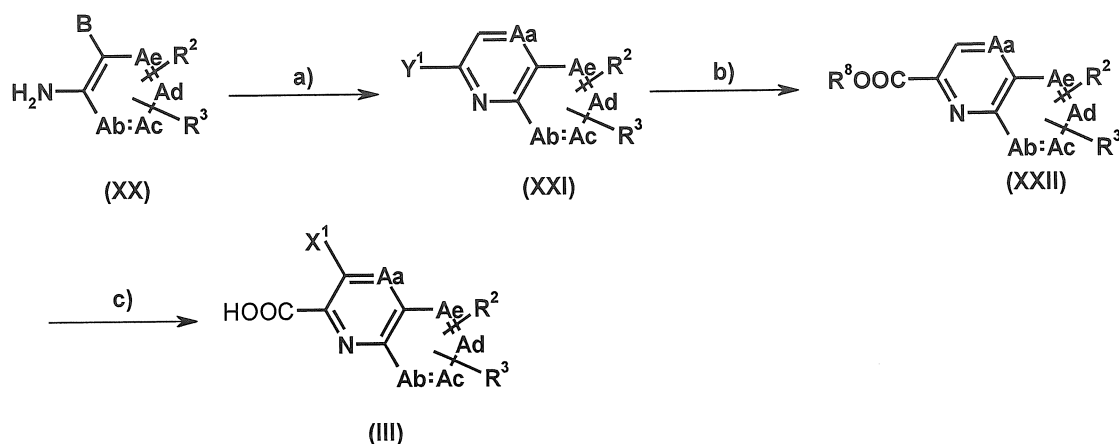
Quy trình F-1



(III)

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ từ aminoaryl, diaminoaryl, aminohetaryl hoặc các dẫn xuất diaminohetaryl theo cách tương tự như các phương pháp được mô tả trong

Journal of the American Chemical Society, 137 (2015), 6168-6171; Journal of the American Chemical Society, 137 (2015), 2996-3003; Synlett, 3 (2006), 379-382; Organic Letters, 14, (2012), 836-839; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Tetrahedron Letters, 41 (2000), 8053-8057; US2013/0225552; Organic Reactions (Hoboken, NJ, United States), 28, 1982; WO2011/150156; JP2009/173589; Synthetic Communications 41 (2011), 1843-1851; Journal of the Chemical Society, (1954), 1879-1882; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Organic & Biomolecular Chemistry, 5 (2007), 61-64; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181; Tetrahedron Letters, 48 (2007), 5371-5374; Chemistry – A European Journal, 20 (2014), 5569-5572; CN103420927, Medicinal Chemistry Research, 22 (2013), 1660-1673; Medicinal Chemistry Letters, 6 (2015), 282-286 và WO2015/071178.



Các gốc R^2 , R^3 , Aa, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. B là hydro, halogen, NH_2 hoặc CHO. X^1 là halogen và Y^1 là halogen, metyl, C(O)OR^8 hoặc xyano. R^8 là hydro hoặc $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXI) trong đó Aa là N có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Tetrahedron Letters, **48** (2007), 5371-5374; Chemistry – A European Journal, **20** (2014), 5569-5572; CN103420927; Medicinal Chemistry Research, **22** (2013), 1660-1673; Medicinal Chemistry Letters, **6** (2015), 282-286, bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (XX) trong đó B là NH_2 với hợp chất cacbonyl trong điều kiện bazơ, axit hoặc nhiệt độ.

Các hợp chất có công thức (XXI) trong đó Aa là CR⁷ có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Journal of the American Chemical Society, **137** (2015), 6168-6171; Journal of the American Chemical Society, **137** (2015), 2996-3003; Synlett, **3** (2006), 379-382; Organic Letters, **14**, (2012), 836-839; Tetrahedron Letters, **41** (2000), 8053-8057; US2013/0225552; Organic Reactions (Hoboken, NJ, United States), **28**, 1982; WO2011/150156; Synthetic Communications **41** (2011), 1843-1851; Journal of the Chemical Society, (1954), 1879-1882; Organic & Biomolecular Chemistry, **5** (2007), 61-64, bằng cách ngưng tụ và sau đó đóng vòng các hợp chất có công thức (XX) trong đó B là hydro, halogen hoặc CHO với hợp chất cacbonyl thích hợp hoặc dẫn xuất axit carboxylic trong điều kiện bazơ, axit hoặc nhiệt độ. Việc chức hóa tiếp ở vị trí số 4 để đưa các gốc loại R⁷ ($\neq$ hydro) có thể được thực hiện, ví dụ như được mô tả trong WO2013/066736 bằng cách halogen hóa; như được mô tả trong Practical Methods for Biocatalysis and Biotransformations **2**, (2012), 153-157 bằng cách hydroxyl hóa; như được mô tả trong Organometallics, **9** (1990), 1778-1784 bằng cách alkyl hóa; như được mô tả trong Journal of Heterocyclic Chemistry, **22** (1985), 353-355 bằng cách amin hóa, hoặc như được mô tả trong WO2010/020981 bằng cách nitrat hóa.

Các hợp chất có công thức (XX) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, chẳng hạn theo cách tương tự như các phương pháp được mô tả trong Chemical Reviews, **12** (1933), 43-179; Chemical Reviews, **57** (1957), 525-581; Journal of Organic Chemistry, **15** (1950), 1224-1232; Recueil Travaux Chimiques des Pays-Bas et de la Belgique, **69** (1950), 468-673; Journal of Chemical Technology and Biotechnology, **37** (1987), 195-202; WO2012/117000; Chemistry – A European Journal, **18** (2012), 16358-16368; Journal of Organic Chemistry, **48** (1983), 1064-1069; Organic Synthesis, **44** (1964), 34-39; Journal of Heterocyclic Chemistry, **23** (1986), 669-672; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **18** (2008), 5023-5026; Journal of Organic Chemistry, **48** (1983), 3401-3408; Journal of Heterocyclic Chemistry, **48** (2011), 1383-1387; WO2003/051366; Helvetica Chimica Acta, **18** (1935), 1229-1239; Synthesis, **1** (1978), 23-24; Organic Synthesis, **19** (1939), 70-72; Canadian Journal of Chemistry, **38** (1960), 2363-2366; Journal of Organic Chemistry, **42** (1977), 3491-3496.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XXII) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXI) (nếu $Y^1 = C(O)OR^8$ hoặc xyano) trong điều kiện bazơ, axit hoặc nhiệt độ.

Các hợp chất có công thức (XXII) có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181 và WO2015/071178, bằng cách oxy hóa benzyl từ các hợp chất có công thức (XXI) (nếu $Y^1 = \text{metyl}$).

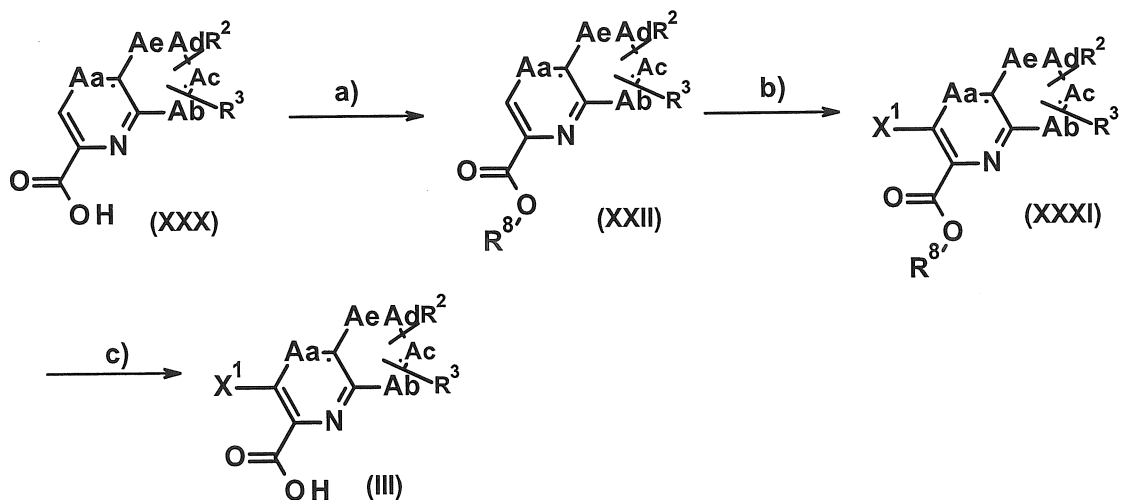
Các hợp chất có công thức (XXII) có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Journal of the American Chemical Society, 135 (2013), 2891-2894; Synlett, 11 (2006), 1663-1666; Helvetica Chimica Acta, 55 (1972), 2295-2300; WO2013/149997 và European Journal of Organic Chemistry, 29 (2014), 6418-6430 bằng cách cacbonyl hóa ($R^8 = \text{alkyl}$) hoặc bằng cách carboxyl hóa ($R^8 = \text{hydro}$) từ các hợp chất có công thức (XXI) (nếu $Y^1 = \text{halogen}$).

Bước c)

Các hợp chất có công thức (III) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (XXII) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion bằng chất phản ứng halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng cách halogen hóa trực tiếp axit carboxylic theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146.

Nếu R^8 là C_1 - C_6 -alkyl, các este carboxylic tương ứng có công thức (XXII), sau khi halogen hóa, có thể được thủy phân trong điều kiện axit hoặc bazơ trong dung môi proton phân cực, như ethanol hoặc metanol, hoặc dung môi phân cực không proton, như tetrahydrofuran, bằng cách sử dụng, ví dụ, axit clohydric loãng hoặc hydroxit kim loại kiềm, thành axit carboxylic có công thức (III).

Quy trình F-2



Các gốc R², R³, Aa, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. X¹ là halogen. R⁸ là C₁-C₆-alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXII) có bán trên thị trường hoặc có thể thu được theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong ChemSusChem 2015, 8, 1916-1925, Chemical Engineering Journal 2015, 271, 269-275, Catalysis Communications 2015, 59, 122-126, Synthetic Communications 2014, 44, 2386-2392, Synthetic Communications 2014, 44, 836-846, Journal of Organic Chemistry 2013, 78, 11606-11611, Organic Letters 2011, 13, 320-323 và Journal of the American Chemical Society 1948, 70, 3135-3136 và các axit carboxylic tương ứng có công thức (XXX) bằng phản ứng este hóa hoặc alkyl hóa trong điều kiện axit hoặc trung tính.

Các hợp chất có công thức (XXX) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng cách thủy phân từ các hợp chất có công thức (XXII).

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất chuẩn và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XXXI) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (XXII) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion

bằng chất phản ứng halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng các halogen hóa trực tiếp axit carboxylic theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146.

Bước c)

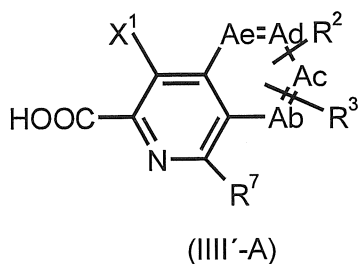
Các hợp chất có công thức (III) are có bán trên thị trường hoặc có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synthesis 1987, 6, 586-587, Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567 hoặc ChemMedChem 2010, 5, 65-78 bằng cách thủy phân từ các hợp chất có công thức (XXXI).

Theo cách khác, các dẫn xuất quinolin có công thức (III) cũng có thể điều chế được theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong Organic Reactions (Hoboken, NJ, United States), 28, 1982 và Journal of Organic Chemistry 2016, 81, 57-65 bằng phản ứng mở rộng vòng của các dẫn xuất indol tương ứng.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là, ví dụ, lithi hydroxit hoặc natri hydroxit. Các dung môi có thể được sử dụng là dung môi không proton và dung môi proton và hỗn hợp của chúng, ví dụ etanol, tetrahydrofuran hoặc nước.

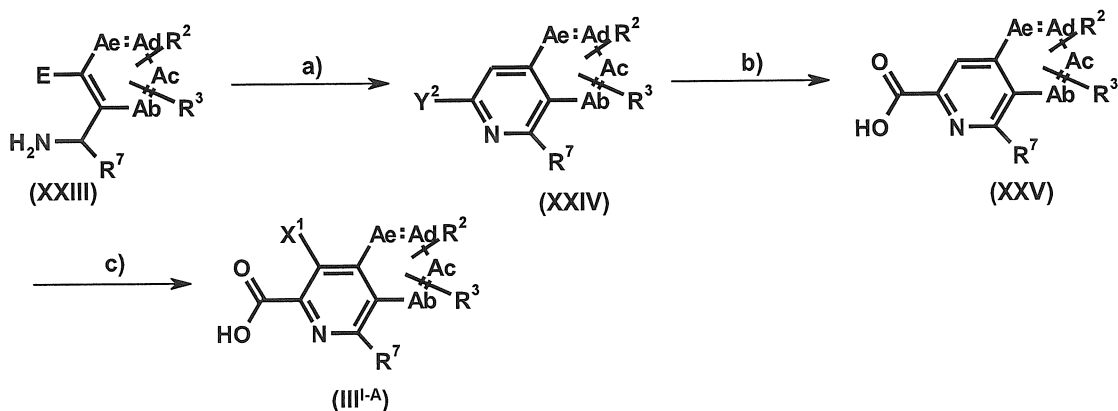
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Quy trình G-1



Các axit carboxylic có công thức (III'-A) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ từ benzylamin hoặc hetarylmetanamin theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Tetrahedron, 40 (1984), 311-314, Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684, Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842;

Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181, WO2015/071178, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146.



Các gốc R², R³, R⁷, Ae, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. E là hydro hoặc halogen và X¹ là halogen. Y² là metyl, C(O)OR⁸ hoặc xyano. R⁸ là hydro hoặc C₁-C₆-alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXIV) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Tetrahedron, 40 (1984), 311-314 or Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684 bằng cách ngưng tụ benzylamin hoặc hetarylmetanamin có công thức (XXIII) với các hợp chất cacbonyl tương ứng trong điều kiện bazơ hoặc axit.

Các hợp chất có công thức (XXIII) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, chẳng hạn theo cách tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO1997/41846; US2011/0105753; Journal of Medicinal Chemistry, 46 (2003), 461-473; WO2010/024430; WO2005/111003; Journal of Heterocyclic Chemistry, 23 (1986), 989-990.

Bước b)

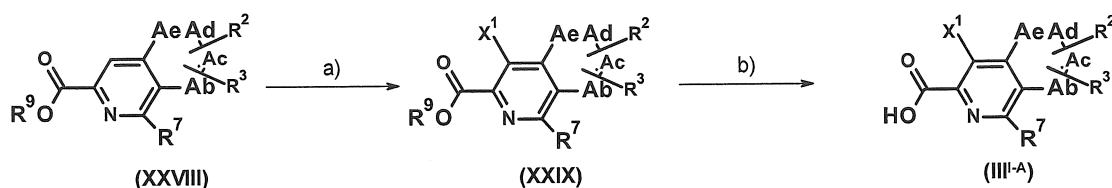
Các hợp chất có công thức (XXV) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXIV) (nếu Y² = C(O)OR⁸ hoặc xyano) trong điều kiện bazơ, axit hoặc nhiệt độ.

Các hợp chất có công thức (XXV) có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181 và WO2015/071178, bằng cách oxy hóa benzyl từ các hợp chất có công thức (XXIV) (nếu $Y^2 = \text{metyl}$).

Bước c)

Các hợp chất có công thức (III'-A) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (XXV) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion bằng chất phản ứng halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng cách halogen hóa trực tiếp axit carboxylic theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146 (xem quy trình F, bước c).

Quy trình G-2



Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXIX) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (XXVIII) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion bằng chất phản ứng halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng cách halogen hóa vòng thơm ái điện tử theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146 (xem quy trình F-1, bước c). Các hợp chất có công thức (XXVIII) có bán trên thị trường hoặc có thể được tổng hợp bằng cách este hóa từ các hợp chất có công thức (XXV).

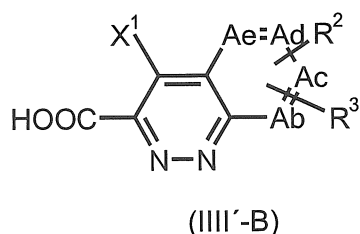
Bước b)

Các hợp chất có công thức (III^{I-A}) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synthesis 1987, 6, 586-587, Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567 hoặc ChemMedChem 2010, 5, 65-78 bằng cách thủy phân từ các hợp chất có công thức (XXIX).

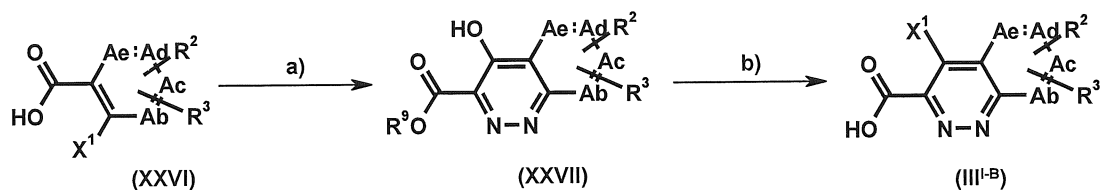
Ví dụ về các bazơ thích hợp là, ví dụ, lithi hydroxit hoặc natri hydroxit. Các dung môi có thể được sử dụng là dung môi không proton và dung môi proton và hỗn hợp của chúng, ví dụ ethanol, tetrahydrofuran hoặc nước.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Quy trình H



Các axit carboxylic có công thức (III'-B) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ từ các axit haloarylcарboxylic hoặc axit haloheteroarylcарboxylic tương ứng theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Science of Synthesis, 16 (2004), 1109-1153 và Journal of Medicinal Chemistry, 58 (2015), 480-511.



Các gốc R², R³, Ab, Ac, Ad và Ae như được xác định trên đây. X¹ là halogen. R⁹ là C₁-C₆-alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXVII) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2004/039802 oder Science of Synthesis, 16 (2004), 1109-1153 bằng cách axetyl hóa alkyl 2-diazoacetat bằng hợp chất có công thức (XXVI), tiếp theo là N-aryl hóa mà tạo ra hệ hai vòng ngưng tụ.

Các hợp chất có công thức (XXVI) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, chẳng hạn theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synthesis, 47 (2015), 1861-1868; Justus Liebigs Annalen der Chemie, (1893), 54-57; Journal of the American Chemical Society, 65 (1943), 476-477; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Organic Letters, 10 (2008), 2701-2704; Journal de Pharmacie de Belgique, 22 (1967), 257-263; Journal of Organic Chemistry, 60 (1995), 292-296; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 23 (2013), 1846-1852; JP2012/092060; EU1983/92117; Tetrahedron, 71 (2015), 252-258.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (III^{-B}) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng cách clo hóa bằng phospho oxyclorua của các hợp chất có công thức (XXVII), như được mô tả trong Journal of Medicinal Chemistry, 58 (2015), 480-511.

Các phương pháp và sử dụng

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ động vật gây hại, trong đó, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được cho tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng. Việc phòng trừ động vật gây hại tốt hơn được tiến hành trong nông nghiệp và lâm nghiệp, và trong bảo vệ nguyên liệu. This tốt hơn là loại trừ các phương pháp điều trị ngoại khoa hoặc điều trị bằng thuốc trên cơ thể người hoặc động vật và các phương pháp chẩn đoán thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Sáng chế còn đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') làm chất diệt sinh vật gây hại, đặc biệt là làm chất bảo vệ cây trồng.

Trong ngữ cảnh của đơn sáng chế này, thuật ngữ "chất diệt sinh vật gây hại" trong từng trường hợp cũng luôn bao gồm thuật ngữ "chất bảo vệ cây trồng".

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật máu nóng và tương thích tốt với môi trường, thích hợp để bảo vệ thực vật và các cơ quan của thực vật chống lại các yếu tố bất lợi sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu sau thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, nhất là côn trùng, nhện, giun sán, đặc biệt là giun tròn và động vật thân mềm thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi động vật, trong nuôi trồng thủy sản, trong lâm nghiệp, trong

các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu lưu kho, và trong lĩnh vực vệ sinh.

Trong ngữ cảnh của đơn sáng chế này, thuật ngữ "vệ sinh" cần được hiểu nghĩa là bất kỳ và tất cả các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình nhằm mục đích ngăn ngừa bệnh, đặc biệt là bệnh do nhiễm trùng, và bảo vệ sức khỏe con người và động vật và/hoặc bảo vệ môi trường và/hoặc giữ sạch sẽ. Theo sáng chế, thuật ngữ này đặc biệt bao gồm các biện pháp làm sạch, khử trùng và tiệt trùng, ví dụ vải hoặc các bề mặt cứng, đặc biệt là bề mặt làm từ thủy tinh, gỗ, xi măng, đồ sứ, đồ gốm, chất dẻo hoặc (các) kim loại, để đảm bảo rằng không có các loài gây hại về mặt vệ sinh và/hoặc chất tiết của chúng. Phạm vi bảo hộ của sáng chế về mặt này thì tốt hơn là không bao gồm quy trình điều trị bằng phẫu thuật hoặc bằng liệu pháp cần áp dụng cho cơ thể người hoặc cơ thể động vật, và quy trình chẩn đoán được tiến hành trên cơ thể người hoặc cơ thể động vật.

Thuật ngữ "khu vực vệ sinh" bao gồm tất cả các vùng, khu vực kỹ thuật và ứng dụng công nghiệp trong đó các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình vệ sinh là quan trọng, ví dụ vệ sinh trong bếp, lò bánh, sân bay, phòng tắm, bể bơi, trung tâm thương mại, khách sạn, bệnh viện, quầy hàng, trại nuôi động vật, v.v.

Thuật ngữ "sinh vật gây hại về mặt vệ sinh" do đó cần được hiểu nghĩa là một hoặc nhiều động vật gây hại mà sự có mặt của chúng trong khu vực vệ sinh là có vấn đề, đặc biệt vì lý do sức khỏe. Do đó mục đích chính là tránh, hoặc hạn chế đến mức tối thiểu, sự có mặt của các sinh vật gây hại về mặt vệ sinh và/hoặc sự phơi nhiễm với chúng trong khu vực vệ sinh. Điều này đặc biệt có thể đạt được bằng cách sử dụng chất diệt sinh vật gây hại mà được dùng cả để ngăn ngừa sự phá hoại và để ngăn chặn sự phá hoại đã có. Cũng có thể sử dụng các chế phẩm mà ngăn ngừa hoặc giảm sự phơi nhiễm với các sinh vật gây hại. Các sinh vật gây hại về mặt vệ sinh bao gồm, ví dụ, các sinh vật được nêu sau đây.

Thuật ngữ "bảo vệ vệ sinh" do đó bao gồm tất cả các hoạt động nhà nhờ đó duy trì và/hoặc cải thiện các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình vệ sinh.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') tốt hơn là có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại. Các hợp chất này có hoạt tính chống lại các loài mẫn cảm và kháng thông thường và còn chống lại tất cả hoặc một số giai đoạn phát triển. Các sinh vật gây hại đề cập trên đây bao gồm:

các sinh vật gây hại thuộc ngành chân khớp (Arthropoda), nhất là từ lớp nhện (Arachnida), ví dụ *Acarus* spp., ví dụ *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., ví dụ *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranynchus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., ví dụ *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., ví dụ *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., ví dụ *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., ví dụ *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., ví dụ *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., ví dụ *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., ví dụ *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., ví dụ *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., ví dụ *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

từ lớp Chilopoda, ví dụ, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

thuộc bộ hoặc lớp đuôi bật (Collembola), ví dụ *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

thuộc lớp chân kép (Diplopoda), ví dụ *Blaniulus guttulatus*;

thuộc lớp côn trùng (Insecta), ví dụ thuộc bộ gián (Blattodea), ví dụ *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostylopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., ví dụ *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

thuộc bộ cánh cứng (Coleoptera), ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dụ *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., ví dụ *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*,

Otiorhynchus rugosostriatus, Otiorhynchus sulcatus, Oulema spp., ví dụ Oulema melanopus, Oulema oryzae, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, Phyllotreta spp., ví dụ Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Prostephanus truncatus, Psylliodes spp., ví dụ Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Rhynchophorus spp., Rhynchophorus ferrugineus, Rhynchophorus palmarum, Sinoxylon perforans, Sitophilus spp., ví dụ Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., ví dụ Sternechus paludatus, Symphyletes spp., Tanymericus spp., ví dụ Tanymericus dilaticollis, Tanymericus indicus, Tanymericus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauretanicus, Tribolium spp., ví dụ Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., ví dụ Zabrus tenebrioides;

thuộc bộ cánh da (Dermaptera), ví dụ Anisolabis maritime, Forficula auricularia, Labidura riparia;

thuộc bộ hai cánh (Diptera), ví dụ Aedes spp., ví dụ Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agromyza spp., ví dụ Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., ví dụ Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., ví dụ Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysozona pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., ví dụ Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., ví dụ Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiseta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., ví dụ Dasineura brassicae, Delia spp., ví dụ Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., ví dụ Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnemus spp., Euleia heraclei, Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrellia spp., Hydrellia griseola, Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., ví dụ Liriomyza brassicae,

Liriomyza huidobrensis, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* oder *Pegomyia* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophila casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ cánh nửa Hemiptera, ví dụ *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederæ*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., ví dụ *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp., ví dụ *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., ví dụ *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., ví dụ *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*,

Empoasca maligna, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., ví dụ *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., ví dụ *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., ví dụ *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., ví dụ *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., ví dụ *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., ví dụ *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., ví dụ *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigonicella spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., ví dụ *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., ví dụ *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenerae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., ví dụ *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., ví dụ *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., ví dụ *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., ví dụ *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., ví dụ *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., ví dụ *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., ví dụ *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., ví dụ *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*,

Tenalaphara malayensis, *Tetranocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., ví dụ *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., ví dụ *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

thuộc phân bộ cánh không đều (Heteroptera), ví dụ *Aelia* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., ví dụ *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., ví dụ *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurydema* spp., *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptocoris varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., ví dụ *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., ví dụ *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Megacopta cribraria*, *Miridae*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., ví dụ *Nezara viridula*, *Nysius* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., ví dụ *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

từ bộ cánh màng (Hymenoptera), ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., ví dụ *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema* (*Iridomyrmex*) *humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocera* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

từ bộ chân đều (Isopoda), ví dụ *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

Từ bộ cánh bằng (Isoptera), , ví dụ *Coptotermes* spp., ví dụ *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Kaloterme* spp., *Microtermes obesi*, *Nasutitermes* spp., *Odontotermes* spp., *Porotermes* spp., *Reticulitermes* spp., ví dụ *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

từ bộ cánh vảy (Lepidoptera) ví dụ *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., ví dụ *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., ví dụ *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., ví dụ *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., ví dụ *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroplote* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., ví dụ *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp., *Eudocima* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., ví dụ *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., ví dụ *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., ví dụ *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., ví dụ *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., ví dụ *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., ví dụ *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., ví dụ *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., ví dụ *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphis* spp., *Operophtera* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., ví dụ *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., ví dụ *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., ví dụ *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., ví dụ *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., ví dụ *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp.,

Protoparce spp., *Pseudaletia* spp., ví dụ *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia* bao gồm *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., ví dụ *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., ví dụ *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., ví dụ *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., ví dụ *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stenoma* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

thuộc bộ cánh thẳng (*Orthoptera* hoặc *Saltatoria*), ví dụ *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., ví dụ *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., ví dụ *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., ví dụ *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

thuộc bộ chấy (*Phthiraptera*), ví dụ *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

thuộc bộ rệp, sáp, mọt (*Psocoptera*), ví dụ *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

thuộc bộ cánh ống (*Siphonaptera*), ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalogenus* spp., ví dụ *Ctenocephalogenus canis*, *Ctenocephalogenus felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

thuộc bộ cánh tơ (*Thysanoptera*), ví dụ *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Chaetanaphothrips leeuweni*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., ví dụ *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Haplothrips* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., ví dụ *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

thuộc bộ ba đuôi (*Zygentoma*) (= *Thysanura*), ví dụ *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

thuộc lớp rết tơ (*Symphyla*), ví dụ *Scutigera* spp., ví dụ *Scutigera immaculata*;

sinh vật gây hại thuộc ngành thân mềm (Mollusca), ví dụ thuộc lớp hai mảnh vỏ (Bivalvia), ví dụ *Dreissena* spp;

và cả từ lớp chân bụng (Gastropoda), ví dụ *Arion* spp., ví dụ *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., ví dụ *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

các sinh vật gây hại thực vật thuộc ngành giun tròn (Nematoda), tức là giun tròn ký sinh trên thực vật, cụ thể là *Aglenchus* spp., ví dụ *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., ví dụ *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., ví dụ *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., ví dụ *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., ví dụ *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., ví dụ *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., ví dụ *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., ví dụ *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., ví dụ *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., ví dụ *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., ví dụ *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., ví dụ *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., ví dụ *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., ví dụ *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paralongidorus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., ví dụ *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., *Pratylenchus* spp., ví dụ *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., ví dụ *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., ví dụ *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., ví dụ *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., ví dụ *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., ví dụ *Xiphinema index*.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), ở nồng độ hoặc tỷ lệ áp dụng nhất định, nếu có thể, cũng có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc các chất cải thiện đặc tính của thực vật, làm chất diệt vi sinh vật

hoặc chất diệt giao tử, ví dụ làm chất diệt nấm, chất chống nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt virus (bao gồm cả các chất chống viroid) hoặc làm chất chống sinh vật giống mycoplasma (MLO - mycoplasma-like organisms) và sinh vật giống rickettsia (RLO - rickettsia-like organisms). Nếu có thể, chúng cũng có thể được sử dụng dưới dạng các hợp chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các thành phần hoạt tính khác.

Các chế phẩm

Sáng chế còn đề cập đến các chế phẩm và dạng sử dụng được phối chế từ các chế phẩm này làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ các dung dịch để ngâm, nhúng và phun, chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'). Tùy ý, các dạng sử dụng còn chứa thêm chất diệt sinh vật gây hại và/hoặc chất phụ gia để cải thiện hoạt động, như chất thấm, ví dụ, dầu thực vật, ví dụ dầu hạt cải, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ dầu parafin, alkyl este của axit béo thực vật, ví dụ methyl este của dầu cải dầu hoặc methyl este của dầu đậu nành hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất loang, ví dụ alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ amoni sulphat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng duy trì, ví dụ các polyme của dioctyl sulphosuxinat hoặc hydroxypropylguar và/hoặc chất giữ ẩm, ví dụ glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

Các chế phẩm thông thường là, ví dụ, dạng chất lỏng hòa tan trong nước (SL), nhũ tương đặc (EC), nhũ tương trong nước (EW), huyền phù đặc (SC, SE, FS, OD), dạng hạt phân tán trong nước (WG), dạng hạt (GR) và dạng cô bao nang (CS); các chế phẩm này và các chế phẩm loại khác được mô tả, ví dụ, bởi Crop Life International và trong tài liệu Pesticide Specifications, Manual on development and use của FAO và WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, được ban hành bởi FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Các chế phẩm này, ngoài một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), còn tùy ý chứa thêm các hoạt chất hóa nông.

Ưu tiên là các chế phẩm điều chế này hoặc các dạng sử dụng của chúng chứa chất bổ trợ, ví dụ chất độn, dung môi, chất tăng cường khả năng tự phát, chất mang, chất nhũ hóa, chất phân tán, chất bảo vệ chống sương giá, chất diệt sinh vật, chất cô đặc và/hoặc các chất bổ trợ khác, ví dụ chất phụ gia. Chất phụ gia trong bối cảnh này là thành phần

làm tăng cường tác dụng sinh học của chế phẩm, nhưng bản thân thành phần này không có bất kỳ tác dụng sinh học nào. Ví dụ về chất phụ gia đó là các chất làm đầy mạnh sự duy trì, lan rộng, bám dính lên bề mặt lá hoặc tăng tính thấm.

Các chế phẩm này được phối chế theo phương thức đã biết, ví dụ bằng cách trộn các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với chất phụ trợ, ví dụ chất độn, dung môi và/hoặc chất mang rắn và/hoặc chất phụ trợ khác, ví dụ chất hoạt động bề mặt. Các chế phẩm này được sản xuất trong các cơ sở thích hợp hoặc ở nơi khác trước hoặc trong quá trình ứng dụng.

Chất phụ trợ được sử dụng có thể là các chất thích hợp để tạo ra đặc tính đặc biệt, như các đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học nhất định, cho chế phẩm chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), hoặc cho các dạng sử dụng được phối chế từ các chế phẩm này (ví dụ, các chất diệt sinh vật gây hại dùng được ngay như dung dịch phun hoặc các sản phẩm phủ ngoài hạt).

Các chất độn thích hợp, ví dụ nước, các dung dịch hóa chất hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ các loại hydrocacbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), các rượu và polyol (nếu thích hợp, các loại này cũng có thể được thế, este hóa và/hoặc este hóa), các keton (như axeton, xyclohexanon), các este (bao gồm chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton đơn giản và được thế, các sulphon và sulphoxit (như dimetyl sulphoxit).

Nếu chất độn được sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, các dung môi hữu cơ làm trợ dung môi. Các dung môi lỏng hữu dụng về cơ bản là: các dung môi thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, dung môi thơm clo hóa hoặc các hydrocacbon béo clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexanon hoặc parafin, ví dụ, các phân đoạn dầu khoáng, dầu khoáng và dầu thực vật, các rượu như butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, các xeton như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit và dimetyl sulphoxit, và cả nước.

Về nguyên tắc, có thể sử dụng tất cả các dung môi thích hợp. Ví dụ về các dung môi thích hợp là các hydrocacbon thơm, ví dụ xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, các hydrocacbon thơm hoặc béo clo hóa, ví dụ clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua,

các hydrocacbon béo, ví dụ xyclohexan, parafin, các phân đoạn dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, các rượu ví dụ metanol, etanol, isopropanol, butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, các keton ví dụ axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon, các dung môi phân cực mạnh ví dụ dimetyl sulphoxit, và nước.

Về nguyên tắc, có thể sử dụng tất cả các chất mang thích hợp. Các chất mang hữu dụng đặc biệt bao gồm, ví dụ, các muối amoni và đa nghiền mịn tự nhiên như cao lanh, các alumin, talc, đá phấn, thạch anh, atapulgit, monmorilonit hoặc đất diatomit, và các đá nghiền mịn tổng hợp như silic dioxit phân tán, nhôm oxit và các silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, các nhựa, sáp và/hoặc phân bón rắn. Cũng có thể sử dụng hỗn hợp của các chất mang này. Chất mang hữu dụng cho hạt bao gồm: ví dụ đá tự nhiên nghiền và phân mảnh như canxit, đá hoa, đá bột, sepiolit, dolomit và các hạt tổng hợp từ bột vô cơ và hữu cơ, và cả hạt từ vật liệu hữu cơ như mùn cưa, giấy, vỏ dừa, lõi ngô và cuộng thuốc lá.

Cũng có thể sử dụng các chất độn hoặc dung môi khí hóa lỏng. Các chất độn hoặc chất mang đặc biệt thích hợp là các chất ở trạng thái khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và áp suất khí quyển, ví dụ chất đẩy sol khí như các hydrocacbon được halogen hóa, và cả butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Ví dụ về chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc chất làm ẩm có các đặc tính ion hoặc không ion, hoặc hỗn hợp của các chất hoạt động bề mặt này, đó là các muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulphonic, muối của axit phenolsulphonic hoặc axit naphtalensulphonic, chất đa trùng ngưng của etylen oxit với các rượu béo hoặc với các axit béo hoặc với các amin béo, với các phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulphosuxinic, các dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), các este phosphoric của các rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, các este của axit béo của các polyol, và các dẫn xuất của hợp chất chứa sulphat, sulphonat và phosphat, ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulphonat, alkyl sulphat, arylsulphonat, sản phẩm thủy phân protein, dịch thải lignosulphit và metylxenluloza. Sự có mặt của chất hoạt động bề mặt là có lợi nếu một trong số các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và/hoặc một trong số các chất mang trợ không hòa tan được trong nước và khi việc áp dụng được thực hiện trong nước.

Các chất phụ trợ khác mà có thể có mặt trong các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này bao gồm chất màu như chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và xanh Prussian, và chất màu hữu cơ như chất màu alizarin, chất màu azo và chất màu kim loại phtaloxyanin, và các chất dinh dưỡng và các vi chất dinh dưỡng như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molybden và kẽm.

Các thành phần bổ sung có thể có mặt là các chất ổn định, như các chất ổn định nhiệt độ thấp, chất bảo quản, chất chống oxy hoá, chất ổn định ánh sáng hoặc các tác nhân khác giúp cải thiện tính ổn định hoá học và/hoặc vật lý. Các chất tạo bọt hoặc các chất chống tạo bọt cũng có thể có mặt.

Ngoài ra, các chế phẩm và dạng sử dụng thu được từ đó cũng có thể chứa, làm các chất bổ trợ bổ sung, chất kết dính như cacboxymethylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gôm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, hoặc ngoài ra cả các phospholipit tự nhiên như các xephalin và các lexithin và các phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ khác cũng có thể là dầu khoáng hoặc dầu thực vật.

Nếu thích hợp, các chất bổ trợ khác cũng có thể có mặt trong chế phẩm và các dạng sử dụng dẫn xuất từ chúng. Ví dụ về các chất phụ gia như vậy là chất tạo hương, các chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất dính kết, chất cô đặc, chất sol-gel thuận nghịch, chất thấm, chất tăng cường khả năng duy trì, chất ổn định, chất chelat hóa, chất tạo phức, chất giữ ẩm, chất phát tán. Nói chung, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được kết hợp với chất phụ gia rắn hoặc lỏng bất kỳ thường dùng cho các mục đích phối chế.

Chất tăng cường khả năng duy trì hữu dụng bao gồm tất cả các chất mà làm giảm sức căng bề mặt sức căng bề mặt động lực, ví dụ dioctyl sulphosuxinat, hoặc làm tăng tính nhớt đàn hồi, ví dụ các polyme hydroxypropylguar.

Chất thấm thích hợp trong ngữ cảnh sáng chế là tất cả các chất mà thường được sử dụng để cải thiện tính thấm của các hoạt chất hóa nông vào thực vật. Các chất thấm được xác định trong ngữ cảnh này bằng khả năng thấm của chúng từ chất lỏng áp dụng (thường ở dạng nước) và/hoặc từ lớp phun phủ vào trong biểu bì của thực vật và do đó làm tăng khả năng di chuyển của các hoạt chất trong biểu bì. Phương pháp mô tả trong tài liệu (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác

định đặc tính này. Các ví dụ bao gồm rượu alkoxyat như etoxyat béo của dừa (10) hoặc isotridexyl etoxyat (12), este axit béo, ví dụ metyl este dầu hạt cải hoặc metyl este dầu đậu nành, alkoxyat amin béo, ví dụ tallowamin etoxyat (15), hoặc các muối amoni và/hoặc phosphoni, ví dụ amoni sulphat hoặc diamoni hydrophosphat.

Tốt hơn nếu các chế phẩm này chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với lượng nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 98% khối lượng, tốt hơn nữa là chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với lượng từ 0,01% đến 95% khối lượng, tốt nhất là chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với lượng từ 0,5% đến 90% khối lượng so với khối lượng của chế phẩm.

Hàm lượng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') trong các dạng sử dụng được phối chế từ các chế phẩm này (cụ thể là các chất diệt sinh vật gây hại) có thể thay đổi trong các phạm vi rộng. Nồng độ của hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') trong các dạng sử dụng thường có thể nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 95% khối lượng, tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,00001% đến 1% khối lượng, tính theo khối lượng của dạng sử dụng. Việc áp dụng được thực hiện theo cách thông thường thích hợp với dạng sử dụng.

Hỗn hợp

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cũng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp cùng với một hoặc nhiều chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt loài nhuyễn thể, chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, tác nhân vi sinh vật, các sinh vật có lợi, chất diệt cỏ, phân bón, chất xua đuổi chim, chất bổ thực vật, chất khử trùng, chất an toàn, chất truyền tín hiệu và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật thích hợp, bằng cách đó, ví dụ, để mở rộng phổ tác động, kéo dài thời gian tác động, tăng tỷ lệ tác động, ngăn chặn sự đẩy ngược hoặc ngăn chặn sự phát triển tính kháng. Ngoài ra, các hỗn hợp hoạt chất thuộc loại này có thể giúp cải thiện sự phát triển của thực vật và/hoặc khả năng chịu các yếu tố phi sinh học, ví dụ nhiệt độ cao hoặc thấp, khả năng chịu được hạn hán hoặc chịu được hàm lượng nước tăng cao hoặc độ mặn của đất. Cũng có thể cải thiện đặc tính trổ hoa và kết trái, tối ưu hóa khả năng nảy mầm và phát triển rễ, tạo thuận lợi cho việc thu hoạch và cải thiện năng suất, tác động lên quá trình chín, cải thiện chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của các sản phẩm thu hoạch, kéo dài thời gian bảo quản và/hoặc cải thiện khả năng xử lý của các sản phẩm thu hoạch.

Ngoài ra, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể có mặt ở dạng hỗn hợp cùng với các hoạt chất hoặc chất truyền tín hiệu khác như chất hấp dẫn và/hoặc chất xua đuổi chim và/hoặc chất kích hoạt và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật và/hoặc phân bón. Tương tự, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được sử dụng để cải thiện các đặc tính của thực vật, ví dụ, khả năng sinh trưởng, năng suất và chất lượng của nguyên liệu sau thu hoạch.

Theo một phương án cụ thể của sáng chế, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có trong các chế phẩm hoặc các dạng sử dụng được phối chế từ các chế phẩm này ở dạng hỗn hợp cùng với các hợp chất khác, tốt hơn là các hợp chất như được mô tả sau đây.

Nếu như một trong các hợp chất nêu dưới đây có thể xuất hiện ở các dạng hỗn hợp khác nhau, thì các dạng này cũng được bao gồm thậm chí ngay cả không được nêu một cách rõ ràng trong mỗi trường hợp. Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập, trong trường hợp có thể, có thể tạo ra muối với bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng.

Chất diệt côn trùng/chất diệt ve bét/chất diệt giun tròn

Các hoạt chất được xác định rõ ở đây bằng tên chung của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ trong tài liệu "The Pesticide Manual", 16th ed., British Crop Protection Council 2012, hoặc có thể được tìm thấy trên Internet (ví dụ, trang web với địa chỉ <http://www.alanwood.net/pesticides>). Việc phân loại dựa trên hệ thống phân loại IRAC Mode of Action Classification Scheme áp dụng ở thời điểm nộp đơn sáng chế này.

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ các carbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfurcarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các hợp chất cơ phosphat, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chloropyrifos-metyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-

(methoxyaminothiophosphoryl) salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

(2) Các chất phong bế kênh clorua qua cổng GABA, ví dụ, các xyclodien-clo hữu cơ, ví dụ, chlordane và endosulfan hoặc các phenylpyrazol (các fiprol), ví dụ ethiprol và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ các pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin S-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, chất đồng phân cyphenothrin [(1R)-trans], deltamethrin, chất đồng phân empenthrin [(EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momflothrins, permethrin, phenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], prallethrin, các pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [(chất đồng phân (1R))], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxychlor.

(4) Các chất điều biến cạnh tranh với thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic axetylcholine receptor - nAChR) ví dụ, các neonicotinoid, ví dụ, acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam hoặc nicotin hoặc sulfoxaflor hoặc flupyradifuron.

(5) Các chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nAChR), ví dụ các spinosyn, ví dụ spinetoram và spinosad.

(6) Các chất điều biến dị lập thể kênh clorua qua cổng glutamat (Glutamate-gated chloride channel - GluCl), ví dụ, các avermectin/các milbemycin, ví dụ, abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất giả hormon Juvenile, ví dụ, các chất tương tự hormon juvenile, ví dụ hydroprene, kinoprene và methoprene hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

((8) Các chất ức chế không đặc hiệu (đa điểm) hỗn tạp, ví dụ, các alkyl halogenua, ví dụ, metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc chloropicrin hoặc sulphuryl florua hoặc thuốc gây nôn borax hoặc tartar hoặc chất tạo metyl isoxyanat, ví dụ diazomet và metam.

(9) Các chất điều biến cơ quan dây âm, ví dụ pymetrozine hoặc flonicamide.

(10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét, ví dụ clofentezine, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.

(11) Các vi khuẩn phá vỡ màng ruột giữa của côn trùng, ví dụ *Bacillus thuringiensis* loài phụ *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *tenebrionis* và các protein thực vật *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.

(12) Các chất ức chế ATP synthaza ty thể, như các chất phá hủy như ATP, ví dụ, diafenthuron hoặc các hợp chất cơ thiếc, ví dụ, azoxyclofen, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargite hoặc tetradifon.

(13) Chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách làm gián đoạn gradient proton, ví dụ chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.

(14) Các chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinergic, ví dụ, bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.

(15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 0, ví dụ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.

(16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 1, ví dụ, buprofezin.

(17) Các chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt trong trường hợp bộ hai cánh), ví dụ cyromazine.

(18) Các chất chủ vận thụ thể hormon kích thích trưởng thành và lột xác (Ecdyson), ví dụ, chromafenozid, halofenozid, metoxyfenozid và tebufenozid.

((19) Các chất chủ vận octopamine, ví dụ, amitraz.

(20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể, ví dụ hydrametylnon hoặc acequinocyl hoặc fluacrypyrim.

(21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức I ty thể, ví dụ chất diệt ve bét METI, ví dụ fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenone (Derris).

(22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế, ví dụ indoxacarb hoặc metaflumizon.

((23) Các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylaza, ví dụ, tetronic và các dẫn xuất axit tetramic, ví dụ, spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức IV ty thể, ví dụ các phosphin, ví dụ nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua, hoặc các xyanua, canxi xyanua, kali xyanua và natri xyanua.

(25) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức II ty thể, ví dụ các dẫn xuất beta-keto nitril, ví dụ cyenopyrafen và cyflumetofen và carboxanilide, ví dụ pyflubumide.

(28) Các chất điều biến thụ thể ryanodin, ví dụ diamit, ví dụ, clorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit,

các thành phần hoạt tính khác, ví dụ afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclothiaz, benzoximate, bifenazate, broflanilide, bromopropylate, chinomethionat, chloroprallethrin, cryolite, cyclaniliprole, xycloxaprid, cyhalodiamide, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoquin, fluazaindolizine, fluensulfone, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprole, fluhexafon, fluopyram, fluralaner, fluxametamide, fufenozide, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodione, kappa bifenthrin, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spiobudiclofen, tetrametylfluthrin, tetraniliprole, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim và iodometan; các chế phẩm khác dựa trên *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và các hợp chất sau đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulphinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazole-5-amin (đã biết từ WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (đã biết từ WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1'-[(2E)-3-

(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (đã biết từ WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết từ WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl etylcarbonat (đã biết từ EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl piperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết từ WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết từ JP2010/018586) (CAS Reg.No. 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (đã biết từ WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflopropan-2-on (đã biết từ WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentaflotetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết từ WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoil)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã biết từ CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(trans-1-oxido-3-thietanyl)benzamit và 4-[(5S)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit (đã biết từ WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulphinyl]propanamit, (+)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulphinyl]propanamit và (-)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulphinyl]propanamit (đã biết từ WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[2E)-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulphinyl]-1H-pyrazole-3-carbonitril (đã biết từ CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-clo-2-metyl-6-[(metylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazole-5-carboxamit, (Liudaibenjiaxuanan, đã biết từ CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-clo-2-[[1,1-dimetyletyl]amino]cacbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết từ WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết từ WO 2011/085575 A1) (CAS

1233882-22-8), 4-[3-[2,6-diclo-4-[(3,3-diclo-2-propen-1-yl)oxy]phenoxy]propoxy]-2-metoxi-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biết từ CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- và 2(Z)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-N-[4-(diflometoxi)phenyl]hydrazinocarboxamit (đã biết từ CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); este 3-(2,2-dicloethenyl)-2,2-dimetyl-4-(1H-benzimidazol-2-yl)phenyl của axit xyclopropancarboxylic (đã biết từ CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4aS)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[metoxycacbonyl][4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]cacbonyl]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H)-carboxylic (đã biết từ CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-O-etyl-2,4-di-O-metyl-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoetoxy)phenyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamit]- α -L-mannopyranoza (đã biết từ US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (đã biết từ WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8) và N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]propanamit (đã biết từ WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9).

Chất kháng nấm

Các hoạt chất được xác định rõ ở đây bằng "tên chung" của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu "Pesticide Manual" (16th ed., British Crop Protection Council) hoặc có thể được tìm thấy trên Internet (ví dụ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập trong các nhóm (1) đến (15), trong trường hợp có thể, có thể tạo ra muối với bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng. Tất cả các thành phần diệt nấm phối trộn thuộc nhóm từ (1) đến (15) đã nêu, trong trường hợp có thể, có thể bao gồm các dạng tautome.

1) Các chất ức chế ergosterol, ví dụ (1.001) cyproconazole, (1.002) difenoconazole, (1.003) epoxiconazole, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin,

(1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamine, (1.008) fluquinconazole, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfate, (1.012) ipconazole, (1.013) metconazole, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazole, (1.018) prothioconazole, (1.019) pyrisoxazole, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazole, (1.022) tetraconazole, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazole, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.036) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-

3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.056) 2-{{3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.057) 2-{{rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.058) 2-{{rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.060) 5-(allylsulphanyl)-1-{{3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(allylsulphanyl)-1-{{rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(allylsulphanyl)-1-{{rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl}metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl}sulphanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl}sulphanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl}sulphanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-(pentafloetoxy)phenyl}sulphanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulphanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-[(2,2,2-trifloetyl)sulphanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.069) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulphanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{{3-[(pentafloetyl)sulphanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-

metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-
 metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulphanyl}-2,5-
 dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-
 [(diflometyl)sulphanyl]phenoxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit,
 (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-
 N-metylimidoformamit, (1.075) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-
 dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-
 diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-
 {5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-
 metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-
 metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-
 isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit,
 (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-
 metylimidoformamit.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức I hoặc II, ví dụ (2.001) benzovindiflupyr,
 (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006)
 flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr, (2.009) isofetamid, (2.010)
 isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam
 (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (raxemat dạng
 anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp raxemat dạng syn-epime
 1RS,4SR,9RS và raxemat dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (chất
 đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (chất đồng phân đối
 ảnh dạng syn-epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (raxemat dạng syn-epime
 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen,
 (2.020) pyraziflumid, (2.021) sedaxane, (2.022) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-
 dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.023) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-
 trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.024) 1,3-dimetyl-N-
 [(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.025) 1-
 metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit,
 (2.026) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamid,
 (2.027) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-
 pyrazol-4-carboxamit, (2.028) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-

dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-
 [(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) 3-
 (diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-
 4-carboxamit, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-
 inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-
 1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033)
 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-
 amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-
 metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-
 xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-
 butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit,
 (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-
 pyrazol-4-carboxamit, (2.038) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-
 (diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.039) N-[(1R,4S)-9-
 (diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-
 1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-
 metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-
 (2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-
 carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-
 flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-
 xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-
 2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-
 carboxamit, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-
 (triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-
 5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-
 xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-
 4-carboxamit, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-
 metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-
 isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xyclopropyl-3-
 (diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit,
 (2.051) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-
 pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-

flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit.

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức III, ví dụ (3.001) ametoctradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017) pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019) pyraoxystrobin, (3.020) trifloxystrobin (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamiy, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypyridin-2-yl]cacbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamid, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamit.

4) Các chất ức chế nguyên phân và phân chia tế bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazole, (4.007) thiophanate-metyl, (4.008) zoxamide, (4.009) 3-clo-4-(2,6-diflophenyl)-6-metyl-5-phenylpyridazine, (4.010) 3-clo-5-(4-clophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-6-metylpyridazine, (4.011) 3-clo-5-(6-clopyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflophenyl)pyridazin, (4.012) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.013) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.014) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.015) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-

clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.016) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.017) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.018) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.019) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.020) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.021) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.022) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimetylpyridazine, (4.023) N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.024) N-(2-bromophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.025) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin.

5) Các hợp chất có khả năng hoạt động nhiều vị trí, ví dụ (5.001) hỗn hợp Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) chlorthalonil, (5.005) đồng hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxyclorea, (5.009) đồng(2+) sulphat, (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) zinc metiram, (5.017) đồng oxin, (5.018) propineb, (5.019) lưu huỳnh và các chế phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram.

6) Các hợp chất có khả năng khởi động cơ chế phòng vệ của vật chủ, ví dụ (6.001) acibenzolar-S-metyl, (6.002) isotianil, (6.003) probenazole, (6.004) tiadinil.

7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.001) cyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin hydroclorua hydrat, (7.004) oxytetracycline, (7.005) pyrimethanil, (7.006) 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

(8) Các chất ức chế sản sinh ATP, ví dụ (8.001) silthiofam.

9) Các chất ức chế tổng hợp thành tế bào, ví dụ (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethomorph, (9.003) flumorph, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pyrimorph, (9.007) valifenalate, (9.008) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-cloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.009) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.

10) Các chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclofos-metyl.

11) Các chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.001) tricyclazole, (11.002) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamat.

12) Các chất ức chế tổng hợp axit nucleic, ví dụ (12.001) benalaxyl, (12.002) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.003) metalaxyl, (12.004) metalaxyl-M (mefenoxam).

13) Các chất ức chế truyền tín hiệu, ví dụ (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodione, (13.003) procymidone, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.

14) Các hợp chất hoạt động dưới dạng chất phân tách, ví dụ (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.

15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazole, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamide, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothiocyxanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomyxin, (15.018) natamycin, (15.019) nicken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapirolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclophenol và muối, (15.025) axit phosphonic và muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetyl, (15.027) pyriofenone (chlazafenone) (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanide, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetron, (15.035) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.036) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.037) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-

dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.038) 2-[6-(3-flo-4-metoxyphe-nyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazolin, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulphonat, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulphonat, (15.041) 2-{2-[(7,8-diflo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulphonat, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenyl metansulphonat, (15.045) 2-phenylphenol và muối của nó, (15.046) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.047) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng tautome: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butyric, (15.050) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.051) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen 2-sulphonohydrazit, (15.052) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.053) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.054) 9-flo-2,2-dimetyl-5-(quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepin, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylene]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamat, (15.056) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, (15.057) axit phenazin-1-carboxylic, (15.058) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulphat (2:1), (15.061) tert-butyl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylene]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamat.

Các chất diệt sinh vật gây hại sinh học làm thành phần kết hợp

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được kết hợp với các chất diệt sinh vật gây hại sinh học.

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học chủ yếu bao gồm vi khuẩn, nấm, nấm men, chất chiết thực vật và các sản phẩm được tạo ra từ vi sinh vật, bao gồm protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp.

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm vi khuẩn như vi khuẩn sinh bào tử, vi khuẩn cư trú ở rễ và vi khuẩn mà hoạt động ở dạng chất diện côn trùng, chất diệt nấm hoặc chất diệt giun tròn sinh học.

Ví dụ về vi khuẩn như vậy mà chúng được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học là:

Bacillus amyloliquefaciens, chủng FZB42 (DSM 231179), hoặc *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 hoặc *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (số truy cập CNCM I-1582) hoặc *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng GB34 (số truy cập ATCC 700814) và chủng QST2808 (số truy cập NRRL B-30087), hoặc *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng GB03 (số truy cập ATCC SD-1397), hoặc *Bacillus subtilis* chủng QST713 (số truy cập NRRL B-21661) hoặc *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (số truy cập NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (serotype H-14), chủng AM65-52 (số truy cập ATCC 1276), hoặc *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là chủng ABTS-1857 (SD-1372), hoặc *B. thuringiensis subsp. kurstaki* chủng HD-1, hoặc *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* chủng NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (*Rotylenchulus reniformis* nematode)-PR3 (Mã truy cập số ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (Mã truy cập số NRRL 30232).

Ví dụ về nấm và nấm men mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại là:

Beauveria bassiana, đặc biệt là chủng ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, đặc biệt là chủng CON/M/91-8 (số truy cập DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, đặc biệt là chủng HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*), đặc biệt là chủng KV01, *Metarhizium anisopliae*, đặc biệt là chủng F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, đặc biệt là chủng NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (hiện nay: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (số truy cập ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* chủng 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, đặc biệt là chủng V117b, *Trichoderma atroviride*, đặc biệt là chủng SC1 (số truy cập CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum rifai* T39 (số truy cập CNCM I-952).

Ví dụ về virus được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học là:

Virus hạt (granulosis virus - GV) tác động lên *Adoxophyes orana* (bướm sâu cuốn lá ở cây ăn quả mùa hè), virus hạt (granulosis virus - GV) tác động lên *Cydia pomonella* (ấu trùng sâu bướm), virus đa diện nhân (nuclear polyhedrosis virus - NPV) tác động lên *Helicoverpa armigera* (giun nang ở bông), mNPV tác động lên *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng), mNPV tác động lên *Spodoptera frugiperda* (sâu xanh mùa thu), NPV tác động lên *Spodoptera littoralis* (sâu ăn lá bông châu Phi).

Cũng bao gồm vi khuẩn và nấm, các loại này được bổ sung làm 'chất để cây' lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc các cơ quan của thực vật và, nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ bao gồm:

Agrobacterium spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, đặc biệt là *Burkholderia cepacia* (trước đây được biết là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Ví dụ về các chất chiết từ thực vật và các sản phẩm tạo ra bởi vi sinh vật bao gồm cả các protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học đó là:

Allium sativum, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (chất chiết saponin từ cây *Chenopodium quinoa*), pyrethrum/pyrethrins, Quassia amara, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "RequiemTM Insecticide", rotenone, ryania/ryanodine, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, chất chiết Brassicaceae, đặc biệt là bột hạt cải dầu hoặc bột mù tạt.

Chất an toàn làm thành phần phối trộn

Hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được kết hợp với chất an toàn, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenclorazole (-etyl), fenclorim, flurazole, fluxofenim, furilazole, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphtalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoil)amino]phenyl}sulphonyl)benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả thực vật và các bộ phận của thực vật có thể được xử lý theo sáng chế Ở đây, thực vật được hiểu có nghĩa là toàn bộ thực vật và quần thể thực vật, như thực vật hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm cây trồng xuất có trong nhiên), ví dụ ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, ớt chuông, dưa chuột, dưa, carot, dưa hấu, hành, rau diếp, rau bina, tỏi tây, đậu, Brassica oleracea (ví dụ bắp cải) và các loài rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu, và cả thực vật lấy quả (các loại quả là táo, lê, các loại quả chi cam chanh và nho). Các cây trồng theo mùa vụ có thể là thực vật thu được bằng cách nhân giống thông thường và các phương pháp tối ưu hóa hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và thao tác di truyền hoặc kết hợp của các phương pháp này, bao gồm thực vật chuyển gen và gồm giống cây trồng có khả năng bảo vệ hoặc không có khả năng bảo vệ bởi quyền của người chọn tạo giống cây trồng. Thực vật sẽ được hiểu nghĩa là tất cả các giai đoạn phát triển như hạt, cây giống và cây con (chưa trưởng thành) cho đến thực vật trưởng thành. Các bộ phận của thực vật được hiểu là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, hoa và rễ, ví dụ lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thể quả, quả và hạt, và cả rễ, thân củ và thân rễ. Các bộ phận của thực vật cũng bao gồm thực vật sau thu hoạch hoặc bộ phận của thực vật sau thu hoạch và vật liệu gây giống sinh sản và sinh dưỡng, ví dụ cành giâm, thân củ, thân rễ, cành ghép và hạt.

Việc xử lý thực vật và các bộ phận của thực vật theo sáng chế bằng các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách để cho các hợp chất này hoạt động trên các vùng xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản chúng bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhúng, phun, làm bay hơi, tạo mù, rắc, phủ lên, bơm, và, trong trường hợp nguyên liệu nhân

giống, cụ thể là trong trường hợp hạt giống, cả bằng cách áp dụng một hoặc nhiều lớp bao.

Như đã đề cập ở trên, cũng có thể xử lý tất cả các thực vật và bộ phận của thực vật theo sáng chế. Theo một phương án ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và giống thực vật, hoặc các loài thu được bằng phương pháp nhân giống sinh học thông thường, như lai giống hoặc dung hợp tế bào trần, và các bộ phận của chúng, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng phương pháp thao tác di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng được xử lý. Thuật ngữ “bộ phận” hoặc “bộ phận của thực vật” hoặc “bộ phận thực vật” đã được giải thích trên đây. Theo sáng chế, tốt hơn là xử lý thực vật thuộc các giống thông thường trên thị trường tương ứng hoặc các loài đang sử dụng. Các giống cây trồng được hiểu theo nghĩa là thực vật có đặc tính (“tính trạng”) mới và thu được bằng phương pháp nhân giống thông thường, bằng các kỹ thuật gây đột biến hoặc các kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Giống thực vật có thể là cây giống, giống, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

Thực vật chuyển gen, xử lý hạt và các sự kiện tích hợp

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen (các loài thu được bằng kỹ thuật di truyền) được ưu tiên mà cần được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các thực vật mà, thông qua sự biến đổi di truyền, nhận được vật liệu di truyền mà sẽ truyền các đặc tính (“tính trạng”) hữu dụng đặc biệt có lợi cho các thực vật này. Ví dụ về các đặc tính này là sự sinh trưởng tốt hơn, khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp tăng, khả năng chịu hạn hoặc các mức nước hoặc độ mặn của đất tốt hơn, hiệu suất ra hoa tăng, thu hoạch dễ hơn, nhanh chín hơn, năng suất thu hoạch cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng cao hơn của các sản phẩm được thu hoạch, thời gian bảo quản và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn. Các ví dụ khác và đặc biệt được nhấn mạnh về các đặc tính như vậy là tăng tính kháng của thực vật chống lại các động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại côn trùng, nhện, giun tròn, ve bét, ốc sên và ốc, ví dụ nhờ các độc tố tạo ra trên thực vật, đặc biệt là các độc tố được tạo ra ở thực vật bằng vật liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, bởi các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả tổ hợp của các gen này), và cả tăng tính kháng của thực vật chống lại nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh thực vật, ví dụ gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (systemic acquired resistance -

SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc tố được biểu hiện tương ứng, và cả tăng khả năng chống chịu của thực vật đối với một số hoạt chất diệt cỏ nhất định, ví dụ, các imidazolinon, sulfonylure, glyphosat hoặc phosphinothricin (ví dụ, gen "PAT"). Các gen truyền đặc tính ("tính trạng") mong muốn cũng có thể có mặt kết hợp với nhau trong thực vật chuyển gen. Ví dụ về thực vật chuyển gen đã nêu bao gồm các cây trồng theo mùa vụ quan trọng, như ngũ cốc (lúa mì, lúa gạo, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu và cả thực vật lấy quả (các loại quả là táo, lê, các loại quả chi cam chanh và nho), đặc biệt nhấn mạnh có thể kể đến ngô, đậu tương, lúa mì, lúa gạo, khoai tây, bông, mía đường, thuốc lá và cải dầu. Các đặc tính ("tính trạng") đặc biệt được nhấn mạnh là tăng tính kháng của thực vật chống lại côn trùng, nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý

Thực vật hoặc các bộ phận của thực vật được xử lý bằng các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') một cách trực tiếp hoặc bằng cách tác động lên vùng xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản nhờ sử dụng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhúng, phun, phun mù, tưới, làm bay hơi, phun bụi, tạo sương, tung rắc, tạo bột, quét lên, phết lên, tiêm, tưới nước (tưới ướt), tưới ngập và trong trường hợp vật liệu nhân giống, đặc biệt là trong trường hợp hạt giống, ngoài ra, bằng cách xử lý hạt khô, bằng cách xử lý hạt ở dạng lỏng, bằng cách xử lý ở dạng huyền phù đặc, bằng cách phủ lên vỏ ngoài, bằng cách phủ bằng một hoặc nhiều lớp phủ, v.v.. Ngoài ra, có thể áp dụng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') bằng phương pháp thể tích cực nhỏ hoặc bơm dạng ứng dụng hoặc chính hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') vào trong đất.

Việc xử lý trực tiếp được ưu tiên đối với thực vật là đưa lên lá, tức là hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được đưa lên hệ lá, trong trường hợp này tần suất xử lý và tỷ lệ áp dụng cần được điều chỉnh theo mức độ nhiễm của sinh vật gây hại đích.

Trong trường hợp các hoạt chất tác động hệ thống, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cũng tiếp cận được vào thực vật thông qua hệ rễ. Trong trường hợp đó, thực vật được xử lý bằng tác động của hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') lên môi trường sống của thực vật. Việc xử lý này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách

tưới ướt, hoặc bằng cách kết hợp vào trong đất hoặc dung dịch chất dinh dưỡng, có nghĩa là, vị trí của thực vật (ví dụ, các hệ trồng trong đất hoặc trong nước) được thấm bởi dạng dịch lỏng của hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), hoặc bằng cách áp dụng lên đất, có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được đưa ở dạng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào vị trí của thực vật. Trong trường hợp cây trồng là lúa gạo, việc này cũng có thể được thực hiện bằng cách định lượng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') ở dạng áp dụng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào cách đồng lúa ngập nước.

Xử lý hạt

Việc phòng trừ các động vật gây hại bằng cách xử lý hạt thực vật đã được biết đến từ lâu và là đối tượng cải tiến liên tục. Tuy nhiên, việc xử lý hạt dẫn đến hàng loạt vấn đề mà thường không thể giải quyết được một cách ổn thỏa. Do đó, có mong muốn phát triển các phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm mà không cần hoặc ít nhất giảm thiểu đáng kể việc sử dụng thêm chất diệt sinh vật gây hại trong quá trình bảo quản, sau khi gieo hạt hoặc sau khi thực vật nhú lên. Ngoài ra, có mong muốn tối ưu hóa lượng hoạt chất được sử dụng để tạo ra sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm tránh khỏi sự tấn công của các động vật gây hại, mà không gây tổn hại cho chính thực vật này bởi hoạt chất được sử dụng. Cụ thể, các phương pháp xử lý hạt cũng cần phải tính đến các đặc tính diệt côn trùng hoặc diệt giun tròn vốn có của thực vật chuyển gen kháng hoặc chịu được sinh vật gây hại nhằm đạt được sự bảo vệ tối ưu cho hạt và cả thực vật nảy mầm với lượng chất diệt sinh vật gây hại tối thiểu.

Do đó, sáng chế cũng đặc biệt đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm khỏi sự tấn công của các sinh vật gây hại, bằng cách xử lý hạt bằng một trong số các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'). Phương pháp theo sáng chế để bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm chống lại sự tấn công của các sinh vật gây hại còn bao gồm phương pháp trong đó hạt được xử lý đồng thời trong một công đoạn hoặc tuần tự bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn. Sáng chế còn bao gồm phương pháp trong đó hạt được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn.

Tương tự, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để xử lý hạt để bảo vệ hạt và cây thu được khỏi các động gây hại.

Sáng chế cũng đề cập đến hạt được xử lý bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') theo sáng chế để bảo vệ hạt khỏi các động vật gây hại. Sáng chế cũng đề cập đến hạt mà hạt này đã được xử lý đồng thời bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn. Sáng chế còn đề cập đến hạt mà hạt này đã được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn. Trong trường hợp hạt mà đã được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn, các chất riêng biệt có thể có mặt trên hạt trong các lớp khác nhau. Trong trường hợp này, các lớp chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và các thành phần phối trộn tùy ý có thể được tách riêng bằng lớp trung gian. Sáng chế cũng đề cập đến hạt, trong đó hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và thành phần phối trộn được áp dụng dưới dạng một phần của lớp bao hoặc dưới dạng một lớp khác hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ ra.

Sáng chế còn đề cập đến hạt, sau khi xử lý bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), được đưa vào quy trình bao màng để ngăn ngừa sự mài mòn hạt.

Một trong số các ưu điểm xuất hiện khi một trong số các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') tác động hệ thống là ở chỗ việc xử lý hạt không chỉ bảo vệ bản thân hạt, mà còn bảo vệ cả thực vật thu được từ đó sau khi nhú, khỏi động vật gây hại. Theo phương thức này, có thể không cần xử lý trung gian cho cây trồng ở thời điểm gieo hạt hoặc ngay sau đó.

Một ưu điểm nữa là ở chỗ việc xử lý hạt bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể tăng cường khả năng nảy mầm và nhú mầm của hạt đã xử lý.

Việc các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') đặc biệt còn có thể được sử dụng cho hạt chuyển gen cũng được xem là ưu điểm.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cũng có thể được sử dụng kết hợp với các chế phẩm thuộc công nghệ truyền tín hiệu, ví dụ, mà dẫn đến sự định khu tốt hơn của các sinh vật cộng sinh, ví dụ, chủng vi khuẩn nốt rễ, nấm cộng sinh mycorrhizae và/hoặc vi khuẩn hoặc nấm nội ký sinh thực vật và/hoặc dẫn đến sự cố định nitơ tối ưu.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thích hợp để bảo vệ hạt của giống thực vật bất kỳ được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong lâm nghiệp hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn, đó là hạt ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen,

kê và yến mạch), ngô, bông, đậu tương, lúa, khoai tây, hướng dương, cà phê, thuốc lá, cây cải dầu, cải dầu, củ cải đường (ví dụ, củ cải đường và củ cải đường trong chăn nuôi), đậu phộng, các loại rau (ví dụ, cà chua, dưa chuột, đậu, các loại rau họ cải, hành và rau diếp), thực vật lấy quả, cỏ và cây cảnh. Đặc biệt đáng chú ý là việc xử lý hạt ngũ cốc (như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen và yến mạch), ngô, đậu tương, bông, cải dầu canola, cây cải dầu, rau và lúa gạo.

Như đã đề cập trên đây, việc xử lý hạt chuyển gen bằng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cũng đặc biệt quan trọng. Việc này bao gồm hạt của các cây mà thường chứa ít nhất một gen khác loại có tác dụng kiểm soát sự biểu hiện của polypeptit có các đặc tính diệt côn trùng và/hoặc diệt giun tròn cụ thể. Gen khác loại ở hạt chuyển gen có thể có nguồn gốc từ vi sinh vật như *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* hoặc *Gliocladium*. Sáng chế đặc biệt phù hợp để xử lý hạt chuyển gen mà gồm ít nhất một gen khác loại từ *Bacillus* sp. Tốt hơn, nếu gen khác loại từ *Bacillus thuringensis*.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được áp dụng lên hạt. Tốt hơn là, hạt được xử lý ở trạng thái trong đó hạt này ở mức đủ ổn định để không xảy ra tổn hại bất kỳ trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ từ khi thu hoạch đến khi gieo. Thường sử dụng hạt đã được tách ra khỏi cây và tách khỏi lõi, vỏ hạt, cuống, vỏ, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt mà hạt này đã được thu hoạch, làm sạch và làm khô đến hàm lượng ẩm cho phép để bảo quản. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà sau khi làm khô đã được xử lý bằng, ví dụ, nước và sau đó làm khô lại, ví dụ môi nước. Trong trường hợp hạt lúa gạo, cũng có thể sử dụng hạt mà đã được ngâm, ví dụ, trong nước đến khi đạt đến giai đoạn mầm gạo nhất định (“giai đoạn ức bờ câu”) mà kích thích khả năng nảy mầm và khả năng nhú mầm đồng đều hơn.

Nói chung, trong xử lý hạt, cần phải bảo đảm rằng lượng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và/hoặc các chất phụ gia khác áp dụng lên hạt được chọn sao cho khả năng nảy mầm của hạt không bị suy giảm và cây mọc lên từ hạt không bị tổn hại. Điều này cần phải được bảo đảm, đặc biệt là trong trường hợp các hoạt chất mà có thể thể hiện các tác dụng độc thực vật ở các tỷ lệ áp dụng nhất định.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thường được áp dụng lên hạt trong chế phẩm thích hợp. Chế phẩm và quy trình xử lý hạt thích hợp là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực này.

Hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được chuyển thành chế phẩm xử lý hạt thông thường, như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, huyền phù đặc hoặc các chế phẩm bao khác dùng cho hạt và cả chế phẩm ULV.

Các chế phẩm này được phối chế theo cách đã biết, bằng cách trộn hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với chất phụ gia thông thường, ví dụ, chất độn thông thường và dung môi hoặc chất pha loãng, thuốc nhuộm, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberelin và cả nước.

Thuốc nhuộm mà có thể có trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các thuốc nhuộm mà thông thường cho mục đích này. Có thể sử dụng các thuốc nhuộm ít tan trong nước hoặc thuốc nhuộm tan trong nước. Ví dụ bao gồm các thuốc nhuộm đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 và C.I. Solvent Red 1.

Chất làm ẩm hữu dụng mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất mà tăng cường sự làm ẩm và thường dùng trong việc phối chế các hoạt chất hóa nông. Ưu tiên sử dụng các alkyl naphtalensulphonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphtalensulphonat.

Chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa thích hợp mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Các chất phân tán không ion hoặc anion hoặc các hỗn hợp chứa các chất phân tán không ion hoặc anion có thể được ưu tiên sử dụng. Các chất phân tán không ion thích hợp đặc biệt bao gồm các polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristyrylphenol polyglycol ete, và các dẫn xuất phosphat hóa hoặc sulfat hóa của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là lignosulphonat, muối của axit polyacrylic và sản phẩm ngưng tụ arylsulphonat-formaldehyt.

Các chất chống tạo bọt mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất ngăn ngừa sự tạo bọt thường dùng trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được ưu tiên sử dụng.

Các chất bảo quản có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất có thể sử dụng cho mục đích này trong chế phẩm hoá nông. Các ví dụ bao gồm diclophen và của hemiformal rượu benzylic.

Chất làm đặc thứ cấp mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất mà có thể được sử dụng cho các mục đích như vậy trong các chế phẩm hóa nông. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm dẫn xuất xenluloza, dẫn xuất của axit acrylic, xanthan, đất sét biến tính và silic oxit nghiền mịn.

Các chất kết dính hữu dụng mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong các sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza.

Giberelin mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế có thể tốt hơn là giberelin A1, A3 (= axit giberelic), A4 và A7; đặc biệt ưu tiên sử dụng axit giberelic. Các giberelin là đã biết (xem R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- and Schädlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of Crop Protection Composition and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

Các chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế có thể được sử dụng để xử lý nhiều loại hạt khác nhau một cách trực tiếp hoặc sau khi đã được pha loãng trước bằng nước. Ví dụ, các sản phẩm cô đặc hoặc chế phẩm thu được từ đó bằng cách pha loãng với nước có thể được sử dụng để xử lý hạt ngũ cốc, như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, và tiểu hắc mạch, và cả ngô, lúa gạo, cải dầu, đậu Hà Lan, đậu, bông, hướng dương, đậu tương và củ cải đường, hoặc cả hạt của nhiều loại rau khác nhau. Chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế, hoặc dạng sử dụng loãng của chúng cũng có thể được dùng để xử lý hạt thực vật chuyển gen.

Để xử lý hạt bằng chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế, hoặc các dạng sử dụng được pha chế từ đó, tất cả các đơn vị phối trộn có thể sử dụng được theo cách thông thường trong xử lý hạt đều hữu dụng. Cụ thể, quy trình trong xử lý hạt là đưa hạt vào trong thiết bị trộn vận hành theo từng mẻ hoặc vận hành liên tục, bổ sung lượng chế phẩm xử lý hạt mong muốn cụ thể, ở dạng như vậy hoặc sau khi pha loãng trước bằng nước và trộn cho tới khi chế phẩm này được phân bố đồng đều lên hạt. Nếu thích hợp, tiếp theo công đoạn này là công đoạn làm khô.

Tỷ lệ áp dụng của chế phẩm xử lý hạt có thể sử dụng được theo sáng chế có thể thay đổi trong khoảng tương đối rộng. Tỷ lệ này được quyết định bởi hàm lượng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cụ thể trong chế phẩm và bởi loại hạt. Tỷ lệ áp dụng của hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 50 g trên kilogam hạt, tốt hơn từ 0,01 đến 15 g trên kilogam hạt.

Sức khỏe của động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, tức là trong lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có hoạt tính chống lại các sinh vật ký sinh trên động vật, đặc biệt là sinh vật ngoại ký sinh hoặc sinh vật nội ký sinh. Thuật ngữ "sinh vật nội ký sinh" bao gồm đặc biệt là giun sán và động vật nguyên sinh, như cầu trùng coccidia. Sinh vật ngoại ký sinh điển hình và tốt hơn là ngành chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc ve bét.

Trong lĩnh vực thuốc thú y, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') không gây độc đối với động vật máu nóng thích hợp để phòng trừ sinh vật ký sinh xuất hiện trong nhân giống động vật và chăn nuôi động vật ở gia súc, động vật gây giống, động vật trong vườn thú, động vật thí nghiệm, động vật thực nghiệm và động vật nuôi trong gia đình. Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính chống lại tất cả các giai đoạn hoặc các giai đoạn phát triển cụ thể của sinh vật ký sinh.

Gia súc nông nghiệp bao gồm, ví dụ, động vật có vú, như cừu, dê, ngựa, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, tuần lộc, đa-ma và đặc biệt là gia súc và lợn; hoặc gia cầm như gà tây, vịt, ngỗng và đặc biệt là gà; hoặc cá hoặc loài giáp xác, ví dụ trong nuôi trồng thủy sản; hoặc côn trùng như ong nếu có thể.

Vật nuôi trong gia đình bao gồm, ví dụ, động vật có vú, như chuột đồng, chuột lang, chuột cống, chuột nhắt, sóc sinsin, chồn sương và đặc biệt là chó, mèo, chim cảnh, bò sát, động vật lưỡng cư hoặc cá cảnh.

Theo một phương án cụ thể, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được dùng cho động vật có vú.

Theo phương án cụ thể khác, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được dùng cho chim, cụ thể là chim cảnh và đặc biệt là gia cầm.

Việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để phòng trừ động vật ký sinh dự định để làm giảm hoặc phòng ngừa sự ốm yếu, các trường hợp tử vong và sự suy giảm năng suất (trong trường hợp thịt, sữa, len, da sống, trứng, mật và sản phẩm tương tự), sao cho việc chăn nuôi động vật kinh tế hơn và đơn giản hơn và động vật có thể có được sức khỏe tốt hơn.

Liên quan đến lĩnh vực sức khỏe động vật, thuật ngữ "phòng trừ" hoặc "việc phòng trừ" có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có hiệu quả trong việc làm giảm tỷ lệ mắc sinh vật ký sinh cụ thể ở một động vật bị nhiễm sinh vật ký sinh này tới mức độ không độc. Cụ thể hơn, thuật ngữ "việc phòng trừ" trong ngữ cảnh của sáng chế có nghĩa là hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') tiêu diệt sinh vật ký sinh tương ứng, ức chế sự sinh trưởng, hoặc ức chế sự tăng sinh của sinh vật này.

Động vật chân khớp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở,

từ bộ Anoplurida, ví dụ, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. và *Solenopotes* spp.;

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

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

từ bộ Siphonaptera, ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.;

từ bộ Heteroptera, ví dụ *Cimex* spp., *Panstrongylus* spp., *Rhodnius* spp., *Triatoma* spp.; và cả các sinh vật gây phiền toái và gây hại trong lĩnh vực vệ sinh từ bộ Blattaria.

Ngoài ra, trong trường hợp động vật chân khớp, cần kể đến, mà không chỉ giới hạn ở các ve bét sau:

từ phân lớp Acari (Acarina) và bộ Metastigmata, ví dụ từ họ Argasidae như *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., từ họ Ixodidae như *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (chỉ gốc của ve bét nhiều vật chủ); từ bộ Mesostigmata như *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; từ bộ Actinedida (Prostigmata), ví dụ, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; và từ bộ Acaridida (Astigmata), ví dụ, *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp., *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

Các ví dụ về động vật nguyên sinh ký sinh bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở:

Mastigophora (Flagellata), như:

Metamonada: từ bộ Diplomonadida, ví dụ *Giardia* spp., *Spironucleus* spp.

Parabasala: từ bộ Trichomonadida, ví dụ *Histomonas* spp., *Pentatrichomonas* spp., *Tetratrichomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.

Euglenozoa: từ bộ Trypanosomatida, ví dụ *Leishmania* spp., *Trypanosoma* spp.

Sarcomastigophora (Rhizopoda) như Entamoebidae, ví dụ *Entamoeba* spp., *Centramoebidae*, ví dụ *Acanthamoeba* sp., *Euamoebidae*, ví dụ *Hartmanella* sp.

Alveolata như Apicomplexa (Sporozoa): ví dụ *Cryptosporidium* spp.; từ bộ Eimeriida, ví dụ, *Besnoitia* spp., *Cystoisospora* spp., *Eimeria* spp., *Hammondia* spp., *Isospora* spp., *Neospora* spp., *Sarcocystis* spp., *Toxoplasma* spp.; từ bộ Adeleida, ví dụ, *Hepatozoon* spp., *Klossiella* spp.; từ bộ Haemosporida, ví dụ, *Leucocytozoon* spp., *Plasmodium* spp.; từ bộ Piroplasmida, ví dụ, *Babesia* spp., *Ciliophora* spp., *Echinozoon* spp., *Theileria* spp.; từ bộ Vesiculiferida, ví dụ, *Balantidium* spp., *Buxtonella* spp.

Microspora như *Encephalitozoon* spp., *Enterocytozoon* spp., *Globidium* spp., *Nosema* spp., và cả, ví dụ, *Myxozoa* spp.

Giun sán mà gây bệnh cho người hoặc động vật bao gồm, ví dụ, *Acanthocephala*, *Nematoden*, *Pentastoma* và *Platyhelminthes* (ví dụ *Monogenea*, sán dây và sán lá).

Ví dụ về giun sán bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở,

Sán lá đơn chủ (*Monogenea*): ví dụ: *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Troglecephalus* spp.;

Sán dây: thuộc bộ *Pseudophyllidea*, ví dụ: *Bothridium* spp., *Diphyllbothrium* spp., *Diplogonoporus* spp., *Ichthyobothrium* spp., *Ligula* spp., *Schistocephalus* spp., *Spirometra* spp.

Từ bộ *Cyclophyllida*, ví dụ: *Andyra* spp., *Anoplocephala* spp., *Avitellina* spp., *Bertiella* spp., *Cittotaenia* spp., *Davainea* spp., *Diorchis* spp., *Diplopylidium* spp., *Dipylidium* spp., *Echinococcus* spp., *Echinocotyle* spp., *Echinolepis* spp., *Hydatigera* spp., *Hymenolepis* spp., *Joyeuxiella* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.

Sán lá: thuộc lớp *Digenea*, ví dụ: *Austroilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catatropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyriclum* spp., *Cotylophoron* spp., *xyccocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinochasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Troglotrema* spp., *Typhlocoelum* spp.

Giun tròn: từ bộ *Trichinellida*, ví dụ: *Capillaria* spp., *Trichinella* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichuris* spp.

từ bộ *Tylenchida*, ví dụ: *Micronema* spp., *Parastrangyloides* spp., *Strongyloides* spp.

từ bộ *Rhabditida*, ví dụ: *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Bronchonema* spp., *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp.,

Cooperia spp., Cooperioides spp., Crenosoma spp., Cyathostomum spp., xyclococercus spp., xyclodontostomum spp., Cylicocyclus spp., Cylicostephanus spp., Cylindropharynx spp., Cystocaulus spp., Dictyocaulus spp., Elaphostrongylus spp., Filaroides spp., Globocephalus spp., Graphidium spp., Gyaloccephalus spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Hyostrongylus spp., Marshallagia spp., Metastrongylus spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Neostrongylus spp., Nippostrongylus spp., Obeliscoides spp., Oesophagodontus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp.; Ornithostrongylus spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Paracooperia spp., Paracrenosoma spp., Parastrongylus spp., Parelaphostrongylus spp., Pneumocaulus spp., Pneumostrongylus spp., Poteriostomum spp., Protostrongylus spp., Spicocaulus spp., Stephanurus spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Teladorsagia spp., Trichonema spp., Trichostrongylus spp., Triodontophorus spp., Troglostrongylus spp., Uncinaria spp.

từ bộ Spirurida, ví dụ: Acanthocheilonema spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Ascaris spp., Ascarops spp., Aspicularis spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Cercopithifilaria spp., Crassicauda spp., Dipetalonema spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp.; Draschia spp., Enterobius spp., Filaria spp., Gnathostoma spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Heterakis spp.; Litomosoides spp., Loa spp., Onchocerca spp., Oxyuris spp., Parabronema spp., Parastrongylus spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Physaloptera spp., Probstmayria spp., Pseudofilaria spp., Setaria spp., Skjrabinema spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Strongyluris spp., Syphacia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Wuchereria spp.

giun đầu móc: thuộc bộ Oligacanthorhynchida, ví dụ: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; từ bộ Moniliformida, ví dụ: Moniliformis spp.

từ bộ Polymorphida, ví dụ: Filicollis spp.; từ bộ Echinorhynchida, ví dụ Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.

Pentastoma: từ bộ Porocephalida, ví dụ, Linguatula spp.

Trong lĩnh vực thú y và trong lĩnh vực chăn nuôi động vật, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được sử dụng bằng các phương pháp nhìn chung đã biết trong lĩnh vực này, như qua đường ruột, ngoài đường tiêu hóa, đường da hoặc mũi dưới

dạng chế phẩm thích hợp. Việc sử dụng có thể là dự phòng, dự phòng bùng phát hoặc điều trị.

Do đó, theo một phương án, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để dùng làm thuốc.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để sử dụng làm chất chống sinh vật nội ký sinh.

Theo khía cạnh cụ thể khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để dùng làm chất diệt giun sán, đặc biệt là làm chất diệt giun tròn, chất diệt giun dẹp, chất diệt động vật đầu móc hoặc chất diệt động vật năm giác.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để sử dụng làm chất chống động vật nguyên sinh.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để dùng làm chất chống sinh vật ngoại ký sinh, đặc biệt là làm chất diệt động vật chân khớp, rất đặc biệt là chất diệt côn trùng hoặc chất trừ nhện.

Theo các khía cạnh tiếp theo, sáng chế đề cập đến chế phẩm thú y chứa lượng hữu hiệu ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') và ít nhất một thành phần sau: tá dược được dụng (ví dụ chất pha loãng rắn hoặc lỏng), chất phụ trợ được dụng (ví dụ chất hoạt động bề mặt), đặc biệt là tá dược được dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ được dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y.

Theo khía cạnh có liên quan, sáng chế đề cập đến phương pháp sản xuất chế phẩm thú y như được mô tả ở đây, phương pháp này bao gồm bước trộn ít nhất một compound có công thức (I) hoặc công thức (I') với tá dược và chất phụ trợ được dụng, đặc biệt là tá dược được dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ thường dùng trong các chế phẩm thú y.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các chế phẩm thú y được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt sinh vật ngoại ký sinh và diệt sinh vật nội ký sinh, đặc biệt được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun sán, diệt động vật nguyên sinh và diệt động vật chân khớp, rất đặc biệt là được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun tròn, diệt giun dẹp, diệt động vật đầu móc, diệt động vật năm giác, diệt côn trùng và trừ nhện, theo các khía cạnh nêu trên, và phương pháp sản xuất các chế phẩm này.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, bằng cách sử dụng lượng hữu hiệu hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người, có nhu cầu sử dụng.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, bằng cách sử dụng các chế phẩm thú y được xác định trong bản mô tả cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người, có nhu cầu sử dụng.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') trong điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người.

Trong ngữ cảnh về sức khỏe động vật hoặc thuốc thú y này, thuật ngữ "điều trị" chỉ việc điều trị dự phòng, dự phòng bùng phát và điều trị.

Theo một phương án cụ thể, theo cách này, sáng chế đề xuất hỗn hợp gồm ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') với các thành phần hoạt tính, đặc biệt là với chất diệt sinh vật nội và ngoại ký sinh, cho lĩnh vực thuốc thú y.

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, "hỗn hợp" không chỉ nghĩa là hai (hoặc nhiều) thành phần hoạt tính khác nhau được phối chế trong chế phẩm chung và theo đó sử dụng cùng nhau, mà còn liên quan đến các sản phẩm chứa chế phẩm riêng rẽ của từng thành phần hoạt tính. Theo đó, khi nhiều hơn hai thành phần hoạt tính được sử dụng, tất cả các thành phần hoạt tính có thể được phối chế trong cùng một chế phẩm chung hoặc tất cả các thành phần hoạt tính có thể được phối chế trong các chế phẩm riêng rẽ; tương tự có thể ở dạng trộn lẫn trong đó một số thành phần hoạt tính được phối chế cùng nhau và một số thành phần hoạt tính được phối chế riêng rẽ. Các chế phẩm riêng rẽ cho phép áp dụng riêng rẽ hoặc lần lượt các thành phần hoạt tính cần quan tâm.

Các thành phần hoạt tính được xác định ở đây bằng "tên thông thường" của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu "Pesticide Manual" (xem trên đây) hoặc có thể được tra cứu trên Internet (ví dụ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Các thành phần hoạt tính làm ví dụ từ nhóm gồm các chất diệt sinh vật ngoại ký sinh như các thành phần phối trộn bao gồm, mà không dự định chỉ giới hạn ở, chất diệt côn trùng và chất diệt ve bét được liệt kê chi tiết trên đây. Các thành phần hoạt tính dùng được khác được liệt kê sau đây theo cách phân loại đã nêu dựa trên hệ thống phân loại dựa trên phương thức tác động IRAC: (1) Chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE); (2) chất phong bế kênh clorua qua cổng GABA; (3) chất điều biến kênh natri; (4) chất điều biến cạnh tranh của thụ thể axetylcholine nicotin (nAChR); (5) chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholine nicotin (nAChR); (6) chất điều biến dị lập thể kênh clorua qua cổng glutamat (GluCl); (7) chất giả hormon juvenile; (8) chất ức chế không đặc hiệu hỗn hợp (nhiều vị trí); (9) chất điều biến cơ quan dây âm vị; (10) chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét; (12) chất ức chế ATP synthaza ti thể, như chất phá vỡ ATP; (13) chất phân tách phosphoryl hóa oxy hóa thông qua việc phá vỡ gradien proton; (14) chất phong bế kênh thụ thể axetylcholine nicotin; (15) chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 0; (16) chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 1; (17) chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt trong trường hợp bộ hai cánh); (18) chất chủ vận thụ thể hormon kích thích trưởng thành và lột xác (ecdysone); (19) chất chủ vận thụ thể octopamine; (21) chất ức chế vận chuyển điện tử phức I ty thể; (25) chất ức chế vận chuyển điện tử phức II ty thể; (20) chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể; (22) chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế; (23) chất ức chế axetyl CoA carboxylaza; (28) chất điều biến thụ thể ryanodine;

các thành phần hoạt tính có cơ chế hoạt động chưa biết hoặc không đặc hiệu, ví dụ fentriphanil, fenoxacrim, xycloprene, chlorobenzilate, chlordimeform, flubenzimin, dicyclanil, amidoflumet, quinomethionat, triarathene, clothiazoben, tetrasul, kali oleate, petroleum, metoxadiazon, gossypol, flutendazole, bromproprylate, cryolite;

các hợp chất thuộc nhóm khác, ví dụ butacarb, dimetilan, cloethocarb, phosphocarb, pirimiphos(-etyl), parathion(-etyl), methacrifos, isopropyl o-salicylate, trichlorfon, sulprofos, propaphos, sebufos, pyridathion, prothoate, dichlofenthion, demeton-S-metyl sulfone, isazofos, xyanofenphos, dialifos, carbophenothion, autathiofos, aromfenvinfos(-metyl), azinphos(-etyl), chlorpyrifos(-etyl), fosmethilan, iodofenphos, dioxabenzofos, formothion, fonofos, flupyrzofos, fensulfothion, etrimfos;

Các hợp chất clo hữu cơ, ví dụ camphechlor, lindane, heptachlor; hoặc phenylpyrazoles, ví dụ acetoprole, pyrafluprole, pyriprole, vaniliprole, sisapronil; hoặc isoxazolines, ví dụ sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;

các pyrethroid, ví dụ (cis-, trans-)metofluthrin, profluthrin, flufenprox, flubrocylthrin, fubfenprox, fenfluthrin, protrifenbut, pyresmethrin, RU15525, terallethrin, cis-resmethrin, heptafluthrin, bioethanomethrin, biopermethrin, fenpyrithrin, cis-cypermethrin, cis-permethrin, clopyrithrin, cyhalothrin (lambda-), chlovaporthrin, hoặc các hợp chất hydrocarbon halogen hóa (halogenated hydrocarbon compound - HCH),

các neonicotinoid, ví dụ nithiazine

dicloromezotiaz, triflumezopyrim

các lacton vòng lớn, ví dụ nemadectin, ivermectin, latidectin, moxidectin, selamectin, eprinomectin, doramectin, emamectin benzoate; milbemycin oxime

triprene, epofenonane, diofenolan;

các hợp chất sinh học, hormon hoặc pheromon, ví dụ các sản phẩm tự nhiên, ví dụ thuringiensin, codlemone hoặc các thành phần của cây neem

các dinitrophenol, ví dụ dinocap, dinobuton, binapacryl;

các benzoylure, ví dụ fluazuron, penfluron,

các dẫn xuất amidin, ví dụ chlormebuform, cymiazole, demiditraz

chất diệt ve bét varroa ở tổ ong, ví dụ các axit hữu cơ, ví dụ axit formic, axit oxalic.

Các thành phần hoạt tính minh họa từ nhóm gồm chất diệt sinh vật nội ký sinh, làm thành phần phối trộn, bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở các thành phần hoạt tính diệt giun sán và các thành phần hoạt tính diệt động vật nguyên sinh.

Các thành phần hoạt tính diệt giun sán bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở các thành phần hoạt tính diệt giun tròn, diệt sán máng và/hoặc diệt sán dây sau đây:

từ nhóm lacton vòng lớn, ví dụ: eprinomectin, abamectin, nemadectin, moxidectin, doramectin, selamectin, lepimectin, latidectin, milbemectin, ivermectin, emamectin, milbemycin;

từ nhóm benzimidazol và probenzimidazol, ví dụ: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, thiophanat, parbendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, thiabendazol, xyclobendazole, cambendazol, albendazol sulfoxit, albendazol, flubendazol;

từ nhóm the depsipeptit, tốt hơn là các depsipeptit vòng, đặc biệt là các depsipeptit vòng 24 cạnh, ví dụ: emodepside, PF1022A;

thuộc nhóm tetrahydropyrimidin, ví dụ: morantel, pyrantel, oxantel;

thuộc nhóm imidazothiazol, ví dụ: butamisol, levamisol, tetramisol;

thuộc nhóm aminophenylamidin, ví dụ: amidantel, amidantel loại axyl hóa (dAMD), tribendimidin;

từ nhóm aminoaxetonitril, ví dụ: monepantel;

từ nhóm paraherquamit, ví dụ: paraherquamide, derquantel;

từ nhóm the salicylanilit, ví dụ: tribromsalan, bromoxanide, brotiane, clioxanide, closantel, niclosamide, oxyclozanide, rafoxanide;

từ nhóm phenol được thế, ví dụ: nitroxylin, bithionol, disophenol, hexachlorophen, niclofolan, meniclopholan;

từ nhóm the các hợp chất phosphat hữu cơ, ví dụ: trichlorfon, naphthalofos, dichlorvos/DDVP, crufomate, coumaphos, haloxon;

từ nhóm piperazinon/quinolin, ví dụ: praziquantel, epsiprantel;

từ nhóm piperazin, ví dụ: piperazin, hydroxyzin;

từ nhóm the tetracycline, ví dụ: tetracycline, chlorotetracycline, doxycycline, oxytetracycline, rolitetracycline;

từ các nhóm khác, ví dụ: bunamidine, niridazole, resorantel, omphalotin, oltipraz, nitroscanate, nitroxylin, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanthone, hycanthone, hetolol, emetin, diethylcarbamazine, diclophen, diamfenetide, clonazepam, bephenium, amoscanate, clorsulon.

Các thành phần hoạt tính diệt động vật nguyên sinh bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở các thành phần sau đây:

từ nhóm triazin, ví dụ: diclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;

từ nhóm polyete ionophore, ví dụ: monensin, salinomycin, maduramicin, narasin;

từ nhóm lacton vòng lớn, ví dụ: milbemycin, erythromycin;

từ nhóm quinolon, ví dụ: enrofloxacin, pradofloxacin;

từ nhóm quinine, ví dụ: chloroquin;

từ nhóm pyrimidin, ví dụ: pyrimethamine;

từ nhóm sulphonamit, ví dụ: sulfaquinoxaline, trimethoprim, sulfaclozin;

từ nhóm thiamin, ví dụ: amprolium;

từ nhóm lincosamit, ví dụ: clindamycin;

từ nhóm carbanilide, ví dụ: imidocarb;

từ nhóm nitrofurantoin, ví dụ: nifurtimox;

từ nhóm the quinazolinon alkaloid, ví dụ: halofuginone;

từ các nhóm khác, ví dụ: oxamniquin, paromomycin;

từ nhóm vaccin hoặc kháng nguyên từ vi sinh vật, ví dụ: *Babesia canis rossi*, *Eimeria tenella*, *Eimeria praecox*, *Eimeria necatrix*, *Eimeria mitis*, *Eimeria maxima*, *Eimeria brunetti*, *Eimeria acervulina*, *Babesia canis vogeli*, *Leishmania infantum*, *Babesia canis canis*, *Dictyocaulus viviparus*.

Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập, trong trường hợp có thể, có thể tạo ra muối với bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng.

Phòng trừ vật truyền

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') cũng có thể được sử dụng để phòng trừ vật truyền. Trong ngữ cảnh của sáng chế, vật truyền là ngành chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc lớp nhện, có khả năng truyền tác nhân gây bệnh, ví dụ, virus, giun, sinh vật đơn bào và vi khuẩn, từ ổ chứa (thực vật, động vật, người, v.v.) sang vật chủ. Các mầm bệnh có thể được truyền vào vật chủ theo đường cơ học (ví dụ, đau mắt hột do các loại ruồi không đốt) sang vật chủ hoặc sau khi chích đốt (ví dụ, ký sinh trùng sốt rét bởi muỗi).

Ví dụ về các vật truyền và bệnh hoặc tác nhân gây bệnh mà chúng truyền là:

1) Muỗi

- Anopheles: sốt rét, bệnh giun chỉ;
- Culex: viêm não Nhật Bản, bệnh giun chỉ, các bệnh virus khác, truyền các loại giun khác;
- Aedes: bệnh sốt vàng, bệnh sốt xuất huyết, các rối loạn do virus khác, bệnh giun chỉ;
- Simuliidae: truyền giun, đặc biệt là *Onchocerca volvulus*;
- Psychodidae: truyền leishmaniasis

2) Chấy rận: nhiễm trùng da, sốt phát ban do chấy rận;

3) Bọ chét: bệnh dịch, sốt phát ban địa phương, giun dẹp;

4) Ruồi: bệnh ngủ (trypanosomiasis); dịch tả, các bệnh do vi khuẩn khác;

5) Ve bét: bệnh ghẻ, sốt phát ban do chấy rận, bệnh sốt do rickettsia, bệnh tularaemia, bệnh viêm não Saint Louis, bệnh viêm não do tíc đốt (TBE), sốt xuất huyết Crimean–Congo, bệnh do xoắn khuẩn *borrelia*;

6) Tíc: bệnh do xoắn khuẩn *borellia* như *Borrelia burgdorferi sensu lato.*, *Borrelia duttoni*, viêm não do tíc đốt, sốt Q (*Coxiella burnetii*), bệnh babesia (*Babesia canis canis*), bệnh ehrlichiosis.

Các ví dụ về các vật truyền trong ngữ cảnh của sáng chế đó là côn trùng, ví dụ rệp, ruồi, rầy hoặc bọ trĩ, các vật truyền này có thể truyền virus trên thực vật sang thực vật. Các vật truyền khác có khả năng truyền virus trên thực vật đó là nhện đỏ, chấy rận, bọ cánh cứng và giun tròn.

Ví dụ khác về các vật truyền theo sáng chế bao gồm côn trùng và lớp nhện như muỗi, đặc biệt là chi *Aedes*, *Anopheles*, ví dụ *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (sốt rét) và *Culex*, *Psychodidae* như *Phlebotomus*, *Lutzomyia*, chấy rận, bọ chét, ruồi, mạt và tíc, các vật truyền này có khả năng truyền mầm bệnh sang động vật và/hoặc người.

Việc phòng trừ vật truyền cũng có thể nếu như hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') phá vỡ tính kháng.

Hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thích hợp để sử dụng trong phòng ngừa bệnh và/hoặc mầm bệnh được truyền bởi các vật truyền. Do đó, theo một khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') để phòng trừ vật truyền, ví dụ, trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong lâm nghiệp, trong các khu vườn và trong các cơ sở giải trí và cả trong bảo vệ vật liệu và các sản phẩm lưu kho.

Bảo vệ các vật liệu công nghiệp

Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thích hợp để bảo vệ các vật liệu công nghiệp chống lại sự tấn công hoặc phá hủy bởi côn trùng, ví dụ từ bộ cánh cứng, bộ cánh màng, bộ mối, bộ cánh vảy, bộ rệp, sáp, mọt và bộ ba đuôi.

Các vật liệu công nghiệp trong ngữ cảnh này được hiểu có nghĩa là vật liệu vô tri vô giác, như tốt hơn là chất dẻo, chất dính kết, hồ dính, giấy và các-tông, da, gỗ, sản phẩm gỗ đã xử lý và chế phẩm phủ. Việc sử dụng theo sáng chế để bảo vệ gỗ là đặc biệt được ưu tiên.

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được sử dụng cùng với ít nhất một chất diệt côn trùng và/hoặc ít nhất một chất trừ nấm khác.

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có dạng chất diệt sinh vật gây hại dùng được ngay, có nghĩa là chúng có thể được áp dụng lên nguyên liệu cần quan tâm mà không cần biến đổi thêm. Các chất diệt côn trùng hoặc diệt nấm hữu dụng đặc biệt bao gồm các chất nêu trên.

Cũng bất ngờ phát hiện rằng các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') có thể được sử dụng để bảo vệ các đối tượng tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là thân tàu thủy, màn hình, lưới, tòa nhà, nơi neo giữ tàu và các hệ thống truyền tín hiệu, chống lại sự đóng cặn. Tương tự, cũng có thể sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I'), ở dạng riêng rẽ hoặc kết hợp với các hoạt chất khác, làm các chất chống đóng cặn.

Phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh

Hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') thích hợp để phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh. Cụ thể hơn, sáng chế có thể được sử dụng trong lĩnh vực bảo vệ trong gia đình, trong lĩnh vực bảo vệ vệ sinh và để bảo vệ các sản phẩm lưu kho, đặc

biệt là để phòng trừ côn trùng, nhện, tíc và ve bét bắt gặp trong các không gian kín như khu vực nhà ở, các sảnh nhà máy, văn phòng, cabin của phương tiện giao thông, các cơ sở nhân giống động vật. Để phòng trừ động vật gây hại, các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') được sử dụng đơn độc hoặc kết hợp với các hoạt chất khác và/hoặc các chất phụ trợ. Tốt hơn nếu các hợp chất này được sử dụng trong các sản phẩm diệt côn trùng gia dụng. Các hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') hữu hiệu chống lại các loài mẫn cảm và kháng và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển.

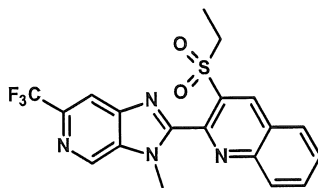
Các sinh vật gây hại này bao gồm, ví dụ, các sinh vật gây hại từ lớp Arachnida, từ các bộ Scorpiones, Araneae và Opiliones, từ các lớp Chilopoda và Diplopoda, từ lớp Insecta bộ Blattodea, từ bộ cánh cứng, bộ cánh da, bộ hai cánh, phân bộ cánh không đều, bộ cánh màng, bộ cánh bằng, bộ cánh vảy, bộ chấy, bộ rệp, sáp, mọt, bộ cánh thẳng, bộ cánh ống và bộ ba đuôi và từ lớp Malacostraca bộ chân đều.

Ví dụ, việc ứng dụng được thực hiện ở dạng sản phẩm sol khí, sản phẩm phun không có áp, ví dụ, phun bằng bơm và phun bằng máy phun bụi, các hệ thống phun mù tự động, máy phun mù, ở dạng bột, gel, các sản phẩm bay hơi với viên nén bay hơi được làm từ xenluloza hoặc chất dẻo, dụng cụ làm bay hơi chất lỏng, dụng cụ làm bay hơi gel và màng, dụng cụ làm bay hơi được dẫn động bằng cánh quạt, các hệ thống làm bay hơi năng lượng tự do hoặc cưỡng bức, các giấy chống nhảy, túi chống nhảy và gel chống nhảy, ở dạng hạt nhỏ hoặc bụi, trong các môi để phát tán hoặc trong các điểm đặt mồi.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế

3-ethylsulphonyl-2-[3-methyl-6-(triflormetyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (I-1)

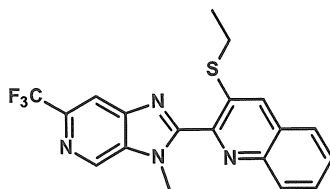


800 mg (2,06 mmol) 3-ethylsulphanyl-2-[3-methyl-6-(triflormetyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin được hòa tan trong 200 ml diclometan, 948 mg (20,5 mmol) axit formic và 2,00 g (20,5 mmol) hydro peroxit được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 5 giờ. Hỗn hợp này

được pha loãng bằng nước, dung dịch natri bisulphit được bổ sung vào, hỗn hợp này được khuấy trong 1 giờ, và sau đó dung dịch natri hydrocarbonat 10% được bổ sung vào. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Tinh chế phần còn lại bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột bằng cách sử dụng HPLC điều chế với gradien nước/axetonitril làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 2,75; MH^+ : 421; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,83 (q, 2H), 3,93 (s, 3H), 7,97 (t, 1H), 8,15 (t, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,51 (d, 1H), 9,32 (s, 1H), 9,34 (s, 1H).

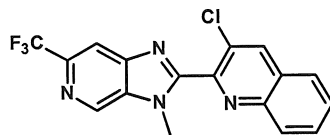
3-ethylsulphanyl-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (I-2)



800 mg (2,20 mmol) 3-clo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin và 557 mg (6,61 mmol) natri etanthiolat được khuấy trong DMF ở nhiệt độ trong phòng trong agon trong 4 giờ. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch natri clorua, lấy ra, làm khô bằng natri sulphat và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

(logP (trung tính): 3,30; MH^+ : 389; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,12 (q, 2H), 4,03 (s, 3H), 7,74-7,84 (m, 2H), 8,08-8,11 (m, 2H), 8,32 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 9,29 (s, 1H).

3-clo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (V-1)



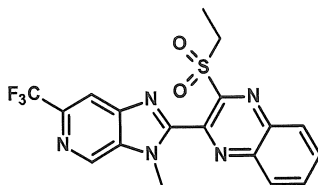
450 mg (2,35 mmol) N^3 -metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin, 489 g (2,35 mmol) axit 3-cloquinolin-2-carboxylic và 451 mg (2,35 mmol) of 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) được khuấy trong 6 ml pyridin ở 120°C trong 9 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất

giảm thấp, sau đó nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và cô đặc lại.

Phần còn lại được hòa tan trong 15 ml toluen, 582 mg (3,06 mmol) axit para-toluensulphonic được bổ sung vào, và hỗn hợp này được khuấy ở 80°C trong 1 giờ và 120°C trong 3 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa và chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

(logP (trung tính): 2,89; MH^+ : 363; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 4,03 (s, 3H), 7,83-7,87 (m, 1H), 7,93-7,97 (m, 1H), 8,15-8,19 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 9,31 (s, 1H).

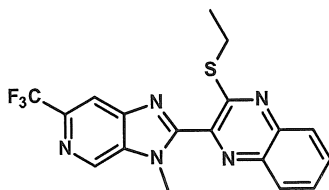
2-ethylsulphonyl-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinoxalin (I-3)



160,7 mg (0,41 mmol) 3-ethylsulphanyl-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinoxalin được hòa tan trong 10 ml diclometan, 195,1 mg (0,82 mmol) axit meta-cloperbenzoic được bổ sung vào ở 0°C, và hỗn hợp này được khuấy ở 0°C trong 5 phút và ở nhiệt độ phòng trong 2 giờ. Hỗn hợp này được phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 1 giờ, pha loãng bằng 20 ml nước và điều chỉnh đến độ pH = 9-10 bằng dung dịch natri hydroxit 45%. Sau đó, hỗn hợp này được chiết ba lần bằng diclometan và sau đó các pha hữu cơ kết hợp được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

(logP (trung tính): 2,45; MH^+ : 422; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,28 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 8,22-8,26 (m, 2H), 8,33 (s, 1H), 8,38-8,40 (m, 1H), 8,45-8,47 (m, 1H), 9,32 (s, 1H).

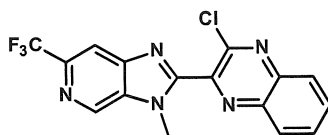
**2-ethylsulphanyl-3-[3-methyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinoxalin
(I-4)**



280 mg (0,66 mmol) 2-clo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinoxalin và 111,4 mg (1,32 mmol) natri etanthiolat được khuấy trong 8 ml DMF ở nhiệt độ trong phòng trong agon trong 30 phút. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch natri clorua, lấy ra, làm khô bằng natri sulphat và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 4,10; MH^+ : 390; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,37 (t, 3H), 3,31 (q, 2H), 4,18 (s, 3H), 7,85 (t, 1H), 7,96 (t, 1H), 8,08 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,37 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

2-clo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinoxalin (V-2)



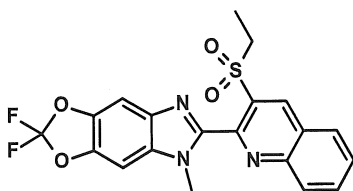
385 mg (2,01 mmol) N^3 -metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin, 504 mg (2,41 mmol) axit 3-cloquinoxalin-2-carboxylic và 386 mg (2,01 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) được khuấy trong 10 ml pyridin ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp, sau đó nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và cô đặc lại.

Phần còn lại được hòa tan trong 5 ml toluen, 181,3 mg (0,95 mmol) axit para-toluensulphonic được bổ sung vào, và hỗn hợp này được khuấy ở 120°C trong 2 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa và

chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

(logP (trung tính): 2,84; MH^+ : 364; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 4,12 (s, 3H), 8,03-8,13 (m, 2H), 8,22-8,31 (m, 2H), 8,37 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

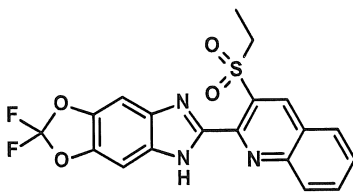
6-(3-etylsulphonyl-2-quinolyl)-2,2-diflo-7-metyl-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol



13 mg (0,03 mmol) 6-(3-etylsulphonyl-2-quinolyl)-2,2-diflo-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol, 4,9 mg (0,03 mmol) metyl iodua và 8,6 mg (0,06 mmol) kali carbonat được hòa tan trong 3 ml axeton và khuấy trong điều kiện hồi lưu trong 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng được lọc ra, nước cái được loại bỏ dung môi, phần còn lại được hấp thu trong diclometan, rửa bằng nước, làm khô bằng natri sulphat và sau đó dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp.

(logP (trung tính): 3,39; MH^+ : 432; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,76 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 7,80 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,93 (t, 1H), 8,12 (t, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).

6-(3-etylsulphonyl-2-quinolyl)-2,2-diflo-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol

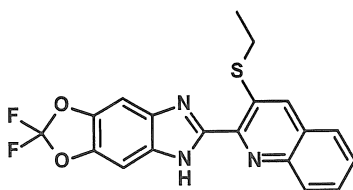


26 mg (0,06 mmol) 6-(3-etylsulphonyl-2-quinolyl)-2,2-diflo-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol được hòa tan trong 3 ml diclometan, 9,2 mg (0,20 mmol) axit formic và 45,4 mg (0,46 mmol) hydro peroxit 35% được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Sau đó, thêm 3 đương lượng axit formic và 7 đương lượng hydro peroxit 35% được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng thêm 2 giờ nữa. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và

sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Pha hữu cơ được tách ra, pha nước được chiết hai lần bằng diclometan, và tiếp theo các pha hữu cơ kết hợp được loại bỏ dung môi trong điều kiện áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (70:30 đến 30:70) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 3,37; MH^+ : 418; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,30 (t, 3H), 4,31 (q, 2H), 7,63 (br, s, 1H), 7,80 (br, s, 1H), 7,89 (t, 1H), 8,10 (t, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,43 (d, 1H), 9,27 (s, 1H), 13,54 (s, 1H).

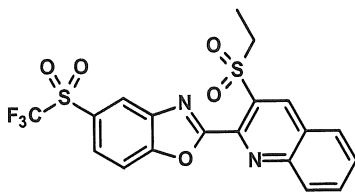
6-(3-ethylsulphanyl-2-quinoly)-2,2-diflo-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol



590 mg (2,97 mmol) 2,2-diflo-1,3-benzodioxol-5,6-diamin, 926,7 mg (3,57 mmol) axit 3-ethylsulphanylquinolin-2-carboxylic, 576,9 mg (2,97 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydrochlorua (EDCI) và 4,4 mg rây phân tử (4 A) được khuấy trong 30 ml pyridin trong agon ở 120°C trong 8 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp, và phần còn lại được hấp thu trong etyl axetat và rửa bằng nước. Pha nước được chiết hai lần bằng etyl axetat, các pha hữu cơ được kết hợp và làm khô bằng natri sulphat, và sau đó dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được khuấy trong điều kiện hồi lưu trong 30 ml phosphoryl clorua trong 4 giờ và sau đó dung môi được loại bỏ lần nữa trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được hấp thu trong diclometan, rửa bằng nước và làm khô bằng natri sulphat, và sau đó dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (70:30 đến 0:100) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 4,26; MH^+ : 386; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,39 (t, 3H), 3,14 (q, 2H), 7,56 (br, s, 1H), 7,66 (t, 1H), 7,76 (t, 1H), 7,84 (br, s, 1H), 8,02 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,37 (s, 1H), 13,31 (s, 1H).

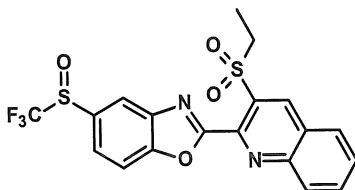
2-(3-ethylsulphonyl-2-quinoly)-5-(triflometylsulphonyl)-1,3-benzoxazol



103 mg (0,06 mmol) 2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphonyl)-1,3-benzoxazol được hòa tan trong 12 ml diclometan, 182 mg (3,93 mmol) axit formic và 1,81 g (18,59 mmol) 35% hydro peroxit được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở 40°C trong 72 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột gradien diclometan/etyl axetat (0:100 đến 40:60) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 3,62; MH^+ : 471; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 4,00 (q, 2H), 8,00 (t, 1H), 8,18 (t, 1H), 8,32-8,37 (m, 2H), 8,45 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,87 (s, 1H), 9,40 (s, 1H).

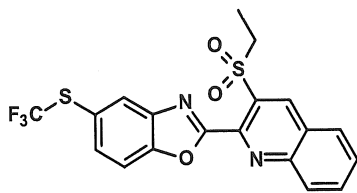
2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphonyl)-1,3-benzoxazol



Phương pháp giống như đã mô tả cho việc tổng hợp 2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphonyl)-1,3-benzoxazol cũng được sử dụng để thu được dẫn xuất trifluoromethylsulphoxit tương ứng 2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphonyl)-1,3-benzoxazol.

(logP (trung tính): 3,05; MH^+ : 455; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,99 (q, 2H), 7,99 (t, 1H), 8,11-8,18 (m, 2H), 8,32-8,34 (m, 2H), 8,50 (d, 1H), 8,55 (s, 1H), 9,38 (s, 1H).

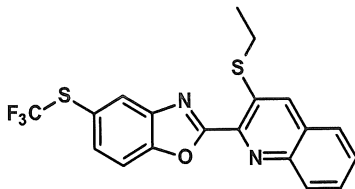
2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphonyl)-1,3-benzoxazol



244 mg (0,57 mmol) 2-(3-ethylsulphanyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphanyl)-1,3-benzoxazol được hòa tan trong 16 ml diclometan, 157,5 mg (3,42 mmol) axit formic và 554,0 mg (5,7 mmol) hydro peroxit 35% được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 6 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (70:30 đến 0:100) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 4,17; MH^+ : 439; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,98 (q, 2H), 7,93-8,00 (m, 2H), 8,13-8,18 (m, 2H), 8,31 (d, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,50 (d, 1H), 9,37 (s, 1H).

2-(3-ethylsulphanyl-2-quinolyl)-5-(trifluoromethylsulphanyl)-1,3-benzoxazol



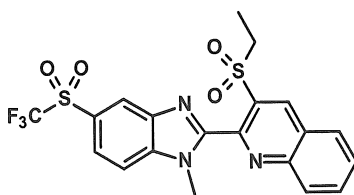
446 mg (2,02 mmol) 2-amino-4-(trifluoromethylsulphanyl)phenol, 708,8 mg (2,43 mmol) axit 3-ethylsulphanylquinolin-2-carboxylic và 465,9 mg (2,97 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (EDCI) được khuấy trong 20 ml pyridin trong agon ở 80°C trong 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

540 mg (1,17 mmol) hợp chất trung gian 3-ethylsulphanyl-N-[2-hydroxy-5-(trifluoromethylsulphanyl)phenyl]quinolin-2-carboxamid được điều chế theo cách này được

khuấy trong 30 ml tetrahydrofuran với sự có mặt của 409 mg (1,68 mmol) di-2-metoxyletyl azodicarboxylat (DMEAD) và 434 mg triphenylphosphin ở nhiệt độ trong phòng trong 1 giờ và ở 50°C trong 1 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (80:20 đến 40:60) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 5,43; MH^+ : 407; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,38 (t, 3H), 3,21 (q, 2H), 7,73-7,82 (m, 2H), 7,90 (d, 1H), 8,07-8,15 (m, 3H), 8,41 (s, 1H), 8,54 (s, 1H).

3-etylsulphonyl-2-[1-metyl-5-(triflometylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin

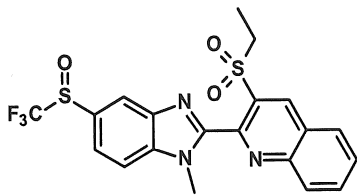


71 mg (0,15 mmol) 3-etylsulphonyl-2-[1-metyl-5-

(triflometylsulphiny)benzimidazol-2-yl]quinolin được hòa tan trong 6 ml axetonitril, 10,0 mg (0,02 mmol) natri tungstat(VI) dihydrat và 738,0 mg (7,58 mmol) hydro peroxit 35% được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy trong điều kiện hồi lưu trong 24 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien diclometan/etyl axetat (70:30 đến 0:100) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 3,42; MH^+ : 484; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 3,87 (q, 2H), 3,89 (s, 3H), 7,97 (t, 1H), 8,10-8,28 (m, 4H), 8,50 (d, 1H), 8,56 (s, 1H), 9,34 (s, 1H).

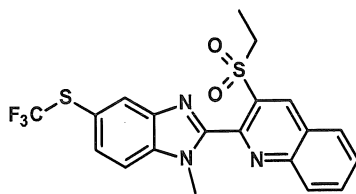
3-etylsulphonyl-2-[1-metyl-5-(triflometylsulphiny)benzimidazol-2-yl]quinolin



262 mg (0,62 mmol) 3-ethylsulphonyl-2-[1-methyl-5-(trifluoromethylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin được hòa tan trong 6 ml diclometan, 143,7 mg (3,12 mmol) axit formic và 424,9 mg (4,37 mmol) hydro peroxit 35% được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (80:20 đến 0:100) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 2,79; MH^+ : 468; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 3,85 (s, 1H), 3,90 (q, 2H), 7,91-7,97 (m, 2H), 8,10-8,15 (m, 2H), 8,26 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,50 (d, 1H), 9,32 (s, 1H).

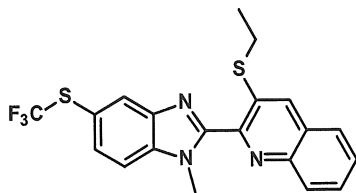
3-ethylsulphonyl-2-[1-methyl-5-(trifluoromethylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin



Phương pháp giống như phương pháp đã mô tả cho việc tổng hợp 3-ethylsulphonyl-2-[1-methyl-5-(trifluoromethylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin được sử dụng để thu được dẫn xuất trifluoromethylsulphua tương ứng 3-ethylsulphonyl-2-[1-methyl-5-(trifluoromethylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin.

(logP (trung tính): 3,96; MH^+ : 452; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,80 (s, 1H), 3,90 (q, 2H), 7,71 (d, 1H), 7,90-7,97 (m, 2H), 8,11-8,15 (m, 2H), 8,26 (d, 1H), 8,49 (d, 1H), 9,31 (s, 1H).

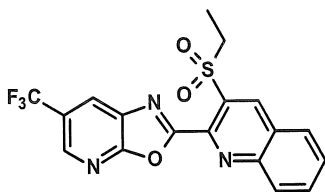
3-ethylsulphonyl-2-[1-methyl-5-(trifluoromethylsulphonyl)benzimidazol-2-yl]quinolin



806 mg (3,37 mmol) N1-metyl-4-(triflometylsulphanyl)phenylen-1,2-diamin, 966,5 mg (4,04 mmol) axit 3-etylsulphanylquinolin-2-carboxylic, 673,0 mg (3,37 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcabodiimit hydroclorua (EDCI) và 4 mg rây phân tử (4 Å) được khuấy trong 30 ml pyridin trong agon ở 120°C trong 8 giờ. Hỗn hợp phản ứng được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp, và phần còn lại được hấp thu trong etyl axetat và rửa một lần bằng nước. Pha nước được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và sau đó dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien nước/axetonitril cùng với 0,1 ml/l axit formic làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 4,63; MH^+ : 420; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,11 (q, 2H), 3,91 (s, 1H), 7,69-7,80 (m, 4H), 7,89 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,53 (s, 1H).

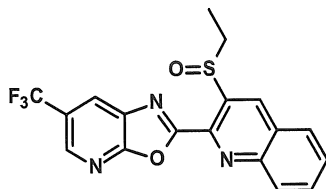
2-(3-etylsulphonyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin



86 mg (0,21 mmol) 2-(3-etylsulphanyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin được hòa tan trong 6 ml diclometan, 49,6 mg (1,07 mmol) axit formic và 188,4 mg (1,93 mmol) hydro peroxit 35% được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 7 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và phối trộn với dung dịch natri bisulphit, khuấy trong 30 phút, và sau đó phối trộn với dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (80:20 đến 0:100) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 3,27; MH^+ : 408; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,93 (q, 2H), 8,00 (t, 1H), 8,18 (t, 1H), 8,35 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 9,03 (s, 1H), 9.04 (s, 1H), 9.40 (s, 1H).

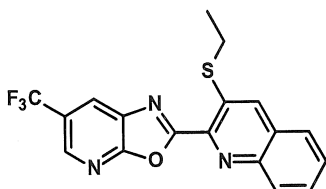
2-(3-ethylsulphinyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin



Phương pháp giống như phương pháp đã mô tả cho việc tổng hợp 2-(3-ethylsulphonyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin cũng được sử dụng để thu được dẫn xuất sulfoxit tương ứng 2-(3-ethylsulphinyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin.

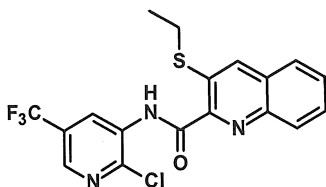
(logP (trung tính): 2,98; MH^+ : 492; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,25 (t, 3H), 2,93-3,02 (m, 1H), 3,47-3,56 (m, 1H), 7,90 (t, 1H), 8,05 (t, 1H), 8,37-8,41 (m, 2H), 8,99 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 9,10 (s, 1H).

2-(3-ethylsulphanyl-2-quinolyl)-6-metyloxazolo[5,4-b]pyridin



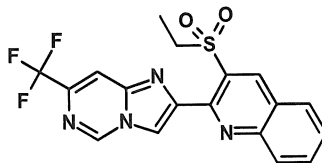
172 mg (0,36 mmol) N-(2-clo-5-metyl-3-pyridyl)-3-ethylsulphanylquinolin-2-carboxamit được hòa tan trong 6 ml dimetylformamit, 38,9 mg (0,36 mmol) natri carbonat được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở 145°C trong 4 giờ. Hỗn hợp này được bổ sung vào nước đá và chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước và làm khô bằng natri sulphat, và dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 4,36; MH^+ : 376; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,38 (t, 3H), 3,22 (q, 2H), 7,75-7,85 (m, 2H), 8,09 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,97 (s, 1H), 9,01 (s, 1H).

N-(2-clo-5-metyl-3-pyridyl)-3-etylsulphanylquinolin-2-carboxamit (IV-1)

240 mg (1,19 mmol) of 2-clo-5-(triflometyl)pyridin-3-amin và 357 mg (1,31 mmol) axit 3-etylsulphanylquinolin-2-carboxylic được hòa tan cùng với 0,39 ml (4,78 mmol) pyridin trong 20 ml dioxan, 367 mg (2,39 mmol) phosphoryl clorua được bổ sung vào, và hỗn hợp này được khuấy trong điều kiện hồi lưu trong 90 phút. Hỗn hợp này được cô đặc, phần còn lại được hấp thu trong etyl axetat và rửa bằng nước, và pha nước được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat (80:20 đến 40:60) làm chất rửa giải.

(logP (trung tính): 5,71; MH^+ : 412; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,37 (t, 3H), 3,12 (q, 2H), 7,74-7,84 (m, 2H), 8,07-8,14 (m, 2H), 8,49 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 11,12 (s, 1H).

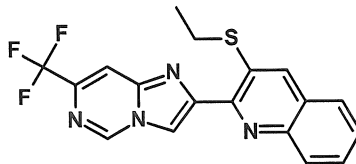
3-(etylsulphonyl)-2-[7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-2-yl]quinolin

3-(etylsulphanyl)-2-[7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-2-yl]quinolin (24 mg, 0,06 mmol) được hòa tan trong 2 ml diclometan. Hydro peroxit (dung dịch nước 35%, 43 mg, 0,44 mmol) và axit formic (15 mg, 0,32 mmol) được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 12 giờ. Trong khi làm mát bằng nước đá, 1 ml dung dịch natri bisulphit 40% được bổ sung vào từng giọt và hỗn hợp này được khuấy trong 1 giờ. Các pha được tách, và pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch natri hydrocarbonat, làm khô bằng natri sulphat và cô đặc trên thiết bị bay hơi kiểu quay. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký (chất rửa giải: xyclohexan, etyl axetat).

logP (trung tính): 2,63; MH^+ : 407; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9,70

(s, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,74 (s, 1H), 8,41 – 8,39 (m, 2H), 8,21 – 8,19 (m, 1H), 8,08 – 8,04 (m, 1H), 7,87–7,83 (m, 1H), 4,17 – 4,12 (m, 2H), 1,30 – 1,27 (m, 3H).

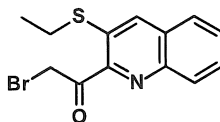
3-(ethylsulphanyl)-2-[7-(triflormetyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-2-yl]quinolin



2-Bromo-1-[3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-yl]etanon (453 mg, 0,92 mmol) và 6-(triflormetyl)pyrimidin-4-amin (150 mg, 0,92 mmol) được hòa tan trong 5 ml tert-butanol, và natri hydrocarbonat (386 mg, 4,59 mmol) được bổ sung vào. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 80°C trong 5 giờ. Sau khi dung môi đã được loại bỏ bằng thiết bị bay hơi kiểu quay, phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký.

logP (trung tính): 3,24; MH^+ : 375; 1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 9,68 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,37 (s, 2H), 8,02 – 7,99 (m, 2H), 7,75 – 7,70 (m, 1H), 7,66 – 7,62 (m, 1H), 3,16 – 3,10 (m, 2H), 1,34 – 1,30 (m, 3H).

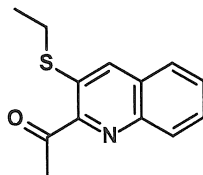
2-Bromo-1-[3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-yl]etanon



Pyridin hydrobromua perbromua ($PyBr_3$, 100 mg, 0,43 mmol) được hòa tan trong 4 ml axit axetic băng. HBr (32% trong axit axetic băng, 0,15 ml) được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 30 phút. Sau đó, 1-[3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-yl]etanon (100 mg, 0,43 mmol) hòa tan trong 1 ml axit axetic băng được bổ sung vào từng giọt. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 12 giờ và sau đó cô đặc. Phần còn lại được hấp thu bằng etyl axetat và rửa bằng dung dịch natri hydrocarbonat bão hòa và dung dịch natri clorua bão hòa. Sau khi pha hữu cơ đã được làm khô bằng natri sulphat, dung môi được loại bỏ trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Phần còn lại được chuyển sang phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

logP (axit): 3,95; MH^+ : 312

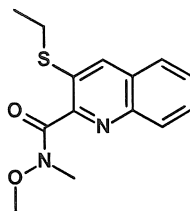
1-[3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-yl]etanon



Trong khí quyển agon, 3-(ethylsulphanyl)-N-methoxy-N-methylquinolin-2-carboxamid (2,8 g, 8,1 mmol) được hòa tan trong 155 ml THF khan và làm mát đến 0°C. Metylmagie bromua (3M trong diethyl ete, 8,1 ml, 24,3 mmol) được từ từ bổ sung vào từng giọt, sau đó hỗn hợp này được khuấy trong 2 giờ ở 0°C. Để kết thúc phản ứng, 5 ml dung dịch amoni clorua được bổ sung vào trong khi làm lạnh dần. Pha hữu cơ được tách và rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa. Dung môi được loại bỏ trong thiết bị làm bay hơi kiểu quay và sản phẩm thô được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 3,31; MH^+ : 232; 1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 8,38 (s, 1H), 8,08-8,00 (m, 2H), 7,79 – 7,70 (m, 2H), 3,10 – 3,04 (m, 2H), 2,75 (s, 3H), 1,35 – 1,31 (m, 3H).

3-(ethylsulphanyl)-N-methoxy-N-methylquinolin-2-carboxamid

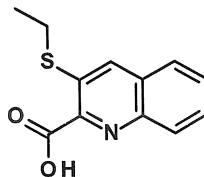


Axit 3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-carboxylic (240 mg, 1,02 mmol) và N,O-dimetylhydroxylamin hydroclorua (100 mg, 1,02 mmol) được hòa tan trong 3 ml diclometan và làm mát đến 0°C. 4-Dimetylaminopyridin (DMAP, 150 mg, 1,23 mmol) và N-(dimetylaminopropyl)-N'-etylcarbodiimide hydroclorua (EDCI, 217 mg, 1,13 mmol) được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 2 giờ ở 0°C, sau đó trong 12 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Dung dịch được rửa một lần bằng dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa và một lần bằng dung dịch natri clorua, sấy khô bằng natri sulphat và cô đặc. Sản phẩm thô được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 2,17; MH^+ : 277; 1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 8,46

(s, 1H), 8,02 – 7,98 (m, 2H), 7,78 – 7,75 (m, 1H), 7,70 – 7,64 (m, 1H), 3,51 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 3,12 – 3,05 (m, 2H), 1,28 – 1,24 (m, 3H).

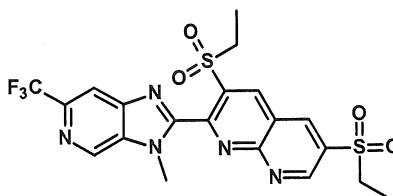
Axit 3-(ethylsulphanyl)quinolin-2-carboxylic



Trong khí quyển argon, 2,2,6,6-tetramethylpiperidin (5,34 g, 38 mmol) được hòa tan trong 50 ml THF khan và làm mát đến -25°C , n-Butyllithi (2,5 M trong hexan, 2,44 g, 38,1 mmol, 15,2 ml) được bổ sung vào từng giọt và hỗn hợp này được khuấy ở -25°C trong 20 phút. Sau đó, axit quinolin-2-carboxylic (3,00 g, 17,3 mmol) hòa tan trong 20 ml THF được bổ sung vào từng giọt và hỗn hợp này được khuấy ở -25°C trong 30 phút nữa. Diethyl disulphua (5,29 g, 43,3 mmol) được bổ sung vào từng giọt và, sau khi khuấy ở -25°C trong 30 phút, hỗn hợp này được làm ấm dần đến nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc trên thiết bị bay hơi kiểu quay và phần còn lại được hấp thu trong 100 ml xyclohexan/diethyl ete (3:7). Chất rắn còn lại được tách bằng cách lọc. Nước được bổ sung vào, và dung dịch HCl 2,5 M được bổ sung vào đến khi đạt độ pH = 4. Dung dịch nước được chiết ba lần bằng diclometan. Các phần chiết hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và dung môi được loại bỏ trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Sản phẩm thô được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 0,48; MH^+ : 234; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 8,43 (s, 1H), 8,03 – 8,00 (m, 2H), 7,78 – 7,74 (m, 1H), 7,70 – 7,67 (m, 1H), 3,13 – 3,07 (m, 2H), 1,32 – 1,28 (m, 3H).

3,6-Bis(ethylsulphonyl)-2-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1,8-naphthyridin

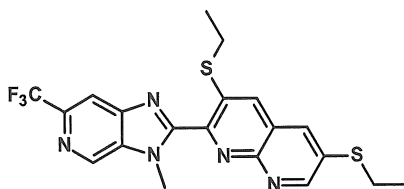


35 mg (0,078 mmol) 3,6-bis(ethylsulphonyl)-2-[3-metyl-6-(triflometyl)-

imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1,8-naphtyridin được hòa tan trong 3,5 ml diclometan, 18 mg (0,39 mmol) axit formic và 53 mg (0,545 mmol) hydro peroxit được bổ sung vào ở nhiệt độ trong phòng, và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

logP (trung tính): 2,21; MH^+ : 514; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 1,29 (t, 3H), 1,33 (t, 3H), 3,41 (q, 2H), 3,92 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 8,22 (s, 1H), 9,155 (s, 1H), 9,26 (d, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,65 (d, 1H).

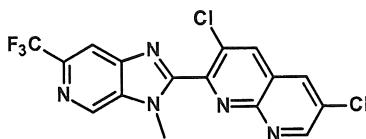
3,6-Bis(etylsulphanyl)-2-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1,8-naphtyridin



255 mg (0,493 mmol) 3,6-diclo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1,8-naphtyridin và 156 mg (1,48 mmol) natri etanthiolat được khuấy trong 14,2 ml DMF ở nhiệt độ trong phòng trong agon trong 2 giờ. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien xyclohexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

logP (trung tính): 3,23; MH^+ : 450; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 1,34 (t, 3H), 1,42 (t, 3H), 3,10 (q, 2H), 3,19 (q, 2H), 4,06 (s, 3H), 8,15 (d, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,92 (d, 1H), 9,10 (s, 1H).

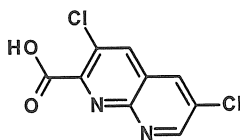
3,6-diclo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1,8-naphtyridin (V-3)



310 mg (1,62 mmol) N³-metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin, 512 mg (2,11 mmol) axit 3,6-diclo-1,8-naphtyridin-2-carboxylic và 622 mg (3,24 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) được khuấy trong 18 ml pyridin ở 120°C trong 18 giờ. 140 mg (0,811 mmol) axit para-toluensulphonic được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 120°C trong 18 giờ. Hỗn hợp này được pha loãng bằng axetonitril, lọc và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien diclometan/metanol làm chất rửa giải.

logP (trung tính): 2,44; MH⁺: 398; ¹H-NMR (400 MHz, CD₃CN) δ ppm: 4,03 (s, 3H), 8,22 (s, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,65 (s, 1H), 9,13 (s, 2H).

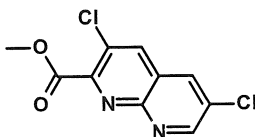
Axit 3,6-diclo-1,8-naphtyridin-2-carboxylic (III-1)



990 mg (3,85 mmol) metyl 3,6-diclo-1,8-naphtyridin-2-carboxylat và 184 mg (7,70 mmol) lithi hydroxit được khuấy trong 6,9 ml tetrahydrofuran và 2,3 ml nước ở nhiệt độ phòng trong 18 giờ. Dung dịch nước axit cloric 1N được bổ sung vào, và hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Toluene được bổ sung hai lần vào phần còn lại và hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

logP (axit): 0,70; MH⁺: 243; ¹H-NMR (400 MHz, CD₃CN) δ ppm: 8,39 (m, 1H), 8,49 (s, 1H), 9,07 (m, 1H).

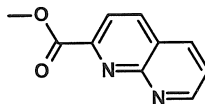
Metyl 3,6-diclo-1,8-naphtyridin-2-carboxylat (XXXI-1)



2,37 g (12,6 mmol) metyl 1,8-naphtyridin-2-carboxylat và 1,93 g (14,5 mmol) N-closucxinimit được khuấy trong 118 ml axetonitril ở 60°C trong 18 giờ. Hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien etyl axetat/metanol làm chất rửa giải.

logP (trung tính): 1,93; MH^+ : 257; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 4,01 (s, 3H), 8,71 (d, 1H), 8,845 (s, 1H), 9,20 (d, 1H).

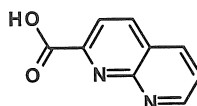
Metyl 1,8-naphtyridin-2-carboxylat (XXII-1)



600 mg (3,44 mmol) axit 1,8-naphtyridin-2-carboxylic và 0,754 ml (10,3 mmol) thionyl clorua được khuấy trong 15 ml metanol ở 60°C trong 6 giờ. Hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Metyl tert-butyl ete được bổ sung vào phần còn lại và hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

logP (trung tính): 0,77; MH^+ : 189; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 4,00 (s, 3H), 7,84 (dd, 1H), 8,27 (d, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,76 (d, 1H), 9,28 (m, 1H).

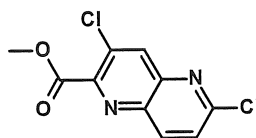
Axit 1,8-naphtyridin-2-carboxylic (XXX-1)



3,00 g (24,6 mmol) 2-aminonicotinaldehyt và 4,44 ml (49,1 mmol) metyl pyruvat được khuấy trong 30 ml etanol và 5,0 ml nước ở 0°C, 30 ml (90,0 mmol) dung dịch nước natri hydroxit 3N được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp này được điều chỉnh đến độ pH = 1 ở 0°C bằng khoảng 50 ml dung dịch nước axit cloric 1N, loại bỏ etanol trong áp suất giảm thấp và lọc.

logP (axit): -0,12; MH^+ : 175; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 7,72 (dd, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,495 (dd, 1H), 8,62 (d, 1H), 9,22 (m, 1H).

Metyl 3,6-diclo-1,5-naphtyridin-2-carboxylat (XXXI-2)

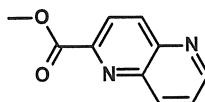


1,07 g (5,69 mmol) metyl 1,5-naphtyridin-2-carboxylat và 873 mg (6,54 mmol) N-closucinimit được khuấy trong 100 ml axetonitril ở 60°C trong 18 giờ. Hỗn hợp này

được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien etyl axetat/metanol làm chất rửa giải.

logP (trung tính): 2,46; MH^+ : 257; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 4,02 (s, 3H), 8,49 (m, 1H), 8,61 (s, 1H), 9,01 (d, 1H).

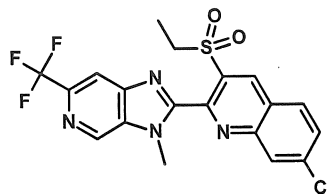
Metyl 1,5-naphtyridin-2-carboxylat (XXII-2)



1,00 g (5,74 mmol) axit 1,5-naphtyridin-2-carboxylic và 1,26 ml (17,2 mmol) thionyl clorua được khuấy trong 15 ml metanol ở 60°C trong 6 giờ. Hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp. Metyl tert-butyl ete được bổ sung vào phần còn lại và hỗn hợp này được loại bỏ dung môi trong áp suất giảm thấp.

logP (trung tính): 0,92; MH^+ : 189; 1H -NMR (400 MHz, CD_3CN) δ ppm: 4,04 (s, 3H), 8,19 (dd, 1H), 8,57 (d, 1H), 9,06 (dd, 1H), 9,15-9,19 (m, 2H).

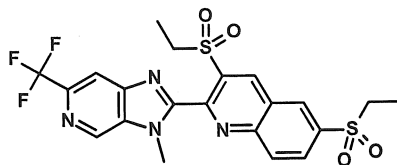
7-clo-3-etylsulphonyl-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin



6-clo-3-etylsulphonyl-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (250 mg, 0,59 mmol, hỗn hợp với bissulphua) được hòa tan trong diclometan (20 ml), và sau đó axit formic (136 mg, 2,95 mmol) và H_2O_2 (402 mg, 4,13 mmol) được bổ sung vào. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 14 giờ và rửa bằng dung dịch natri thiosulphat. Pha hữu cơ được lấy ra, làm khô bằng Na_2SO_4 và cô đặc. Các chất rắn được nghiền tinh chế bằng MeCN, lọc ra và làm khô trong áp suất giảm thấp, tạo ra hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng sản phẩm sạch.

(logP (trung tính): 2,63; MH^+ : 455; 1H -NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 9,05 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,23 (dd, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 4,11 (s, 3H), 3,26 (q, 2H), 1,34 (t, 3H).

3,6-Bis(ethylsulphonyl)-2-[3-methyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin

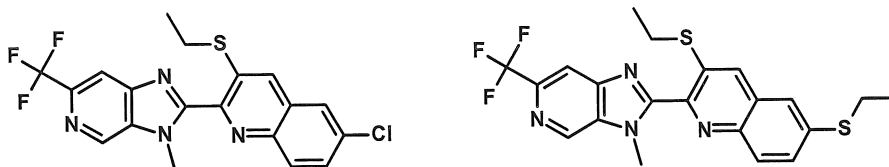


3,6-Bis(ethylsulphonyl)-2-[3-methyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (25 mg, 0,05 mmol) được hòa tan trong diclometan (5 ml), và sau đó axit formic (13 mg, 0,27 mmol) và H_2O_2 (38 mg, 0,39 mmol) được bổ sung vào. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 14 giờ và rửa bằng dung dịch natri thiosulphat. Pha hữu cơ được lấy ra, làm khô bằng Na_2SO_4 và cô đặc, tạo ra hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng sản phẩm sạch.

(logP (trung tính): 2,58; MH^+ : 513; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ 9,25 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,79 (d, 1H), 8,44 (m, 1H), 8,42 (m, 1H), 8,15 (s, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,91 (q, 2H), 3,29 (q, 2H), 1,42 (t, 3H), 1,38 (t, 3H).

6-clo-3-ethylsulphanyl-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin &

3,6-bis(ethylsulphanyl)-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin

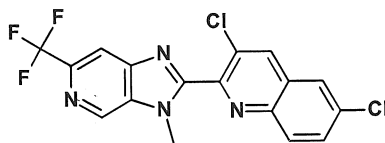


3,6-diclo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (0,20 g, 0,50 mmol) được hòa tan trong DMF (5 ml), và natri etylmercaptan (0,169 g, 2,01 mmol) được bổ sung vào. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 14 giờ, pha loãng bằng xyclohexan/etyl axetat và lọc. Cô đặc dịch lọc. Tinh chế sản phẩm thô bằng phương pháp sắc ký cột bằng HPLC điều chế với gradien MeCN/nước làm chất rửa giải tạo ra hai hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng hỗn hợp, hỗn hợp này được chuyển đổi tiếp mà không cần tinh chế thêm.

(logP (trung tính): 3,99; MH^+ : 423.

(logP (trung tính): 4,35; MH^+ : 423.

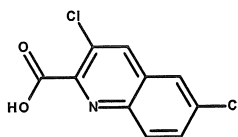
3,6-diclo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (V-4)



Axit 3,6-dicloquinolin-2-carboxylic (1,00 g, 4,13 mmol), N3-metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin (0,61 g, 3,17 mmol) và EDCI*HCl (0,61 g, 3,17 mmol) được hòa tan trong pyridin (20 ml), axit p-toluensulphonic (0,60 g, 3,17 mmol) được bổ sung vào và sau đó hỗn hợp này được khuấy ở 120°C trong 9 giờ. Sau khi làm mát đến nhiệt độ trong phòng, axetonitril được bổ sung vào và huyền phù thu được được lọc. Dịch lọc được cô đặc và phần còn lại được loại muối bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien $CH_2Cl_2/MeOH$ làm chất rửa giải. Sản phẩm thô thu được chuyển đổi tiếp mà không cần tinh chế thêm.

(logP (trung tính): 3,53; MH^+ : 397; 1H -NMR (400 MHz, DMSO- d_6): δ 9,31 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,95 (dd, 1H), 4,03 (s, 3H).

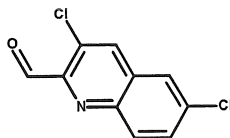
Axit 3,6-dicloquinolin-2-carboxylic (III-2)



Dung dịch chứa $NaClO_2$ (6,02 g, 66,7 mmol) và NaH_2PO_4 (8,00 g, 66,7 mmol) trong nước (25 ml) được bổ sung ở 0°C vào dung dịch chứa 3,6-dicloquinolin-2-carbaldehyt (3,00 g, 13,33 mmol) trong t-BuOH (30 ml). Hỗn hợp này được làm áp dần đến nhiệt độ trong phòng và khuấy ở nhiệt độ này trong 3 giờ. Sau khi bổ sung nước, sản phẩm được chiết bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch nước $NaHSO_3$ bão hòa và dung dịch nước NaCl bão hòa, làm khô bằng Na_2SO_4 và cô đặc. Sản phẩm thô chuyển đổi tiếp mà không cần tinh chế thêm.

MH^+ : 240; 1H -NMR (400 MHz, DMSO- d_6): δ 7,86-7,89 (dd, $J = 2,4$ & 9,04 Hz, 1H), 8,09-8,11 (d, $J = 9,08$ Hz, 1H), 8,17 (d, $J = 2,36$ Hz, 1H), 8,71 (s, 1H), 14,26 (brs, 1H).

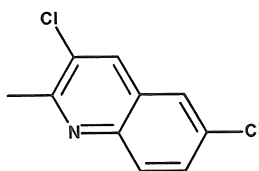
3,6-dicloquinolin-2-carbaldehyt



Bổ sung SeO_2 (4,73 g, 42,7 mmol) vào dung dịch chứa 3,6-diclo-2-metylquinolin (3,00 g, 14,2 mmol) trong 1,4-dioxan (30 ml). Hỗn hợp thu được được hồi lưu trong 3 giờ và sau đó cô đến khô. Sản phẩm thô được hấp thụ bằng nước. Chất rắn màu trắng kết tủa được lọc ra, rửa bằng hexan và làm khô trong áp suất giảm thấp.

MH^+ : 226; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ 7,72-7,75 (dd, $J = 2,28$ & $9,0$ Hz, 1H), 7,80-7,81 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,17-8,19 (d, $J = 9,24$ Hz, 1H), 8,2 (s, 1H), 10,37 (s, 1H).

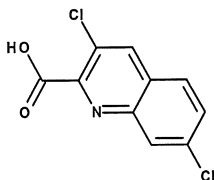
3,6-diclo-2-metylquinolin



Bổ sung NaOH trong nước vào 5-clo-2-metyl-1H-indol (5,00 g, 30,3 mmol) và TEBAC (0,60 g, 0,300 mmol) trong CHCl_3 (150 ml) ở 0°C . Hỗn hợp này được khuấy ở 0°C trong 3 giờ và sau đó ở nhiệt độ phòng trong 14 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được được bỏ dung dần vào nước đá và chiết bằng cloroform. Pha hữu cơ được rửa bằng nước, làm khô bằng Na_2SO_4 và cô đặc trong thiết bị bay hơi kiểu quay. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien hexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

MH^+ : 212; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ 2,78 (s, 3H), 7,58-7,61 (dd, $J = 2,32$ & $9,0$ Hz, 1H), 7,68-7,69 (d, $J = 2,28$ Hz, 1H), 7,91-7,94 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 8,01 (s, 1H).

Axit 3,7-dicloquinolin-2-carboxylic (III-3)

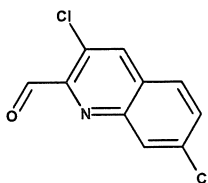


Dung dịch chứa NaClO_2 (6,02 g, 66,7 mmol) và NaH_2PO_4 (8,00 g, 66,7 mmol) trong nước (25 ml) được bổ sung ở 0°C vào dung dịch chứa 3,7-dicloquinolin-2-

carbaldehyt (3,00 g, 13,33 mmol) trong t-BuOH (30 ml). Hỗn hợp này được làm áp dần đến nhiệt độ trong phòng và khuấy ở nhiệt độ này trong 3 giờ. Sau khi bổ sung nước, sản phẩm được chiết bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch nước NaHCO₃ bão hòa và dung dịch nước NaCl bão hòa, làm khô bằng Na₂SO₄ và cô đặc. Sản phẩm thô chuyển đổi tiếp mà không cần tinh chế thêm.

MH⁺: 241; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 14,29 (br, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H).

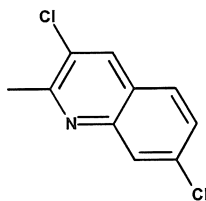
3,7-dicloquinolin-2-carbaldehyt



Bổ sung SeO₂ (4,73 g, 42,7 mmol) vào dung dịch chứa 3,7-diclo-2-metylquinolin (3,00 g, 14,2 mmol) trong 1,4-dioxan (30 ml). Hỗn hợp thu được được hồi lưu trong 3 giờ và sau đó cô đến khô. Sản phẩm thô được hấp thụ bằng nước. Chất rắn màu trắng kết tủa được lọc ra, rửa bằng hexan và làm khô trong áp suất giảm thấp.

MH⁺: 226; ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ 7,64-7,67 (dd, *J* = 1,96 & 8,76 Hz, 1H), 7,76-7,78 (d, *J* = 8,84 Hz, 1H), 8,24-8,25 (d, *J* = 1,92 Hz, 1H), 8,26 (s, 1H), 10,36 (s, 1H).

3,7-diclo-2-metylquinolin

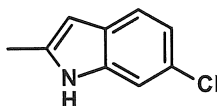


Bổ sung NaOH trong nước vào 6-clo-2-metyl-1H-indol (5,00 g, 30,3 mmol) và TEBAC (0,60 g, 0,300 mmol) trong CHCl₃ (150 ml) ở 0°C. Hỗn hợp này được khuấy ở 0°C trong 3 giờ và sau đó ở nhiệt độ trong phòng trong 14 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được được bỏ dung dần vào nước đá và chiết bằng cloroform. Pha hữu cơ được rửa bằng nước, làm khô bằng Na₂SO₄ và cô đặc trong thiết bị bay hơi kiểu quay. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien hexan/etyl axetat

làm chất rửa giải.

MH^+ : 214; 1H -NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 2,79 (s, 3H), 7,44-7,47 (dd, $J = 2,08$ & 8,72 Hz, 1H), 7,63-7,65 (d, $J = 8,72$ Hz, 1H), 7,99-8,00 (d, $J = 1,92$ Hz, 1H), 8,07 (s, 1H).

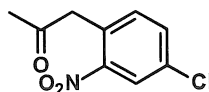
6-clo-2-metyl-1H-indol



Bổ sung axit axetic bằng (50 ml) và bột sắt (12,4 g, 234,7 mmol) vào dung dịch chứa 1-(4-clo-2-nitrophenyl)propan-2-on (10,0 g, 46,9 mmol) trong EtOH/ H_2O (1:1, 50 ml) ở $0^\circ C$. Sau đó, hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở $100^\circ C$ trong 4 giờ. Hỗn hợp này được cô đặc, và phần còn lại được pha loãng bằng nước và chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước, làm khô bằng Na_2SO_4 và sau đó cô đặc. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien hexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

MH^+ : 166; 1H -NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 2,42 (s, 3H), 7,00-7,02 (dd, $J = 1,84$ & 8,36 Hz, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,37-7,39 (d, $J = 8,36$ Hz, 1H), 7,84 (bs, 1H).

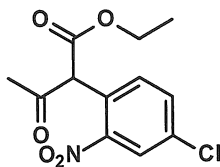
1-(4-clo-2-nitrophenyl)propan-2-on



Etyl 2-(2-nitro-4-clophenyl)-3-oxobutytrat (28,0 g, 98,2 mmol) được bổ sung ở $0^\circ C$ vào dung dịch axit axetic bằng (60 ml) và axit sulphuric (40 ml). Sau đó, hỗn hợp phản ứng được khuấy ở $100^\circ C$ trong 8 giờ. Sau khi làm mát đến nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp này được bổ sung dần vào nước đá và chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, làm khô bằng Na_2SO_4 và loại bỏ dung môi. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với gradien hexan/etyl axetat làm chất rửa giải.

MH^+ : 212; 1H -NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 2,32 (s, 3H), 4,09 (s, 2H), 7,19-7,21 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,54-7,57 (dd, $J = 2,2$ & 8,2 Hz, 1H), 8,11 (d, $J = 2,16$ Hz, 1H).

Etyl 2-(2-nitro-4-clophenyl)-3-oxobutytrat

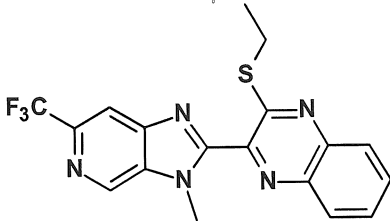
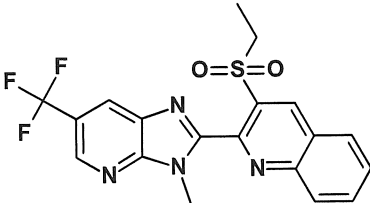
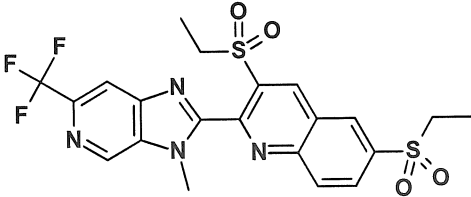
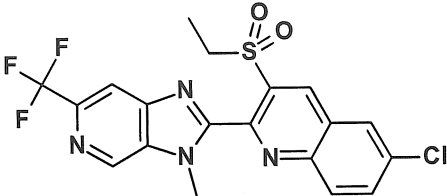
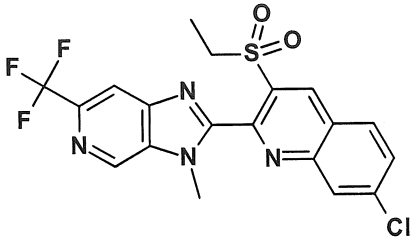
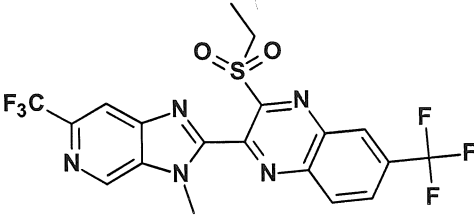
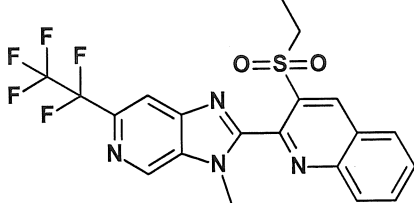


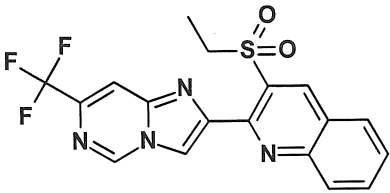
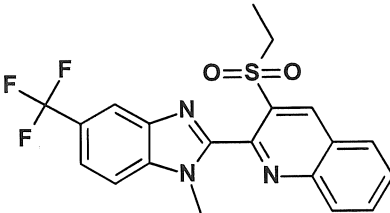
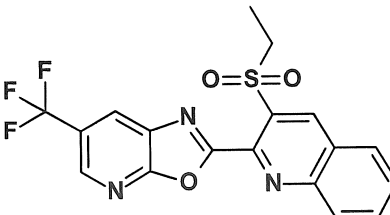
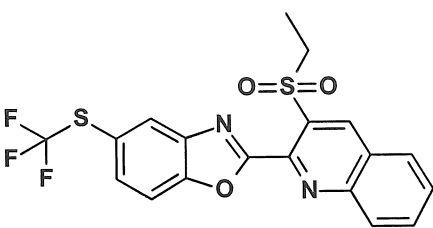
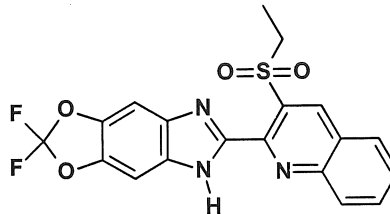
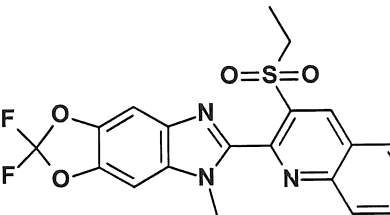
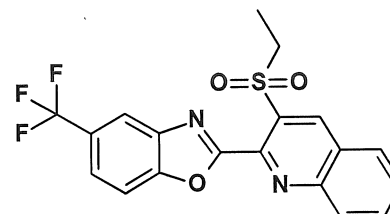
Ethyl axetoacetat (8,16 g, 62,8 mmol) được bổ sung ở 0°C vào huyền phù chứa Cs_2CO_3 (51,2 g, 157,1 mmol) trong DMF (150 ml). Sau khi làm ấm đến nhiệt độ trong phòng, 1,4-diclo-2-metylbenzen (10,0 g, 52,4 mmol) được bổ sung từ từ từng giọt. Sau đó, hỗn hợp phản ứng thu được được gia nhiệt đến 80°C trong 4 giờ. Để ngừng phản ứng, hỗn hợp này được bổ sung vào nước đá và chiết bằng ethyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, làm khô bằng Na_2SO_4 và cô đặc. Phần còn lại được chuyển đổi tiếp mà không cần tinh chế thêm.

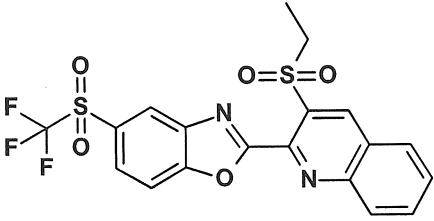
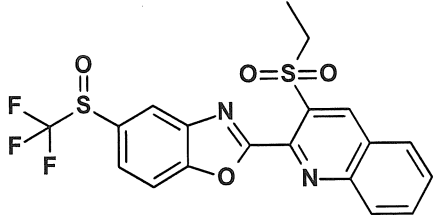
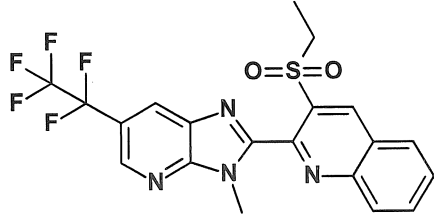
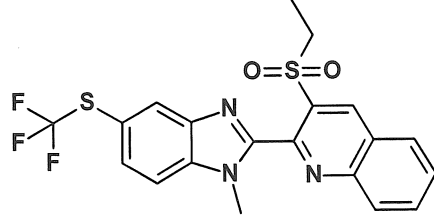
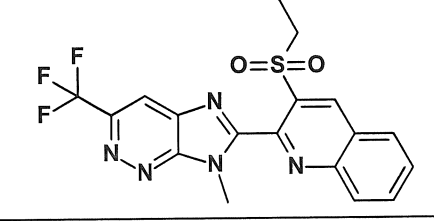
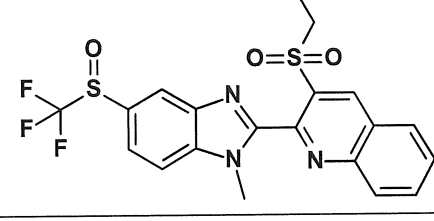
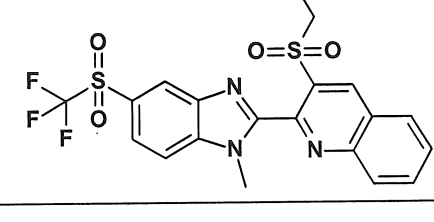
MH^+ : 286.

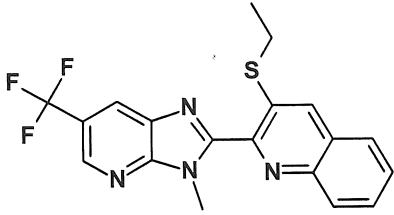
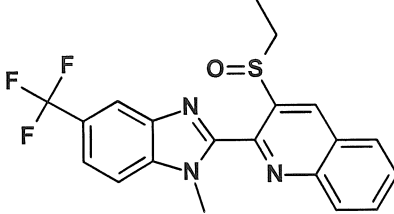
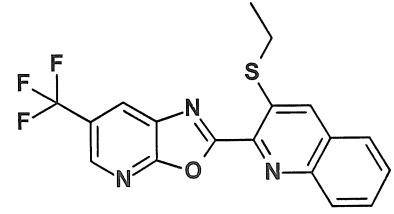
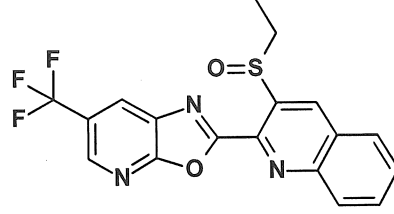
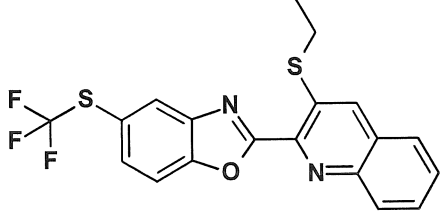
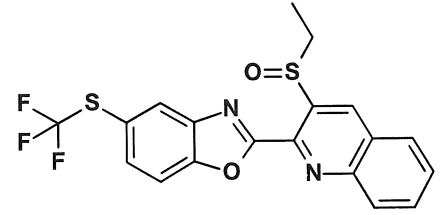
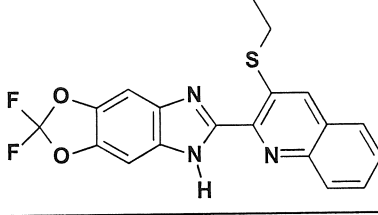
Tương tự các ví dụ và theo các quy trình điều chế đã được mô tả trên đây, có thể thu được các hợp chất có công thức (I) sau đây:

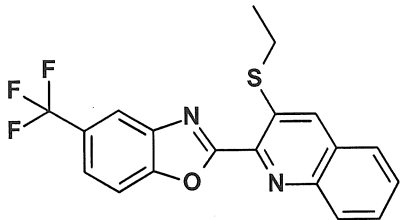
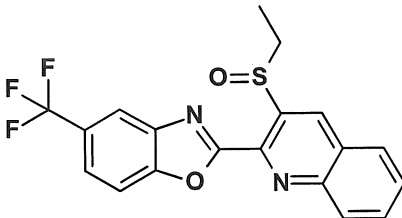
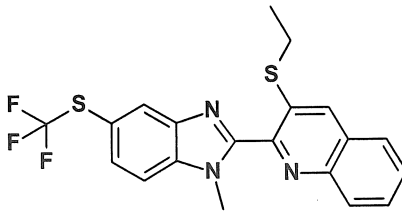
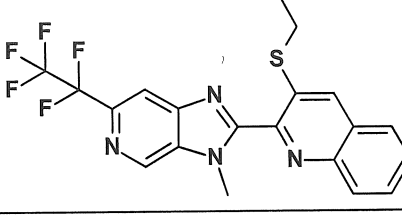
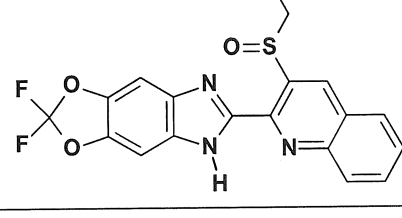
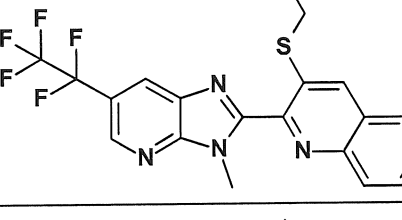
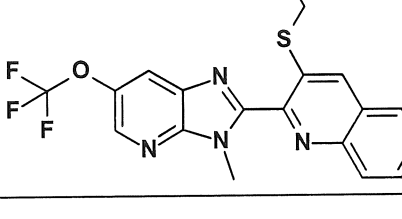
Ví dụ	Cấu tạo
I-1	
I-2	
I-3	

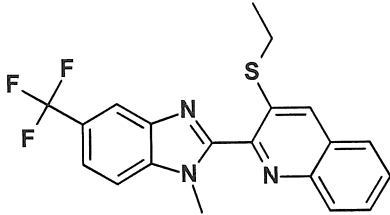
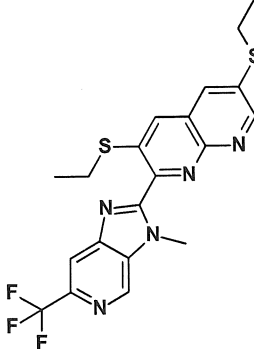
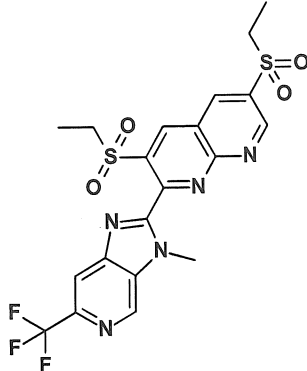
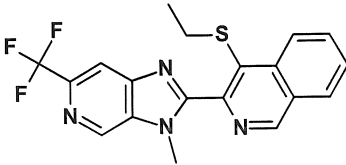
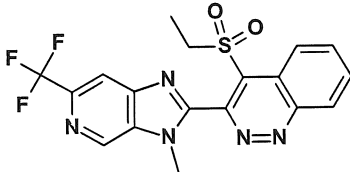
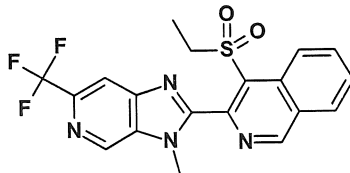
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	
I-8	
I-9	
I-10	

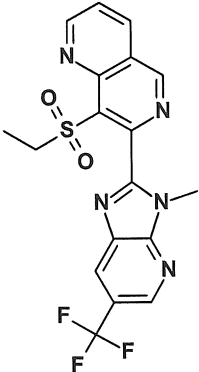
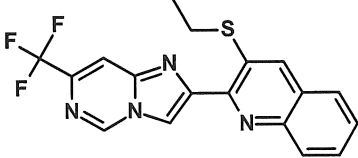
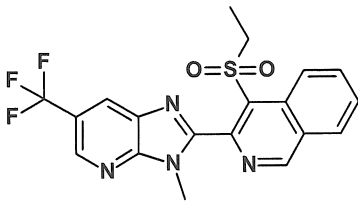
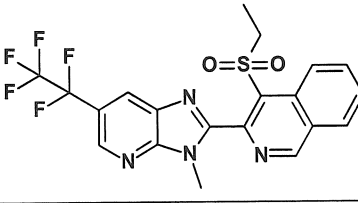
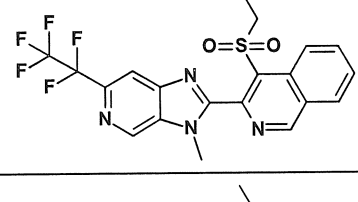
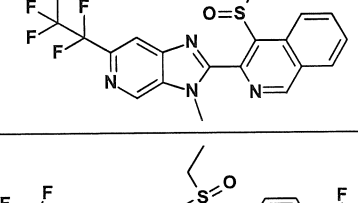
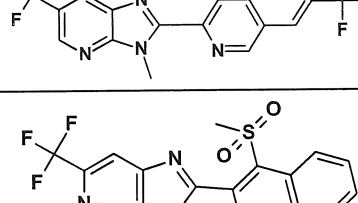
I-11	
I-12	
I-13	
I-14	
I-15	
I-16	
I-17	

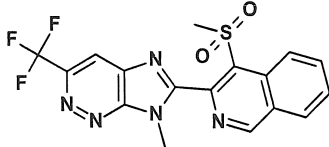
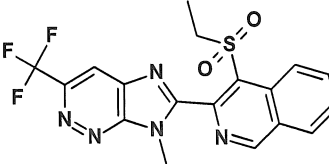
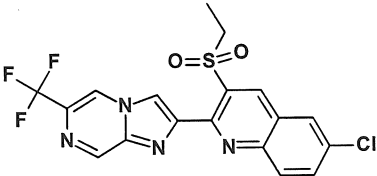
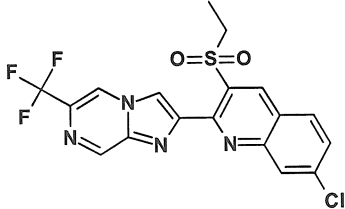
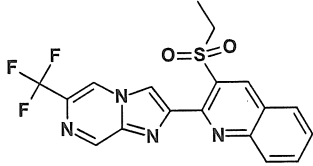
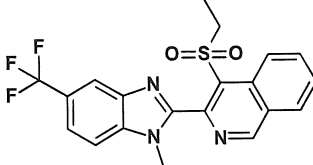
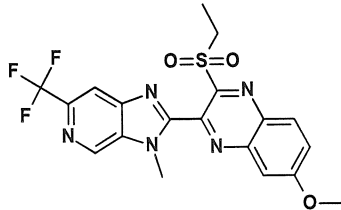
I-18	
I-19	
I-20	
I-21	
I-22	
I-23	
I-24	

I-25	
I-26	
I-27	
I-28	
I-29	
I-30	
I-31	

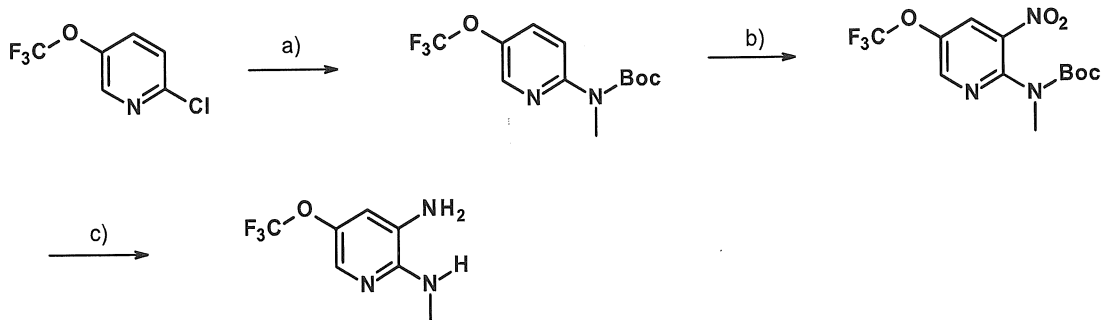
I-32	
I-33	
I-34	
I-35	
I-36	
I-37	
I-38	

I-39	
I-40	
I-41	
I'-42	
I'-43	
I'-44	

I'-45	
I-46	
I'-47	
I'-48	
I'-49	
I'-50	
I'-51	
I'-52	

I'-53	
I'-54	
I-55	
I-56	
I-57	
I'-58	
I-59	

Điều chế N2-metyl-5-(triflometoxy)pyridin-2,3-diamin (II-1)



Bước a)

24 g (120 mmol) 2-clo-5-(triflometoxy)pyridin, 19,1 g (150 mmol) tert-butyl N-metylcarnamat và 17,5 g (180 mmol) natri tert-butoxit được hòa tan trong 400 ml toluen, 2,8 g (3 mmol) tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi(0) và 1,73 g (3 mmol) Xantphos được bổ sung vào trong agon, và hỗn hợp này được khuấy ở 100-105°C trong 12 giờ. Sau đó, hỗn hợp này được lọc qua xelit và dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp.

Bước b)

Bổ sung 30 g (103 mmol) tert-butyl N-metyl-N-[5-(triflometoxy)-2-pyridyl]carnamat và sau đó là 10,4 ml (166 mmol) axit nitric đặc vào 100 ml dung dịch axit sulphuric đã làm mát đến 0°C. Hỗn hợp này được khuấy ở 5-10°C trong 2 giờ và phối trộn với nước đá. Dung dịch này được trung hòa bằng natri hydroxit và chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulphat và dung môi được chưng cất trong điều kiện áp suất giảm thấp. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột với hỗn hợp cloroform/hexan (1:2) làm chất rửa giải.

Bước c)

Hỗn hợp gồm 10,0 g (42,2 mmol) tert-butyl N-metyl-N-[3-nitro-5-(triflometoxy)-2-pyridyl]carnamat và 0,7 g paladi/than (10%) được khuấy trong 250 ml metanol trong khí quyển hydro ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ. Sau đó, hỗn hợp này được lọc qua xelit và dung môi được chưng cất trong áp suất giảm thấp. Tiến hành tinh chế tiếp sản phẩm bằng cách chưng cất chân không ở 88-90°C và 10Pa (0,1 mbar).

^1H NMR(400 MHz, CDCl_3 , ppm): δ 7,70 (d, $J = 0,8$ Hz, 1 H), 6,75 (d, $J = 0,8$ Hz, 1 H), 4,20 (br, s., 1 H), 3,32 (br, s., 2 H), 3,00 (s, 3 H). Tiến hành đo phổ NMR trên thiết

bị Bruker Avance 3300 có trang bị đầu dò lỏng dải rộng 5 mm.

Các giá trị logP được xác định theo hướng dẫn EEC số 79/831 Annex V.A8 bằng HPLC (sắc ký lỏng hiệu năng cao - high-performance liquid chromatography) trên cột pha đảo (C 18). Nhiệt độ: 55°C.

Việc xác định LC-MS trong khoảng axit được thực hiện ở độ pH=2,7 bằng cách sử dụng dung dịch nước axit formic và axetonitril 0,1% (chứa 0,1% axit formic) làm chất rửa giải; gradien tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. logP (HCOOH) được nêu trong bảng.

Việc xác định LC-MS trong khoảng trung tính được thực hiện ở độ pH=7,8 với dung dịch nước amoni hydrocacbonat 0,001M và axetonitril làm các chất rửa giải; gradien tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. logP (trung tính) được nêu trong bảng.

Việc hiệu chỉnh được thực hiện bằng cách sử dụng các alkan-2-on không phân nhánh (có 3 đến 16 nguyên tử cacbon) với các trị số logP đã biết (trị số logP được xác định trên cơ sở thời gian lưu bằng cách nội suy tuyến tính giữa hai alkanon liên tiếp).

Dữ liệu NMR của các ví dụ được chọn được liệt kê dưới dạng thông thường (trị số δ , tách đa bội, số nguyên tử hydro) hoặc dưới dạng các danh sách đỉnh NMR.

Trong mỗi trường hợp, dung môi trong đó phổ NMR được ghi được nêu rõ.

Phương pháp liệt kê đỉnh NMR

Dữ liệu ^1H NMR của các ví dụ được chọn được đưa ra dưới dạng danh sách đỉnh ^1H NMR. Đối với mỗi một đỉnh tín hiệu, trước tiên, trị số δ tính bằng ppm và sau đó, cường độ tín hiệu nằm trong dấu ngoặc đơn được liệt kê. Cặp trị số δ – số cường độ tín hiệu đối với các đỉnh tín hiệu khác nhau được liệt kê với sự phân cách nhau bằng dấu chấm phẩy.

Do đó, danh sách đỉnh của một ví dụ có dạng:

δ_1 (cường độ₁); δ_2 (cường độ₂);; δ_i (cường độ_i);; δ_n (cường độ_n)

Cường độ của các tín hiệu rõ nét tương ứng với độ cao của các tín hiệu trong ví dụ được in ra của phổ NMR tính bằng cm và thể hiện các tỷ lệ thực của các cường độ tín

hiệu. Trong trường hợp tín hiệu rộng, một số đỉnh hoặc giá trị trung bình của cường độ tín hiệu và cường độ tương đối của nó có thể được thể hiện so sánh với tín hiệu cường độ mạnh nhất trong phổ.

Việc hiệu chỉnh sự chuyển dịch hóa học của phổ ^1H NMR được thực hiện bằng cách sử dụng tetrametylsilan và/hoặc sự chuyển dịch hóa học của dung môi, nhất là trong trường hợp phổ được đo trong DMSO. Do đó, đỉnh tetrametylsilan có thể nhưng không nhất thiết xuất hiện trong các danh sách liệt kê đỉnh NMR.

Danh sách các đỉnh ^1H NMR là tương tự như dữ liệu ^1H -NMR được in ra thông thường và do đó thường chứa tất cả các đỉnh được liệt kê trong diễn giải NMR thông thường.

Ngoài ra, giống như dữ liệu ^1H NMR in ra thông thường, các danh sách nêu trên có thể thể hiện các tín hiệu về dung môi, các tín hiệu về chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích mà cũng được đề xuất bởi sáng chế, và/hoặc các đỉnh của các tạo chất.

Khi thông báo về các tín hiệu của hợp chất nằm trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, danh sách các đỉnh ^1H NMR ở đây thể hiện các đỉnh dung môi chuẩn, ví dụ các đỉnh của DMSO trong DMSO- D_6 và đỉnh của nước, trung bình các đỉnh này thường có cường độ cao.

Các đỉnh của các chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích và/hoặc các đỉnh của tạp chất trung bình thường có cường độ thấp hơn so với đỉnh của các hợp chất đích (ví dụ, với độ tinh khiết > 90%).

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc tạp chất như vậy có thể là điển hình trong quy trình điều chế cụ thể. Do đó, các đỉnh của chúng có thể giúp để nhận khả năng mô phỏng của quy trình điều chế của tác giả sáng chế với việc tham chiếu "các dấu ấn sản phẩm phụ".

Chuyên gia tính toán các đỉnh của các hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, và cũng bằng các giá trị kỳ vọng đánh giá theo kinh nghiệm) nếu cần thiết, có thể tách riêng đỉnh của các hợp chất đích, tùy ý sử dụng các bộ lọc cường độ bổ sung. Sự tách riêng này có thể tương tự như việc chọn đỉnh cần quan tâm trong cách diễn giải ^1H NMR thông thường.

Các chi tiết khác về các danh sách đỉnh ^1H NMR có thể được tìm thấy trong tài liệu Research Disclosure Database Number 564025.

Ví dụ I-1:

^1H -NMR(400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ =
9,338(4,4);9,320(3,8);8,518(1,5);8,498(1,6);8,328(4,0);8,300(1,5);8,278(2,0);8,172(0,9);8,168(0,9);8,154(1,2);8,151(1,6);8,133(0,8);8,130(0,8);7,993(1,0);7,991(1,0);7,973(1,7);7,955(0,8);7,953(0,8);3,927(16,0);3,864(1,0);3,846(3,4);3,827(3,4);3,809(1,0);3,321(49,5);2,672(0,4);2,525(0,9);2,512(22,4);2,507(46,3);2,503(61,4);2,498(44,5);2,494(21,5);2,330(0,4);2,074(1,7);1,252(3,6);1,234(8,1);1,215(3,5);0,000(1,7)

Ví dụ I-2:

^1H -NMR(400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ =
9,289(4,1);8,816(0,4);8,584(4,4);8,317(4,4);8,290(0,7);8,135(0,5);8,107(3,4);8,085(3,9);7,953(0,4);7,838(0,8);7,823(1,4);7,820(1,7);7,799(1,3);7,776(1,3);7,774(1,3);7,756(1,6);7,736(0,7);7,572(0,3);6,839(0,4);4,029(16,0);3,385(0,8);3,333(91,2);3,324(82,2);3,151(1,2);3,133(3,8);3,115(3,9);3,096(1,3);2,891(2,9);2,879(0,8);2,811(0,6);2,799(0,6);2,732(2,0);2,671(0,7);2,667(0,6);2,507(91,1);2,502(120,9);2,498(95,2);2,329(0,7);1,316(0,5);1,310(0,3);1,298(0,9);1,285(4,1);1,267(8,5);1,249(4,0);1,169(0,3);0,000(1,3)

Ví dụ I-3:

^1H -NMR(400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ =
9,382(0,4);9,321(4,0);8,471(1,3);8,466(0,9);8,458(1,4);8,454(1,0);8,447(1,5);8,439(0,3);8,401(1,2);8,395(1,0);8,390(1,8);8,382(1,3);8,377(1,8);8,370(0,6);8,333(4,2);8,265(0,6);8,252(2,6);8,248(1,9);8,240(2,2);8,233(1,6);8,228(2,3);8,216(0,4);5,754(0,7);4,390(1,7);3,993(16,0);3,847(1,2);3,829(4,0);3,810(4,0);3,792(1,2);3,317(37,4);2,676(0,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,506(58,3);2,502(77,1);2,497(58,9);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);1,425(0,4);1,406(0,9);1,388(0,4);1,289(4,1);1,270(8,8);1,252(4,0);0,000(2,9)

Ví dụ I-4:

^1H -NMR(400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ =
9,331(3,4);8,368(3,5);8,366(3,6);8,184(1,3);8,181(1,4);8,163(1,6);8,161(1,6);8,086(1,2);8,084(1,3);8,065(1,7);8,063(1,7);7,980(0,9);7,976(1,0);7,963(1,2);7,959(1,6);7,956(0,8);7,942(0,9);7,938(0,9);7,872(1,1);7,868(1,1);7,854(0,9);7,851(1,6);7,848(1,1);7,834(0,7);7,830(0,7);4,178(16,0);3,327(2,2);3,317(49,6);3,309(4,9);3,290(4,0);3,272(1,3);2,671(0,4);2,511(24,5);2,507(48,6);2,502(65,4);2,498(49,8);2,493(25,2);2,472(0,5);2,329(0,4);1,398(0,4);1,384(4,1);1,366(8,9);1,347(4,0);0,146(0,3);0,008(3,7);0,000(82,5);-0,008(3,5);-0,150(0,4)

Ví dụ I-5:

^1H -NMR(400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ =
9,342(4,1);8,924(2,2);8,921(2,2);8,712(2,2);8,708(2,2);8,518(1,4);8,498(1,5);8,304(1,3);8,283(1,8);8,172(0,9);8,168(0,9);8,154(1,1);8,151(1,5);8,147(0,8);8,133(0,9);8,129(0,8);7,992(1,0);7,989(1,0);7,971(1,6);7,969(1,1);7,954(0,8);7,951(0,8);5,756(0,9);3,903(0,9);3,884(3,2);3,866(3,2);3,847(1,0);3,833(16,0);3,323(80,9);2,676(0,3);2,672(0,4);2,667(0,3);2,525(1,0);2,511(25,5);2,507(54,0);2,502(75,3);2,498(55,4);2,49

3(25,9);2,329(0,5);1,265(3,3);1,246(7,6);1,228(3,3);0,008(0,5);0,000(17,4);-0,009(0,6)
Ví dụ I-6: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, CDCl_3): δ= 9,245(4,5);9,045(3,7);8,795(2,5);8,791(2,5);8,464(1,0);8,442(3,3);8,426(2,5);8,421(2,3);8,403(0,8);8,399(0,8);8,148(3,9);7,265(14,1);5,301(0,7);3,996(16,0);3,939(1,0);3,921(3,5);3,902(3,6);3,884(1,1);3,319(1,1);3,300(3,6);3,281(3,7);3,263(1,2);1,624(11,0);1,440(3,6);1,421(7,7);1,402(6,1);1,382(8,0);1,364(3,6);1,255(0,9);0,000(0,5)
Ví dụ I-7: $^1\text{H-NMR}$(601,6 MHz, CDCl_3): δ= 9,014(3,6);8,996(4,2);8,211(2,0);8,197(2,3);8,128(6,8);7,970(2,0);7,966(1,5);7,955(1,8);7,952(1,3);7,265(1,8);7,261(4,8);5,302(0,6);5,298(1,5);3,950(16,0);3,872(1,2);3,859(3,8);3,847(3,8);3,835(1,2);1,565(3,0);1,401(3,9);1,388(8,0);1,376(3,7);1,257(0,4);0,004(1,9);0,000(5,0)
Ví dụ I-8: $^1\text{H-NMR}$(601,6 MHz, CDCl_3): δ= 9,053(3,3);8,793(2,3);8,792(2,5);8,790(2,4);8,565(3,7);8,227(3,4);8,226(3,4);8,153(1,0);8,150(1,1);8,138(2,0);8,136(2,1);8,108(2,8);8,094(1,6);7,265(6,5);5,299(1,2);4,114(16,0);4,011(0,4);3,938(0,4);3,279(1,1);3,267(3,6);3,254(3,6);3,242(1,2);1,612(2,0);1,370(3,7);1,357(7,9);1,345(3,7);1,322(0,5);1,256(0,4);0,000(4,7)
Ví dụ I-9: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,340(4,1);8,840(2,5);8,685(1,7);8,663(2,1);8,490(1,7);8,485(1,6);8,468(1,3);8,463(1,4);8,357(4,4);8,315(0,5);4,096(0,4);4,025(16,0);3,896(1,1);3,877(3,9);3,859(3,9);3,840(1,2);3,320(70,9);2,676(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(3,5);2,510(79,2);2,506(167,8);2,502(236,0);2,497(178,5);2,333(1,0);2,328(1,4);2,324(1,0);1,305(4,1);1,287(8,9);1,268(4,0);1,235(0,9);0,146(0,7);0,008(5,0);0,000(162,7);-0,008(6,4);-0,150(0,7)
Ví dụ I-10: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,344(8,5);8,520(1,5);8,501(1,6);8,360(4,4);8,358(4,3);8,297(1,5);8,276(2,0);8,173(0,9);8,170(0,9);8,156(1,2);8,152(1,6);8,135(0,9);8,131(0,9);7,996(1,1);7,993(1,1);7,975(1,7);7,958(0,8);7,955(0,8);3,929(16,0);3,873(1,0);3,854(3,4);3,836(3,5);3,817(1,0);3,319(42,6);2,675(0,9);2,671(1,2);2,666(0,9);2,524(2,9);2,519(4,5);2,511(74,4);2,506(154,2);2,502(204,0);2,497(145,1);2,493(69,5);2,333(0,9);2,328(1,2);2,324(0,9);1,398(8,1);1,251(3,6);1,232(8,1);1,214(3,5);0,146(0,3);0,008(2,3);0,000(74,8);-0,008(2,7);-0,150(0,3)
Ví dụ I-11: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,701(6,1);9,234(8,6);8,736(9,1);8,412(3,2);8,395(8,0);8,206(2,9);8,184(4,0);8,084(1,9);8,081(1,9);8,067(2,4);8,064(3,2);8,046(1,7);8,043(1,6);7,871(2,1);7,869(2,1);7,851(3,4);7,833(1,7);7,831(1,6);5,758(0,9);4,174(1,9);4,156(6,5);4,137(6,5);4,119(2,0);4,099(0,5);4,085(0,4);3,322(51,5);3,176(2,4);3,163(2,3);2,676(0,6);2,672(0,8);2,667(0,6);2,525(2,1);2,507(108,3);2,503(142,1);2,498(103,3);2,334(0,6);2,329(0,8);2,3

25(0,6);1,305(7,2);1,286(16,0);1,268(7,1);1,259(1,4);1,241(1,0);1,233(1,0);0,880(0,6);0,008(0,9);0,000(29,2);-0,009(1,2)
Ví dụ I-12: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,308(4,8);8,502(1,7);8,482(1,8);8,282(1,6);8,261(2,2);8,151(4,0);8,134(1,7);8,116(0,8);8,113(0,9);7,984(1,9);7,970(1,4);7,963(2,4);7,952(1,8);7,932(0,9);7,753(1,7);7,732(1,4);3,926(1,0);3,908(3,5);3,889(3,5);3,871(1,1);3,817(16,0);3,320(31,9);2,670(1,3);2,666(1,1);2,523(2,9);2,506(167,3);2,501(228,6);2,497(175,1);2,332(1,0);2,328(1,3);2,324(1,1);1,397(2,8);1,253(3,6);1,235(8,0);1,217(3,6);0,146(0,4);0,008(2,2);0,000(74,0);-0,150(0,4)
Ví dụ I-13: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,396(8,7);9,044(6,3);9,032(5,5);8,522(3,1);8,502(3,3);8,360(3,1);8,339(4,0);8,203(1,8);8,200(1,8);8,185(2,4);8,182(3,2);8,164(1,8);8,161(1,7);8,025(2,1);8,023(2,1);8,005(3,4);7,987(1,7);3,962(2,1);3,943(7,0);3,925(7,1);3,906(2,2);3,321(41,5);3,151(0,8);2,676(0,8);2,672(1,1);2,667(0,8);2,525(2,7);2,507(143,3);2,503(183,1);2,498(133,7);2,334(0,8);2,329(1,1);2,325(0,8);1,990(0,7);1,397(7,6);1,340(7,4);1,322(16,0);1,303(7,1);1,175(0,4);0,000(2,0)
Ví dụ I-14: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,366(8,9);8,510(3,2);8,490(3,4);8,406(5,6);8,403(5,7);8,329(3,1);8,308(4,1);8,183(1,9);8,180(1,9);8,165(2,6);8,162(3,6);8,157(5,8);8,144(2,1);8,141(2,1);8,135(6,2);8,004(2,2);7,984(3,5);7,966(1,8);7,950(3,3);7,946(3,2);7,929(2,7);7,925(2,7);4,013(2,0);3,995(6,9);3,976(7,0);3,958(2,1);3,322(22,1);2,677(0,5);2,673(0,6);2,508(83,7);2,504(107,7);2,499(78,2);2,330(0,6);2,326(0,5);1,990(0,5);1,397(15,1);1,336(7,3);1,317(16,0);1,299(7,1);0,146(0,4);0,008(3,0);0,000(78,2);-0,008(3,8);-0,149(0,4)
Ví dụ I-15: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 13,544(4,7);9,270(10,1);8,445(4,0);8,424(4,2);8,256(3,8);8,235(5,0);8,121(2,3);8,103(3,7);8,082(2,0);7,907(2,6);7,888(4,0);7,869(2,2);7,800(1,0);7,632(1,0);4,342(2,2);4,324(7,0);4,305(7,1);4,287(2,3);3,319(42,7);2,671(2,2);2,502(366,5);2,329(2,1);1,397(2,2);1,322(7,5);1,304(16,0);1,286(7,5);1,233(0,5);0,000(53,2)
Ví dụ I-16: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,280(4,8);8,483(1,6);8,462(1,8);8,265(1,6);8,244(2,2);8,139(1,0);8,137(1,0);8,119(1,8);8,101(1,0);8,098(0,9);7,952(1,2);7,933(1,8);7,913(1,2);7,906(5,8);7,804(6,0);4,548(0,7);3,935(1,0);3,917(3,4);3,898(3,5);3,880(1,1);3,763(16,0);3,320(48,0);2,675(0,7);2,671(0,9);2,506(120,5);2,502(157,3);2,497(116,2);2,333(0,7);2,328(0,9);2,324(0,7);2,117(2,2);1,304(0,4);1,244(4,1);1,226(8,4);1,207(3,7);1,140(4,9);0,008(0,8);0,000(16,0)
Ví dụ I-17: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,370(8,8);8,513(3,1);8,493(3,3);8,435(5,2);8,339(3,1);8,318(4,0);8,216(3,6);8,194(4,5);8,186(2,1);8,183(2,0);8,169(2,4);8,165(3,2);8,148(1,8);8,144(1,7);8,007(2,1);8,

005(2,2);7,987(6,2);7,967(4,0);4,013(2,0);3,995(6,9);3,976(7,0);3,958(2,2);3,323(27,9);2,677(0,5);2,672(0,6);2,668(0,5);2,508(85,4);2,503(111,3);2,499(81,1);2,334(0,5);2,330(0,6);1,990(0,6);1,397(4,8);1,338(7,3);1,320(16,0);1,301(7,2);1,175(0,3);0,000(2,1)
Ví dụ I-18: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,396(8,7);8,872(5,2);8,868(5,4);8,524(3,1);8,504(3,4);8,460(4,0);8,438(6,5);8,371(3,4);8,367(3,4);8,345(5,2);8,323(4,1);8,198(1,8);8,195(1,8);8,177(3,2);8,159(1,8);8,156(1,9);8,022(2,2);8,002(3,4);7,984(1,8);4,038(0,7);4,021(2,7);4,003(7,1);3,984(6,9);3,965(2,1);3,319(112,3);2,675(1,5);2,671(2,1);2,667(1,6);2,507(270,1);2,502(351,4);2,498(258,1);2,333(1,5);2,329(2,0);1,989(2,5);1,344(7,3);1,325(16,0);1,307(7,2);1,241(1,7);1,193(0,7);1,175(1,4);1,157(0,7);0,146(1,6);0,008(18,0);0,000(369,9);-0,008(19,6);-0,150(1,7)
Ví dụ I-19: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,377(9,2);8,555(6,3);8,517(3,5);8,496(3,7);8,344(5,2);8,336(3,8);8,323(6,5);8,315(5,1);8,189(2,0);8,187(2,0);8,169(3,5);8,151(1,9);8,148(1,9);8,126(3,5);8,105(2,9);8,009(2,4);7,991(3,7);7,973(1,9);4,038(0,8);4,019(2,7);4,001(7,2);3,982(7,2);3,964(2,3);3,320(127,4);2,671(1,9);2,502(328,7);2,498(252,0);2,329(2,0);1,989(2,9);1,341(7,4);1,322(16,0);1,304(7,3);1,193(0,8);1,175(1,6);1,158(0,9);0,146(1,5);0,000(314,0);-0,150(1,5)
Ví dụ I-20: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,347(4,5);8,856(2,4);8,851(2,5);8,671(2,5);8,667(2,4);8,520(1,5);8,501(1,6);8,299(1,5);8,278(2,0);8,172(0,9);8,168(0,9);8,154(1,2);8,151(1,6);8,133(0,9);8,130(0,8);7,990(1,1);7,972(1,7);7,955(0,9);4,418(0,4);3,912(0,9);3,894(3,4);3,876(3,5);3,857(1,2);3,844(16,0);3,320(26,1);2,676(0,6);2,671(0,7);2,667(0,6);2,525(1,9);2,511(47,8);2,507(97,0);2,502(127,6);2,498(91,3);2,494(44,2);2,333(0,5);2,329(0,8);1,264(3,5);1,246(8,1);1,235(2,1);1,227(3,8);0,146(0,6);0,008(4,6);0,000(125,9);-0,008(5,3);-0,150(0,6)
Ví dụ I-21: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,306(4,5);8,500(1,6);8,480(1,7);8,270(1,5);8,249(2,1);8,153(3,5);8,131(1,7);8,113(0,9);8,110(0,8);7,969(1,1);7,967(1,1);7,949(1,7);7,927(2,7);7,906(2,8);7,735(1,6);7,732(1,6);7,714(1,4);7,710(1,4);3,930(0,9);3,911(3,2);3,893(3,3);3,875(1,0);3,803(15,0);3,325(91,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,507(72,7);2,502(93,6);2,498(68,1);2,329(0,5);1,398(16,0);1,253(3,4);1,234(7,8);1,216(3,4);0,146(0,4);0,008(3,7);0,000(79,4);-0,008(3,7);-0,150(0,4)
Ví dụ I-22: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,389(4,7);8,807(6,3);8,542(2,0);8,523(1,9);8,329(1,7);8,308(2,3);8,197(1,2);8,177(1,9);8,159(1,0);8,023(1,4);8,003(2,0);7,983(1,0);5,756(0,5);4,007(16,0);3,833(1,2);3,814(3,6);3,796(3,6);3,778(1,1);3,539(0,4);3,321(145,9);3,256(0,6);2,671(1,6);2,506(238,8);2,502(294,2);2,497(210,6);2,329(1,6);1,264(4,1);1,246(8,7);1,227(4,4);1,207

(0,7);1,189(1,0);1,182(0,4);1,173(0,9);1,155(0,5);0,854(0,3);0,146(0,5);0,000(101,4);-0,149(0,5)
Ví dụ I-23: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,320(5,2);8,508(1,9);8,488(2,1);8,338(3,8);8,276(1,8);8,254(2,5);8,157(1,1);8,138(1,9);8,117(3,4);8,096(3,1);7,976(1,3);7,957(2,0);7,938(1,1);7,921(2,0);7,900(1,7);3,927(1,1);3,908(3,5);3,890(3,6);3,871(1,3);3,844(16,0);3,321(40,5);2,672(0,6);2,502(109,7);2,329(0,6);1,397(4,1);1,257(3,8);1,238(8,3);1,220(3,8);0,000(48,0)
Ví dụ I-24: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,340(4,6);8,561(3,1);8,518(1,7);8,497(1,8);8,285(1,6);8,263(2,2);8,225(2,1);8,203(3,1);8,165(1,0);8,147(1,7);8,124(2,2);8,102(1,2);8,098(1,2);7,987(1,1);7,969(1,8);7,951(0,9);4,056(0,4);4,039(1,1);4,021(1,1);4,003(0,4);3,908(1,1);3,884(16,0);3,871(3,8);3,853(1,1);3,322(25,6);2,672(0,5);2,507(61,5);2,503(79,8);2,498(59,6);2,329(0,4);1,989(4,6);1,397(2,1);1,260(3,5);1,242(7,7);1,224(3,5);1,193(1,3);1,175(2,4);1,158(1,2);0,000(29,1)
Ví dụ I-25: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,896(2,3);8,893(2,3);8,700(2,5);8,697(2,3);8,569(4,0);8,111(1,6);8,096(1,6);8,091(1,8);8,080(1,6);7,835(0,7);7,832(0,7);7,818(1,2);7,814(1,5);7,797(1,1);7,793(1,0);7,769(1,2);7,766(1,2);7,749(1,5);7,732(0,7);3,982(16,0);3,319(54,7);3,159(1,1);3,140(3,5);3,122(3,5);3,104(1,1);2,672(0,5);2,507(51,6);2,503(69,7);2,498(51,9);2,330(0,4);1,397(2,4);1,299(3,8);1,280(8,0);1,262(3,7);0,008(1,8);0,000(40,5);-0,008(1,7)
Ví dụ I-26: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,080(4,2);8,356(1,5);8,337(1,6);8,305(1,5);8,284(1,8);8,203(2,6);8,028(1,9);8,005(3,0);7,987(0,9);7,984(0,9);7,860(1,0);7,857(1,0);7,840(1,7);7,822(0,8);7,820(0,8);7,768(1,4);7,765(1,4);7,746(1,2);7,743(1,2);4,383(16,0);3,643(0,9);3,624(1,0);3,610(1,1);3,591(1,0);3,320(13,3);3,031(1,0);3,013(1,1);2,998(1,0);2,980(1,0);2,676(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,524(1,4);2,511(34,4);2,507(70,4);2,502(92,9);2,498(67,2);2,494(32,9);2,333(0,4);2,329(0,5);2,325(0,4);1,989(0,4);1,313(3,7);1,295(8,0);1,276(3,6);1,231(0,4);0,146(0,5);0,008(3,3);0,000(96,4);-0,008(4,1);-0,150(0,5)
Ví dụ I-27: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,013(3,9);9,008(5,0);8,972(4,4);8,968(3,8);8,555(7,2);8,185(2,9);8,164(3,2);8,100(2,5);8,081(2,8);8,079(2,8);7,850(1,2);7,846(1,4);7,832(2,2);7,829(2,9);7,825(1,5);7,812(2,1);7,808(2,0);7,785(2,1);7,782(2,5);7,765(2,9);7,762(2,4);7,748(1,2);7,745(1,3);3,321(34,2);3,248(1,9);3,230(6,5);3,212(6,6);3,193(2,1);3,078(1,1);2,677(0,5);2,672(0,8);2,668(0,6);2,525(1,7);2,521(2,6);2,512(43,1);2,508(92,6);2,503(125,7);2,499(91,2);2,494(44,3);2,334(0,5);2,330(0,7);2,325(0,5);1,402(7,3);1,384(16,0);1,365(7,1);1,350(0,4);0,008(0,3);0,000(11,2);-0,008(0,4)
Ví dụ I-28: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,097(9,4);9,036(4,7);9,032(5,7);8,994(5,2);8,411(3,4);8,388(5,7);8,365(4,1);8,073(

1,8);8,054(3,2);8,036(1,9);7,922(2,4);7,903(3,4);7,884(1,8);3,555(0,5);3,536(1,8);3,518(2,1);3,502(2,3);3,484(2,1);3,465(0,6);3,319(76,6);3,020(0,6);3,001(2,1);2,983(2,3);2,968(2,2);2,949(1,9);2,931(0,6);2,671(2,4);2,506(320,5);2,502(411,7);2,498(298,4);2,328(2,4);1,989(0,5);1,397(0,8);1,263(7,5);1,245(16,0);1,226(7,3);1,175(0,4);0,000(4,5)

Ví dụ I-29:

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

8,537(7,6);8,408(4,8);8,405(4,9);8,154(3,2);8,142(5,2);8,133(3,7);8,120(6,0);8,092(2,8);8,073(3,1);7,915(3,1);7,911(3,1);7,894(2,6);7,890(2,6);7,834(1,3);7,830(1,5);7,817(2,5);7,813(3,0);7,796(2,2);7,792(2,0);7,769(2,3);7,767(2,4);7,749(3,1);7,732(1,3);7,729(1,3);3,321(49,4);3,236(2,0);3,218(6,7);3,199(6,8);3,181(2,2);2,676(1,0);2,672(1,3);2,667(1,0);2,525(2,9);2,507(128,8);2,503(169,0);2,498(122,4);2,334(1,0);2,329(1,3);2,325(1,0);1,393(7,8);1,375(16,0);1,357(7,2);0,000(4,8)

Ví dụ I-30:

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,068(8,7);8,425(5,6);8,421(5,7);8,393(3,1);8,374(3,3);8,345(3,4);8,324(3,8);8,185(5,1);8,164(6,0);8,053(1,8);8,032(3,2);8,014(1,8);8,011(1,9);7,936(3,3);7,932(3,0);7,915(2,7);7,911(2,6);7,900(2,2);7,880(3,3);7,862(1,8);3,578(0,5);3,559(1,9);3,540(2,1);3,525(2,3);3,506(2,0);3,487(0,7);3,318(145,3);3,027(0,7);3,008(2,2);2,990(2,3);2,975(2,3);2,956(1,9);2,938(0,6);2,675(3,6);2,670(4,9);2,666(3,6);2,608(0,5);2,524(13,1);2,506(637,5);2,502(820,8);2,497(582,4);2,333(3,4);2,328(4,6);2,324(3,5);1,988(0,4);1,398(3,3);1,266(7,4);1,248(16,0);1,229(7,3);1,167(0,3);0,146(2,5);0,008(20,7);0,000(548,6);-0,008(20,5);-0,149(2,3)

Ví dụ I-31:

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

13,309(3,9);8,373(8,3);8,084(3,5);8,063(4,0);8,032(3,2);8,012(3,5);7,844(2,7);7,784(1,7);7,781(1,8);7,764(3,3);7,747(2,1);7,743(2,0);7,680(2,4);7,661(3,4);7,643(1,6);7,558(2,7);3,321(90,4);3,172(2,1);3,153(6,8);3,135(7,0);3,117(2,2);2,675(1,5);2,671(2,0);2,666(1,5);2,524(4,7);2,506(259,4);2,502(340,0);2,498(245,8);2,333(1,5);2,329(2,0);2,324(1,5);1,404(7,5);1,386(16,0);1,368(7,2);1,312(0,3);0,146(0,7);0,008(5,3);0,000(154,9);-0,008(6,2);-0,150(0,7)

Ví dụ I-32:

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

8,541(8,1);8,431(5,4);8,196(3,8);8,174(4,6);8,158(3,4);8,137(3,7);8,094(3,0);8,075(3,3);7,946(3,0);7,943(3,0);7,925(2,6);7,921(2,6);7,836(1,4);7,833(1,5);7,819(2,6);7,816(3,1);7,798(2,3);7,795(2,1);7,771(2,4);7,769(2,5);7,751(3,3);7,734(1,4);3,322(44,3);3,237(2,1);3,218(7,0);3,200(7,1);3,182(2,3);2,677(0,8);2,672(1,0);2,668(0,8);2,508(124,2);2,503(160,8);2,499(118,4);2,330(0,9);2,325(0,7);1,393(7,7);1,374(16,0);1,356(7,3);0,000(17,4)

Ví dụ I-33:

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,073(6,9);8,444(4,4);8,394(2,6);8,374(2,8);8,345(2,7);8,323(3,1);8,238(2,9);8,216(3,4);8,051(1,4);8,033(2,4);8,013(1,5);7,964(2,4);7,942(2,1);7,900(1,8);7,881(2,6);7,862(1,4);3,575(0,4);3,557(1,3);3,538(1,6);3,523(1,6);3,504(1,5);3,486(0,5);3,321(52,3);3,303(2,1);3,285(2,1);3,267(2,1);3,250(2,1);3,233(2,1);3,216(2,1);3,199(2,1);3,182(2,1);3,165(2,1);3,148(2,1);3,131(2,1);3,114(2,1);3,097(2,1);3,080(2,1);3,063(2,1);3,046(2,1);3,029(2,1);3,012(2,1);2,995(2,1);2,978(2,1);2,961(2,1);2,944(2,1);2,927(2,1);2,910(2,1);2,893(2,1);2,876(2,1);2,859(2,1);2,842(2,1);2,825(2,1);2,808(2,1);2,791(2,1);2,774(2,1);2,757(2,1);2,740(2,1);2,723(2,1);2,706(2,1);2,689(2,1);2,672(2,1);2,655(2,1);2,638(2,1);2,621(2,1);2,604(2,1);2,587(2,1);2,570(2,1);2,553(2,1);2,536(2,1);2,519(2,1);2,502(2,1);2,485(2,1);2,468(2,1);2,451(2,1);2,434(2,1);2,417(2,1);2,400(2,1);2,383(2,1);2,366(2,1);2,349(2,1);2,332(2,1);2,315(2,1);2,298(2,1);2,281(2,1);2,264(2,1);2,247(2,1);2,230(2,1);2,213(2,1);2,196(2,1);2,179(2,1);2,162(2,1);2,145(2,1);2,128(2,1);2,111(2,1);2,094(2,1);2,077(2,1);2,060(2,1);2,043(2,1);2,026(2,1);2,009(2,1);1,992(2,1);1,975(2,1);1,958(2,1);1,941(2,1);1,924(2,1);1,907(2,1);1,890(2,1);1,873(2,1);1,856(2,1);1,839(2,1);1,822(2,1);1,805(2,1);1,788(2,1);1,771(2,1);1,754(2,1);1,737(2,1);1,720(2,1);1,703(2,1);1,686(2,1);1,669(2,1);1,652(2,1);1,635(2,1);1,618(2,1);1,601(2,1);1,584(2,1);1,567(2,1);1,550(2,1);1,533(2,1);1,516(2,1);1,499(2,1);1,482(2,1);1,465(2,1);1,448(2,1);1,431(2,1);1,414(2,1);1,397(2,1);1,380(2,1);1,363(2,1);1,346(2,1);1,329(2,1);1,312(2,1);1,295(2,1);1,278(2,1);1,261(2,1);1,244(2,1);1,227(2,1);1,210(2,1);1,193(2,1);1,176(2,1);1,159(2,1);1,142(2,1);1,125(2,1);1,108(2,1);1,091(2,1);1,074(2,1);1,057(2,1);1,040(2,1);1,023(2,1);1,006(2,1);989(2,1);972(2,1);955(2,1);938(2,1);921(2,1);904(2,1);887(2,1);870(2,1);853(2,1);836(2,1);819(2,1);802(2,1);785(2,1);768(2,1);751(2,1);734(2,1);717(2,1);700(2,1);683(2,1);666(2,1);649(2,1);632(2,1);615(2,1);598(2,1);581(2,1);564(2,1);547(2,1);530(2,1);513(2,1);496(2,1);479(2,1);462(2,1);445(2,1);428(2,1);411(2,1);394(2,1);377(2,1);360(2,1);343(2,1);326(2,1);309(2,1);292(2,1);275(2,1);258(2,1);241(2,1);224(2,1);207(2,1);190(2,1);173(2,1);156(2,1);139(2,1);122(2,1);105(2,1);88(2,1);71(2,1);54(2,1);37(2,1);20(2,1);3(2,1);-14(2,1);-31(2,1);-48(2,1);-65(2,1);-82(2,1);-99(2,1);-116(2,1);-133(2,1);-150(2,1);-167(2,1);-184(2,1);-201(2,1);-218(2,1);-235(2,1);-252(2,1);-269(2,1);-286(2,1);-303(2,1);-320(2,1);-337(2,1);-354(2,1);-371(2,1);-388(2,1);-405(2,1);-422(2,1);-439(2,1);-456(2,1);-473(2,1);-490(2,1);-507(2,1);-524(2,1);-541(2,1);-558(2,1);-575(2,1);-592(2,1);-609(2,1);-626(2,1);-643(2,1);-660(2,1);-677(2,1);-694(2,1);-711(2,1);-728(2,1);-745(2,1);-762(2,1);-779(2,1);-796(2,1);-813(2,1);-830(2,1);-847(2,1);-864(2,1);-881(2,1);-898(2,1);-915(2,1);-932(2,1);-949(2,1);-966(2,1);-983(2,1);-1000(2,1);-1017(2,1);-1034(2,1);-1051(2,1);-1068(2,1);-1085(2,1);-1102(2,1);-1119(2,1);-1136(2,1);-1153(2,1);-1170(2,1);-1187(2,1);-1204(2,1);-1221(2,1);-1238(2,1);-1255(2,1);-1272(2,1);-1289(2,1);-1306(2,1);-1323(2,1);-1340(2,1);-1357(2,1);-1374(2,1);-1391(2,1);-1408(2,1);-1425(2,1);-1442(2,1);-1459(2,1);-1476(2,1);-1493(2,1);-1510(2,1);-1527(2,1);-1544(2,1);-1561(2,1);-1578(2,1);-1595(2,1);-1612(2,1);-1629(2,1);-1646(2,1);-1663(2,1);-1680(2,1);-1697(2,1);-1714(2,1);-1731(2,1);-1748(2,1);-1765(2,1);-1782(2,1);-1799(2,1);-1816(2,1);-1833(2,1);-1850(2,1);-1867(2,1);-1884(2,1);-1901(2,1);-1918(2,1);-1935(2,1);-1952(2,1);-1969(2,1);-1986(2,1);-2003(2,1);-2020(2,1);-2037(2,1);-2054(2,1);-2071(2,1);-2088(2,1);-2105(2,1);-2122(2,1);-2139(2,1);-2156(2,1);-2173(2,1);-2190(2,1);-2207(2,1);-2224(2,1);-2241(2,1);-2258(2,1);-2275(2,1);-2292(2,1);-2309(2,1);-2326(2,1);-2343(2,1);-2360(2,1);-2377(2,1);-2394(2,1);-2411(2,1);-2428(2,1);-2445(2,1);-2462(2,1);-2479(2,1);-2496(2,1);-2513(2,1);-2530(2,1);-2547(2,1);-2564(2,1);-2581(2,1);-2598(2,1);-2615(2,1);-2632(2,1);-2649(2,1);-2666(2,1);-2683(2,1);-2700(2,1);-2717(2,1);-2734(2,1);-2751(2,1);-2768(2,1);-2785(2,1);-2802(2,1);-2819(2,1);-2836(2,1);-2853(2,1);-2870(2,1);-2887(2,1);-2904(2,1);-2921(2,1);-2938(2,1);-2955(2,1);-2972(2,1);-2989(2,1);-3006(2,1);-3023(2,1);-3040(2,1);-3057(2,1);-3074(2,1);-3091(2,1);-3108(2,1);-3125(2,1);-3142(2,1);-3159(2,1);-3176(2,1);-3193(2,1);-3210(2,1);-3227(2,1);-3244(2,1);-3261(2,1);-3278(2,1);-3295(2,1);-3312(2,1);-3329(2,1);-3346(2,1);-3363(2,1);-3380(2,1);-3397(2,1);-3414(2,1);-3431(2,1);-3448(2,1);-3465(2,1);-3482(2,1);-3499(2,1);-3516(2,1);-3533(2,1);-3550(2,1);-3567(2,1);-3584(2,1);-3601(2,1);-3618(2,1);-3635(2,1);-3652(2,1);-3669(2,1);-3686(2,1);-3703(2,1);-3720(2,1);-3737(2,1);-3754(2,1);-3771(2,1);-3788(2,1);-3805(2,1);-3822(2,1);-3839(2,1);-3856(2,1);-3873(2,1);-3890(2,1);-3907(2,1);-3924(2,1);-3941(2,1);-3958(2,1);-3975(2,1);-3992(2,1);-4009(2,1);-4026(2,1);-4043(2,1);-4060(2,1);-4077(2,1);-4094(2,1);-4111(2,1);-4128(2,1);-4145(2,1);-4162(2,1);-4179(2,1);-4196(2,1);-4213(2,1);-4230(2,1);-4247(2,1);-4264(2,1);-4281(2,1);-4298(2,1);-4315(2,1);-4332(2,1);-4349(2,1);-4366(2,1);-4383(2,1);-4400(2,1);-4417(2,1);-4434(2,1);-4451(2,1);-4468(2,1);-4485(2,1);-4502(2,1);-4519(2,1);-4536(2,1);-4553(2,1);-4570(2,1);-4587(2,1);-4604(2,1);-4621(2,1);-4638(2,1);-4655(2,1);-4672(2,1);-4689(2,1);-4706(2,1);-4723(2,1);-4740(2,1);-4757(2,1);-4774(2,1);-4791(2,1);-4808(2,1);-4825(2,1);-4842(2,1);-4859(2,1);-4876(2,1);-4893(2,1);-4910(2,1);-4927(2,1);-4944(2,1);-4961(2,1);-4978(2,1);-4995(2,1);-5012(2,1);-5029(2,1);-5046(2,1);-5063(2,1);-5080(2,1);-5097(2,1);-5114(2,1);-5131(2,1);-5148(2,1);-5165(2,1);-5182(2,1);-5199(2,1);-5216(2,1);-5233(2,1);-5250(2,1);-5267(2,1);-5284(2,1);-5301(2,1);-5318(2,1);-5335(2,1);-5352(2,1);-5369(2,1);-5386(2,1);-5403(2,1);-5420(2,1);-5437(2,1);-5454(2,1);-5471(2,1);-5488(2,1);-5505(2,1);-5522(2,1);-5539(2,1);-5556(2,1);-5573(2,1);-5590(2,1);-5607(2,1);-5624(2,1);-5641(2,1);-5658(2,1);-5675(2,1);-5692(2,1);-5709(2,1);-5726(2,1);-5743(2,1);-5760(2,1);-5777(2,1);-5794(2,1);-5811(2,1);-5828(2,1);-5845(2,1);-5862(2,1);-5879(2,1);-5896(2,1);-5913(2,1);-5930(2,1);-5947(2,1);-5964(2,1);-5981(2,1);-5998(2,1);-6015(2,1);-6032(2,1);-6049(2,1);-6066(2,1);-6083(2,1);-6100(2,1);-6117(2,1);-6134(2,1);-6151(2,1);-6168(2,1);-6185(2,1);-6202(2,1);-6219(2,1);-6236(2,1);-6253(2,1);-6270(2,1);-6287(2,1);-6304(2,1);-6321(2,1);-6338(2,1);-6355(2,1);-6372(2,1);-6389(2,1);-6406(2,1);-6423(2,1);-6440(2,1);-6457(2,1);-6474(2,1);-6491(2,1);-6508(2,1);-6525(2,1);-6542(2,1);-6559(2,1);-6576(2,1);-6593(2,1);-6610(2,1);-6627(2,1);-6644(2,1);-6661(2,1);-6678(2,1);-6695(2,1);-6712(2,1);-6729(2,1);-6746(2,1);-6763(2,1);-6780(2,1);-6797(2,1);-6814(2,1);-6831(2,1);-6848(2,1);-6865(2,1);-6882(2,1);-6899(2,1);-6916(2,1);-6933(2,1);-6950(2,1);-6967(2,1);-6984(2,1);-7001(2,1);-7018(2,1);-7035(2,1);-7052(2,1);-7069(2,1);-7086(2,1);-7103(2,1);-7120(2,1);-7137(2,1);-7154(2,1);-7171(2,1);-7188(2,1);-7205(2,1);-7222(2,1);-7239(2,1);-7256(2,1);-7273(2,1);-7290(2,1);-7307(2,1);-7324(2,1);-7341(2,1);-7358(2,1);-7375(2,1);-7392(2,1);-7409(2,1);-7426(2,1);-7443(2,1);-7460(2,1);-7477(2,1);-7494(2,1);-7511(2,1);-7528(2,1);-7545(2,1);-7562(2,1);-7579(2,1);-7596(2,1);-7613(2,1);-7630(2,1);-7647(2,1);-7664(2,1);-7681(2,1);-7698(2,1);-7715(2,1);-7732(2,1);-7749(2,1);-7766(2,1);-7783(2,1);-7800(2,1);-7817(2,1);-7834(2,1);-7851(2,1);-7868(2,1);-7885(2,1);-7902(2,1);-7919(2,1);-7936(2,1);-7953(2,1);-7970(2,1);-7987(2,1);-8004(2,1);-8021(2,1);-8038(2,1);-8055(2,1);-8072(2,1);-8089(2,1);-8106(2,1);-8123(2,1);-8140(2,1);-8157(2,1);-8174(2,1);-8191(2,1);-8208(2,1);-8225(2,1);-8242(2,1);-8259(2,1);-8276(2,1);-8293(2,1);-8310(2,1);-8327(2,1);-8344(2,1);-8361(2,1);-8378(2,1);-8395(2,1);-8412(2,1);-8429(2,1);-8446(2,1);-8463(2,1);-8480(2,1);-8497(2,1);-8514(2,1);-8531(2,1);-8548(2,1);-8565(2,1);-8582(2,1);-8599(2,1);-8616(2,1);-8633(2,1);-8650(2,1);-8667(2,1);-8684(2,1);-8701(2,1);-8718(2,1);-8735(2,1);-8752(2,1);-8769(2,1);-8786(2,1);-8803(2,1);-8820(2,1);-8837(2,1);-8854(2,1);-8871(2,1);-8888(2,1);-8905(2,1);-8922(2,1);-8939(2,1);-8956(2,1);-8973(2,1);-8990(2,1);-9007(2,1);-9024(2,1);-9041(2,1);-9058(2,1);-9075(2,1);-9092(2,1);-9109(2,1);-9126(2,1);-9143(2,1);-9160(2,1);-9177(2,1);-9194(2,1);-9211(2,1);-9228(2,1);-9245(2,1);-9262(2,1);-9279(2,1);-9296(2,1);-9313(2,1);-9330(2,1);-9347(2,1);-9364(2,1);-9381(2,1);-9398(2,1);-9415(2,1);-9432(2,1);-9449(2,1);-9466(2,1);-9483(2,1);-9500(2,1);-9517(2,1);-9534(2,1);-9551(2,1);-9568(2,1);-9585(2,1);-9602(2,1);-9619(2,1);-9636(2,1);-9653(2,1);-9670(2,1);-9687(2,1);-9704(2,1);-9721(2,1);-9738(2,1);-9755(2,1);-9772(2,1);-9789(2,1);-9806(2,1);-9823(2,1);-9840(2,1);-9857(2,1);-9874(2,1);-9891(2,1);-9908(2,1);-9925(2,1);-9942(2,1);-9959(2,1);-9976(2,1);-9993(2,1);-10010(2,1);-10027(2,1);-10044(2,1);-10061(2,1);-10078(2,1);-10095(2,1);-10112(2,1);-10129(2,1);-10146(2,1);-10163(2,1);-10180(2,1);-10197(2,1);-10214(2,1);-10231(2,1);-10248(2,1);-10265(2,1);-10282(2,1);-10299(2,1);-10316(2,1);-10333(2,1);-10350(2,1);-10367(2,1);-10384(2,1);-10401(2,1);-10418(2,1);-10435(2,1);-10452(2,1);-10469(2,1);-10486(2,1);-10503(2,1);-10520(2,1);-10537(2,1);-10554(2,1);-10571(2,1);-10588(2,1);-10605(2,1);-10622(2,1);-10639(2,1);-10656(2,1);-10673(2,1);-10690(2,1);-10707(2,1);-10724(2,1);-10741(2,1);-10758(2,1);-10775(2,1);-10792(2,1);-10809(2,1);-10826(2,1);-10843(2,1);-10860(2,1);-10877(2,1);-10894(2,1);-10911(2,1);-10928(2,1);-10945(2,1);-10962(2,1);-10979(2,1);-10996(2,1);-11013(2,1);-11030(2,1);-11047(2,1);-11064(2,1);-11081(2,1);-11098(2,1);-11115(2,1);-11132(2,1);-11149(2,1);-11166(2,1);-11183(2,1);-11200(2,1);-11217(2,1);-11234(2,1);-11251(2,1);-11268(2,1);-11285(2,1);-11302(2,1);-11319(2,1);-11336(2,1);-11353(2,1);-11370(2,1);-11387(2,1);-11404(2,1);-11421(2,1);-11438(2,1);-11455(2,1);-11472(2,1);-11489(2,1);-11506(2,1);-11523(2,1);-11540(2,1);-11557(2,1);-11574(2,1);-11591(2,1);-11608(2,1);-11625(2,1);-11642(2,1);-11659(2,1);-11676(2,1);-11693(2,1);-11710(2,1);-11727(2,1);-11744(2,1);-11761(2,1);-11778(2,1);-11795(2,1);-11812(2,1);-11829(2,1);-11846(2,1);-11863(2,1);-11880(2,1);-11897(2,1);-11914(2,1);-11931(2,1);-11948(2,1);-11965(2,1);-11982(2,1);-12000(2,1);-12017(2,1);-12034(2,1);-12051(2,1);-12068(2,1);-12085(2,1);-12102(2,1);-12119(2,1);-12136(2,1);-12153(2,1);-12170(2,1);-12187(2,1);-12204(2,1);-12221(2,1);-12238(2,1);-12255(2,1);-12272(2,1);-12289(2,1);-12306(2,1);-12323(2,1);-12340(2,1);-12357(2,1);-12374(2,1);-12391(2,1);-12408(2,1);-12425(2,1);-12442(2,1);-12459(

,8);3,021(0,4);3,003(1,5);2,984(1,8);2,969(1,6);2,951(1,4);2,933(0,4);2,671(1,0);2,502(172,9);2,329(1,0);1,397(16,0);1,276(5,4);1,258(11,4);1,240(5,3);0,000(2,6)
Ví dụ I-34: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,526(4,4);8,316(0,4);8,159(3,3);8,081(2,7);8,060(3,1);7,900(2,4);7,878(2,9);7,815(0,8);7,796(1,6);7,778(1,2);7,750(1,4);7,729(1,8);7,713(2,5);7,693(1,5);3,906(16,0);3,322(207,8);3,143(1,2);3,125(3,8);3,107(3,9);3,088(1,3);2,671(1,8);2,506(247,9);2,502(313,4);2,498(227,1);2,328(1,7);2,074(0,6);1,292(4,1);1,274(8,7);1,255(3,9);0,146(1,2);0,008(12,9);0,000(260,3);-0,149(1,2)
Ví dụ I-35: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,317(3,9);8,590(4,2);8,348(4,0);8,346(4,1);8,109(3,0);8,086(3,7);7,842(0,7);7,839(0,7);7,825(1,3);7,822(1,4);7,804(1,0);7,801(1,1);7,779(1,2);7,776(1,2);7,758(1,4);7,741(0,6);7,739(0,7);4,032(16,0);3,157(1,1);3,138(3,7);3,120(3,8);3,102(1,2);2,513(14,0);2,509(28,3);2,504(37,2);2,500(27,4);1,396(8,0);1,288(4,1);1,269(8,7);1,251(4,0);1,197(0,4);0,000(3,6)
Ví dụ I-36: $^1\text{H-NMR}$(600.1 MHz, CD_3CN): δ= 11,745(0,5);8,966(6,6);8,206(2,5);8,192(2,7);8,191(2,7);8,163(2,3);8,161(2,3);8,149(2,4);8,148(2,5);7,936(1,6);7,934(1,5);7,925(1,9);7,922(2,9);7,920(1,5);7,911(1,6);7,908(1,5);7,755(1,7);7,753(1,7);7,743(1,8);7,741(3,0);7,739(1,8);7,730(1,5);7,728(1,4);7,579(1,4);7,483(1,4);3,575(0,6);3,562(1,8);3,552(0,8);3,550(2,0);3,540(2,1);3,538(0,8);3,528(2,0);3,515(0,6);2,984(0,6);2,971(2,0);2,959(2,2);2,949(2,0);2,947(0,9);2,937(1,9);2,925(0,6);2,130(50,4);2,058(0,4);2,054(0,6);2,050(0,9);2,046(0,6);1,964(3,8);1,956(6,9);1,951(8,6);1,948(62,4);1,943(113,2);1,939(164,6);1,935(112,0);1,931(56,5);1,922(1,1);1,833(0,4);1,828(0,7);1,824(0,9);1,820(0,6);1,816(0,3);1,451(0,4);1,340(0,7);1,320(7,8);1,308(16,0);1,296(7,6);1,285(1,1);1,268(1,8);0,881(0,4);0,005(0,5);0,000(16,1);-0,006(0,6)
Ví dụ I-37: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,829(2,3);8,824(2,4);8,659(2,4);8,655(2,3);8,574(4,0);8,110(1,6);8,102(1,4);8,089(1,8);8,082(1,6);7,836(0,7);7,833(0,7);7,819(1,2);7,815(1,5);7,798(1,0);7,794(1,0);7,772(1,1);7,768(1,2);7,751(1,5);7,734(0,7);7,731(0,6);3,989(16,0);3,328(1,2);3,164(1,1);3,146(3,6);3,127(3,7);3,109(1,2);2,673(0,4);2,526(0,9);2,512(23,0);2,508(47,2);2,504(62,5);2,499(44,6);2,495(21,3);2,330(0,3);1,301(3,9);1,283(8,3);1,265(3,8);1,232(1,7);0,008(0,4);0,000(12,0);-0,009(0,4)
Ví dụ I-38: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,618(2,6);8,553(4,3);8,428(2,5);8,100(2,0);8,090(1,9);8,079(2,3);8,074(2,1);7,825(0,9);7,807(1,6);7,790(1,2);7,786(1,1);7,760(1,3);7,742(1,7);7,724(0,8);3,951(16,0);3,814(0,5);3,323(100,5);3,156(1,2);3,137(3,7);3,119(3,8);3,100(1,3);2,671(1,3);2,506(182,8);2,502(229,6);2,498(173,1);2,329(1,2);1,299(4,0);1,281(8,3);1,263(4,1);1,235(3,3);0,854(0,3);0,146(0,8);0,000(148,6);-0,149(0,7)
Ví dụ I-39:

¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,532(4,8);8,427(0,4);8,150(3,6);8,089(4,0);8,068(4,4);7,958(2,1);7,936(2,5);7,819(0,9);7,802(1,9);7,782(1,4);7,753(1,6);7,733(4,3);7,713(2,5);3,923(16,0);3,325(15,4);3,140(1,2);3,122(3,9);3,104(4,0);3,085(1,4);2,805(0,6);2,794(0,6);2,671(0,5);2,502(80,3);2,329(0,5);1,397(1,5);1,347(0,4);1,329(0,7);1,311(0,4);1,288(4,2);1,269(8,6);1,251(4,0);0,000(9,9)
Ví dụ I-40: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9,101(3,4);8,922(2,5);8,916(2,5);8,287(4,5);8,180(3,7);8,153(2,5);8,147(2,4);4,062(16,0);3,219(1,2);3,201(3,7);3,183(3,8);3,164(1,3);3,131(1,1);3,112(3,5);3,094(3,5);3,076(1,2);2,131(29,4);2,129(37,1);2,113(0,7);2,107(0,7);2,100(0,5);1,971(1,0);1,963(2,8);1,952(40,0);1,945(73,2);1,939(97,8);1,933(67,1);1,927(34,0);1,774(0,4);1,768(0,6);1,762(0,4);1,438(4,0);1,420(8,0);1,401(3,9);1,361(3,9);1,342(7,9);1,324(3,7);1,204(0,4);0,000(1,5)
Ví dụ I-41: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9,656(2,7);9,649(2,7);9,429(5,4);9,267(2,9);9,261(2,6);9,155(3,5);8,217(3,8);4,068(0,4);4,050(0,4);4,000(16,0);3,944(1,2);3,926(3,8);3,907(3,8);3,889(1,2);3,440(1,1);3,422(3,6);3,403(3,7);3,385(1,2);2,463(0,6);2,249(0,4);2,230(0,4);2,144(556,5);2,119(2,0);2,113(2,2);2,107(2,5);2,101(1,7);2,095(0,9);1,971(2,3);1,964(9,6);1,952(134,3);1,946(247,3);1,940(334,2);1,933(228,1);1,927(116,0);1,780(0,7);1,774(1,4);1,768(1,8);1,762(1,3);1,756(0,6);1,351(3,8);1,333(7,7);1,313(5,9);1,293(7,9);1,286(1,6);1,275(5,1);1,222(0,4);1,203(0,7);1,186(0,4);0,908(0,5);0,881(0,4);0,000(25,0)
Ví dụ I'-42: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,531(4,5);9,255(3,9);8,638(1,7);8,616(1,8);8,391(1,6);8,371(1,8);8,285(4,2);8,104(0,8);8,102(0,9);8,084(1,6);8,066(1,0);8,063(1,0);7,960(1,2);7,942(1,7);7,922(0,9);3,860(16,0);3,386(0,9);3,319(36,4);2,854(1,3);2,835(4,1);2,817(4,2);2,798(1,4);2,672(0,4);2,525(0,8);2,512(19,0);2,507(40,4);2,503(57,2);2,498(44,0);2,494(22,1);2,330(0,3);1,236(0,4);1,001(4,4);0,983(9,2);0,964(4,3);0,008(1,7);0,000(51,1);-0,008(2,1)
Ví dụ I'-43: ¹ H-NMR(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 9,131(1,1);9,111(1,2);9,108(1,1);9,064(2,8);9,052(0,4);9,013(0,6);8,871(1,0);8,868(1,2);8,850(1,1);8,848(1,1);8,184(0,4);8,180(0,5);8,166(1,1);8,163(1,1);8,146(1,2);8,137(4,0);8,124(0,6);8,120(1,1);8,116(1,1);8,103(0,6);8,099(0,4);7,264(22,4);5,301(3,3);4,373(0,4);4,339(0,5);4,008(13,2);3,989(2,7);3,913(0,4);3,900(0,7);3,882(2,3);3,863(2,3);3,844(0,8);3,778(0,4);3,760(0,4);3,416(0,4);1,619(16,0);1,501(3,0);1,492(0,8);1,482(6,3);1,473(1,5);1,463(3,0);1,454(0,7);1,256(0,9);0,070(1,9);0,000(3,1)
Ví dụ I'-44: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,805(5,2);9,277(4,7);8,954(2,1);8,933(2,2);8,518(1,9);8,498(2,1);8,248(5,0);8,194(0,9);8,176(1,7);8,156(1,1);8,060(1,5);8,041(2,0);8,022(1,1);5,755(0,6);3,886(16,0);3,785(1,4);3,766(1,4);3,320(25,3);2,672(0,4);2,507(44,1);2,503(58,0);2,500(45,6);2,330(0,4);1,280(4,0);1,261(8,3);1,243(3,8);0,001(13,6);0,000(14,1)

Ví dụ I'-45:

$^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

9,884(6,3);9,464(1,7);9,458(1,8);9,450(1,8);9,444(1,7);8,955(1,5);8,949(1,6);8,927(1,7);8,921(1,6);8,858(2,4);8,854(2,4);8,606(2,5);8,601(2,4);8,083(1,7);8,069(1,6);8,055(1,6);8,041(1,6);7,906(0,4);7,899(0,4);7,546(0,4);5,756(0,9);3,977(1,0);3,952(3,2);3,927(3,3);3,902(1,0);3,745(16,0);3,316(7,7);2,514(4,6);2,509(8,9);2,503(11,6);2,497(8,0);1,235(0,8);1,182(3,7);1,158(8,1);1,133(3,5);0,000(5,7)

Ví dụ I-46:

$^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

10,312(1,0);9,681(6,0);8,972(0,9);8,800(9,0);8,368(11,7);8,164(0,4);8,143(0,4);8,075(0,5);8,055(0,5);8,019(3,2);8,003(3,3);7,999(3,8);7,987(3,3);7,811(0,3);7,793(0,5);7,748(1,6);7,745(1,6);7,731(2,4);7,728(3,0);7,710(2,0);7,707(1,8);7,655(2,3);7,652(2,2);7,635(3,2);7,617(1,7);7,084(1,3);5,758(1,2);3,322(39,8);3,157(2,1);3,139(6,9);3,120(7,0);3,102(2,3);2,676(0,7);2,672(1,0);2,668(0,8);2,525(2,2);2,507(132,8);2,503(172,9);2,498(123,6);2,334(0,8);2,329(1,0);2,325(0,8);1,990(0,9);1,398(1,7);1,360(0,5);1,352(0,8);1,340(7,8);1,321(16,0);1,303(7,5);1,274(0,3);1,259(1,2);1,250(0,7);1,232(1,8);1,193(0,5);1,175(0,9);1,158(0,5);0,853(0,5);0,842(0,3);0,835(0,4);0,147(0,4);0,008(2,7);0,000(87,3);-0,007(3,3);-0,008(3,3);-0,149(0,4)

Ví dụ I'-47:

$^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

9,806(4,4);8,956(1,8);8,934(1,9);8,873(2,7);8,611(2,7);8,515(1,7);8,495(1,8);8,192(0,9);8,174(1,5);8,155(1,0);8,153(1,1);8,057(1,3);8,038(1,8);8,019(0,9);4,038(0,3);3,828(0,7);3,808(1,9);3,783(16,0);3,752(0,5);3,701(0,9);3,645(0,4);3,626(0,4);3,323(184,7);2,671(1,2);2,506(162,5);2,502(211,5);2,498(167,4);2,329(1,2);1,988(1,4);1,398(0,6);1,339(0,4);1,321(0,9);1,292(4,0);1,273(8,1);1,255(4,0);1,235(1,6);1,220(0,9);1,207(0,4);1,201(0,5);1,192(0,5);1,175(0,8);1,157(0,4);0,981(0,4);0,146(0,9);-0,001(180,5);-0,150(0,9)

Ví dụ I'-48:

$^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

9,809(4,1);9,654(0,3);8,956(1,7);8,934(1,8);8,808(2,5);8,804(2,5);8,571(2,6);8,567(2,5);8,517(1,6);8,497(1,7);8,195(0,8);8,177(1,4);8,158(1,0);8,061(1,2);8,041(1,8);8,023(0,9);4,045(1,1);3,825(0,7);3,806(1,9);3,788(16,0);3,369(11,9);2,671(1,1);2,506(157,0);2,502(197,3);2,498(147,4);2,329(1,2);1,989(0,4);1,453(0,6);1,398(1,1);1,290(3,5);1,271(7,5);1,253(3,6);1,236(2,1);0,146(0,5);0,008(6,4);0,000(105,6);-0,149(0,5)

Ví dụ I'-49:

$^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

9,806(4,7);9,299(4,4);8,951(1,9);8,929(2,1);8,517(1,7);8,498(1,9);8,272(4,6);8,196(0,9);8,178(1,6);8,157(1,1);8,062(1,4);8,043(1,9);8,024(1,0);4,038(0,4);4,020(0,4);3,884(16,0);3,782(1,3);3,764(1,3);3,335(11,1);2,671(0,9);2,506(123,8);2,502(160,6);2,498(121,6);2,329(0,9);1,989(1,6);1,277(4,1);1,259(8,7);1,240(4,5);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,146(0,4);0,008(4,6);0,000(90,8);-0,150(0,4)

Ví dụ I'-50:

$^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=$

9,654(5,0);9,326(4,5);9,234(1,5);9,213(1,5);8,453(1,7);8,433(1,8);8,323(4,9);8,066(

0,9);8,048(1,7);8,031(1,3);8,027(1,3);7,996(1,5);7,978(1,8);7,959(0,8);4,105(16,0);4,038(0,4);3,884(0,3);3,767(0,7);3,749(0,9);3,735(1,4);3,717(1,3);3,698(0,4);3,684(0,4);3,666(1,3);3,647(1,4);3,634(0,8);3,628(0,5);3,615(0,7);3,323(114,7);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,506(178,7);2,502(236,7);2,497(177,5);2,333(1,0);2,329(1,3);2,324(1,0);1,989(1,5);1,435(3,9);1,416(8,3);1,398(3,9);1,259(0,7);1,234(0,7);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,146(0,6);0,008(6,3);0,000(145,6);-0,008(7,2);-0,150(0,6)
Ví dụ I'-51: ¹H-NMR(400,1 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,990(4,2);9,839(0,4);9,166(1,5);9,144(1,7);9,048(2,3);8,896(2,4);8,893(2,4);8,644(2,5);8,640(2,5);8,450(1,4);8,445(1,3);8,427(1,3);8,422(1,3);4,086(1,3);3,886(0,6);3,867(1,8);3,849(1,8);3,830(0,7);3,803(16,0);3,325(50,7);3,301(0,6);2,511(16,3);2,507(32,4);2,502(42,6);2,498(30,2);1,989(0,3);1,505(0,6);1,310(3,7);1,292(8,1);1,273(3,7);1,234(2,0);0,940(0,3);0,008(1,1);0,000(27,8);-0,008(1,1)
Ví dụ I'-52: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,796(4,4);9,286(4,0);8,949(1,7);8,928(1,9);8,518(1,6);8,497(1,7);8,245(4,3);8,202(0,8);8,199(0,9);8,185(1,1);8,181(1,5);8,163(1,0);8,160(1,0);8,061(1,2);8,043(1,8);8,024(0,9);5,757(7,5);4,122(0,7);4,039(0,3);4,021(0,3);3,924(16,0);3,643(15,0);3,430(0,7);3,327(44,1);2,512(14,8);2,508(29,0);2,503(38,1);2,499(28,3);1,990(1,5);1,193(0,4);1,175(0,8);1,158(0,4);0,008(2,2);0,000(43,4);-0,008(1,8)
Ví dụ I'-53: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,839(4,4);8,941(1,7);8,920(1,9);8,714(6,3);8,549(1,6);8,529(1,7);8,232(0,8);8,229(0,8);8,214(1,1);8,211(1,6);8,193(1,0);8,189(1,0);8,095(1,2);8,075(1,8);8,057(0,9);4,039(0,5);4,021(0,6);4,003(0,4);3,990(16,0);3,639(14,8);3,321(26,3);2,525(0,9);2,511(17,4);2,507(35,5);2,503(48,7);2,498(37,1);1,989(2,2);1,193(0,6);1,175(1,2);1,158(0,6);0,008(2,0);0,000(52,4);-0,008(2,1)
Ví dụ I'-54: ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,847(4,7);8,937(1,8);8,916(2,0);8,717(6,4);8,549(1,7);8,529(1,8);8,226(0,8);8,223(0,9);8,208(1,2);8,205(1,6);8,186(1,0);8,183(1,0);8,091(1,3);8,073(1,9);8,054(0,9);3,952(16,0);3,781(0,7);3,762(1,9);3,744(1,9);3,726(0,7);3,320(59,5);2,675(0,5);2,671(0,6);2,667(0,5);2,506(72,1);2,502(98,9);2,498(76,0);2,333(0,4);2,329(0,6);2,325(0,5);1,989(1,0);1,398(0,9);1,277(3,8);1,259(8,2);1,240(3,8);1,175(0,5);0,146(0,4);0,008(3,6);0,000(90,1);-0,008(4,1);-0,150(0,4)
Ví dụ I-55: ¹H-NMR(600,1 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,449(6,4);9,348(6,1);9,249(9,4);8,769(10,1);8,577(5,6);8,573(5,7);8,217(4,2);8,202(5,2);8,074(3,6);8,070(3,6);8,059(3,0);8,055(3,0);4,175(2,1);4,163(7,0);4,150(7,0);4,138(2,2);4,025(0,3);3,327(87,0);2,617(0,4);2,526(0,8);2,523(1,0);2,520(1,2);2,508(46,7);2,505(63,1);2,502(48,2);2,389(0,4);1,991(1,4);1,397(1,5);1,307(7,4);1,295(16,0);1,282(7,3);1,188(0,4);1,176(0,7);1,165(0,4);0,005(0,5);0,000(11,7)
Ví dụ I-56:

¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,467(6,2);9,350(6,1);9,302(9,1);8,754(10,4);8,480(5,2);8,458(5,7);8,337(0,7);8,315(0,7);8,280(4,9);8,275(5,1);7,918(3,6);7,913(3,5);7,896(3,4);7,891(3,4);7,720(0,3);7,699(0,4);7,355(0,4);7,350(0,4);7,299(0,5);7,283(0,7);7,272(0,4);7,262(0,7);4,180(1,9);4,161(6,7);4,143(6,8);4,124(2,0);4,038(0,4);4,020(0,5);3,318(243,1);2,689(0,4);2,675(2,1);2,671(2,9);2,666(2,2);2,524(9,5);2,510(168,3);2,506(345,7);2,502(476,8);2,497(360,5);2,493(179,4);2,333(2,0);2,328(2,8);2,324(2,0);1,989(2,0);1,649(0,8);1,398(0,7);1,315(7,2);1,296(16,0);1,278(7,0);1,236(0,7);1,193(0,5);1,175(1,0);1,157(0,5);1,105(0,3);0,146(1,9);0,008(15,6);0,000(415,4);-0,008(16,8);-0,150(1,8)
Ví dụ I-57: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,449(6,0);9,345(5,9);9,246(9,0);8,767(10,0);8,418(3,1);8,399(3,2);8,212(3,0);8,190(4,0);8,088(1,9);8,084(2,0);8,071(2,4);8,067(3,3);8,063(1,8);8,049(1,7);8,046(1,7);7,877(2,0);7,874(2,2);7,857(3,5);7,839(1,7);7,837(1,7);4,177(2,0);4,159(6,7);4,140(6,8);4,122(2,0);3,321(82,5);2,676(0,6);2,672(0,8);2,667(0,6);2,525(2,6);2,512(45,0);2,507(93,8);2,503(130,7);2,498(100,0);2,494(50,3);2,334(0,6);2,330(0,8);2,325(0,6);2,075(3,4);1,316(7,1);1,297(16,0);1,279(7,0);1,233(0,5);0,146(0,6);0,008(5,0);0,000(132,8);-0,008(5,6);-0,150(0,6)
Ví dụ I'-58: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,774(4,2);8,964(1,7);8,950(1,8);8,488(1,6);8,475(1,6);8,165(0,8);8,163(0,8);8,153(1,1);8,151(1,6);8,149(1,0);8,139(1,0);8,137(0,9);8,068(2,6);8,027(1,1);8,015(1,8);8,003(0,9);7,937(1,8);7,923(2,0);7,712(1,5);7,710(1,5);7,698(1,3);7,696(1,3);4,036(0,4);4,024(0,4);3,819(0,8);3,780(16,0);3,307(52,0);2,615(0,6);2,612(0,8);2,609(0,6);2,521(1,6);2,518(2,1);2,515(2,4);2,506(49,3);2,503(98,4);2,500(132,6);2,497(99,9);2,495(50,3);2,387(0,6);2,384(0,8);2,381(0,6);1,988(1,7);1,907(1,0);1,287(3,8);1,274(8,1);1,262(3,8);1,235(0,5);1,187(0,5);1,175(0,9);1,163(0,5);0,005(1,4);0,000(33,4);-0,006(1,5)
Ví dụ I-59: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,313(3,6);8,347(3,0);8,331(3,3);8,324(3,9);7,870(1,7);7,865(1,8);7,854(1,6);7,850(1,7);7,741(2,9);7,737(2,7);4,060(15,2);3,968(16,0);3,776(1,1);3,763(3,8);3,751(3,9);3,739(1,2);3,309(240,8);3,281(0,4);2,615(0,8);2,612(1,1);2,609(0,8);2,521(2,2);2,518(2,7);2,515(2,9);2,506(66,9);2,503(136,7);2,500(184,0);2,497(137,4);2,495(66,9);2,388(0,8);2,385(1,1);2,382(0,8);2,072(0,9);1,255(4,1);1,243(8,8);1,230(4,0);0,005(1,4);0,000(37,9);-0,006(1,5)

Các ví dụ ứng dụng

Ctenocephalides felis - thử nghiệm tiếp xúc in vitro với bộ chết mào trưởng thành

Để phủ lên các ống thử nghiệm, 9 mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton tinh khiết (p.a.) và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton tinh khiết. 250 µl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của

ống thử nghiệm 25 ml bằng cách xoay và rung lắc trên máy lắc quỹ đạo (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7cm², có thể đạt được sự phân bố đồng đều xác định, liều lượng dựa vào diện tích 5µg/cm².

Sau khi dung môi đã được làm bay hơi, 5 đến 10 bộ chết mèo trưởng thành (*Ctenocephalides felis*) được đưa vào các ống, đậy kín bằng nắp nhựa có đục lỗ và được ủ ở vị trí nằm ngang ở nhiệt độ phòng và ở độ ẩm môi trường. Hiệu quả được xác định sau thời gian 48 giờ. Về điểm này, các ống thử nghiệm được để thẳng đứng và bộ chết được hạ gục xuống đáy ống. Những bộ chết mà nằm bất động ở đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối được coi là bị chết hoặc gần chết.

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu ít nhất đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm². Hiệu quả 100% có nghĩa là, toàn bộ bộ chết bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là, không có bộ chết nào bị tổn thương.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất dưới đây từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm² (= 500 g/ha): -I-1

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Nhằm mục đích tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 10mg hoạt chất được trộn với 0,5ml dimetyl sulphoxit. Tiến hành pha loãng bằng máu gia súc đã xử lý bằng xitrat để thu được nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 bộ chết mèo chưa được cho ăn (*Ctenocephalogenus felis*) được đặt vào trong một khoang nhỏ mà khoang này được đậy kín ở đỉnh và đáy bằng gạc. Một cột hình trụ bằng kim loại mà đáy của nó được đậy kín bằng màng parafilm được đặt lên trên khoang nêu trên. Cột trụ này chứa máu/chế phẩm chứa hoạt chất, mà có thể được bộ chết hút qua màng parafilm.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là, tất cả số bộ chết đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có bộ chết nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: -I-1

Thử nghiệm với *Lucilia cuprina*

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn với 0,5ml dimetyl sulfoxit, và sản thể đặc này được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 ấu trùng L1 của nhặng cừu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào bình thử nghiệm chứa thịt ngựa băm và chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ấu trùng nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: -I-1

Thử nghiệm với ruồi nhà *Musca domestica*

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn với 0,5ml dimetyl sulfoxit, và sản thể đặc này được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

10 ruồi nhà trưởng thành (*Musca domestica*) được đưa vào vào các bình chứa bột biến được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ruồi đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ruồi nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 75% với tỷ lệ áp dụng là 4 ppm: -I-1

Thử nghiệm với tuyến trùng nốt sùng (*Meloidogyne incognita*)

Dung môi: 125,0 phần khối lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất phù hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được trộn với lượng dung môi đã định, và thể đặc này được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Các chậu được đổ cát, dung dịch chứa thành phần hoạt tính, huyền phù chứa trứng/ấu trùng giun tròn nốt rỗ (*Meloidogyne incognita*) và hạt rau diếp. Hạt rau diếp nảy mầm và các cây phát triển. Các nốt sần phát triển ở rễ.

Sau 14 ngày, xác định % hiệu quả diệt tuyến trùng do việc hình thành các nốt sần. 100% có nghĩa là không phát hiện được nốt sần nào; 0% có nghĩa là số nốt sần ở thực vật được xử lý tương ứng với mẫu đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: -I-32

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: -I-40

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: -I-1

Myzus persicae – thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng dung môi đã định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) đã được gây nhiễm rệp đào xanh (*Myzus persicae*) ở tất cả các giai đoạn được phun bằng chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 5-6 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả các con rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không con rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: -I-13

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-6, I-7, I-8, I-10, I-12, I-14, I-16, I-17, I-41, I'-42, I'-44

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-5, I-11, I-30

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-2, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-1, I-19

Phaedon cochleariae – Thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng dung môi đã định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, các ấu trùng bọ cánh cứng mù tạc (*Phaedon cochleariae*) được đưa vào.

Sau thời gian 7 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng bọ cánh cứng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ấu trùng bọ cánh cứng nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1, I-5, I-7, I-8, I-10, I-11, I-12, I-14, I-15, I-16, I-17, I-25

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-6, I-30, I-35, I'-44

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-13, I-18, I-19, I-20, I-21, I-23

Spodoptera frugiperda – Thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng dung môi đã định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá ngô (*Zea mays*) được phun bằng công thức phối chế hoạt chất ở nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, ngài sâu xanh (*Spodoptera frugiperda*) được đưa vào.

Sau thời gian 7 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ngài đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ngài nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1, I-2, I-5, I-6, I-7, I-8, I-10, I-11, I-12, I-14, I-15, I-16, I-17, I-25, I-30, I-35, I'-44

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-13

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-19, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23

Tetranychus urticae – Thử nghiệm phun, kháng OP

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng dung môi đã định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá đậu (*Phaseolus vulgaris*) được gây nhiễm bằng mật nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) ở tất cả mọi giai đoạn được phun chế phẩm chứa thành phần hoạt tính ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 6 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ mật nhện đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có mật nhện nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I'-42

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: -I-34

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-22, I-36, I-37

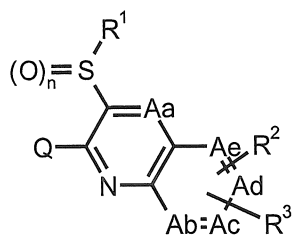
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-4, I-18, I-29

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 g/ha: -I-23

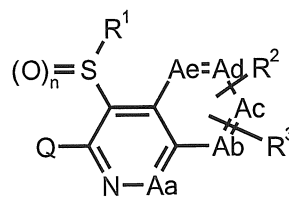
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 20 g/ha: I-21, I-40

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I')



(I)



(I')

trong đó

Aa là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab là nitơ hoặc =C(H)-,

Ac là nitơ hoặc =C(H)-,

Ad là nitơ hoặc =C(H)-,

Ae là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

R¹ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl,

(C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, aminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, hoặc (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, trong đó aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl hoặc benzyl, hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, mỗi nhóm này được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, nitro, hydroxyl, amino, carboxyl, carbamoyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong trường hợp heteroxycyl) và (=O)₂ (chỉ trong trường hợp heteroxycyl),

R², R³ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy,

(C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcacyl, (C₁-C₆)alkylthiocacyl, (C₁-C₆)haloalkylcacyl, (C₁-C₆)alkylcacyloxy, (C₁-C₆)alkoxycacyl, (C₁-C₆)haloalkoxycacyl, aminocacyl, (C₁-C₆)alkylaminocacyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocacyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocacyl, (C₂-C₆)alkenylaminocacyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocacyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocacyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocacyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocacyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminothiocacyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino hoặc NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcacylamino),

R⁷ là hydro, xyano, halogen, axetyl, hydroxyl, amino, (C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl hoặc (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl,

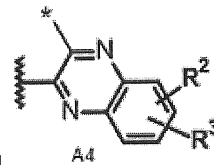
Q là hệ dị vòng hoặc dị vòng thơm 8-, 9-, 10-, 11- hoặc 12- cạnh, hai hoặc ba vòng ngưng tụ no hoặc no từng phần, trong đó ít nhất một nhóm cacyl có thể tùy ý có mặt và/hoặc trong đó hệ vòng này tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycacyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycacyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)

alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcarbonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ phenyl hoặc dị vòng thơm 5- hoặc 6-cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng này có thể tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-Xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

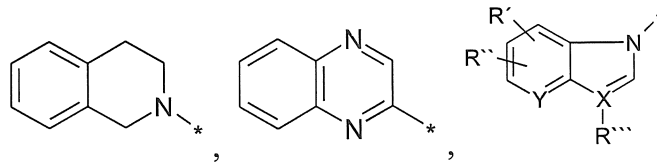
n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, trong trường hợp đơn vị cấu trúc A4



, Q không phải là

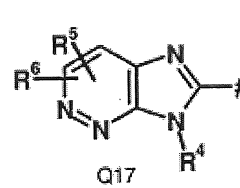
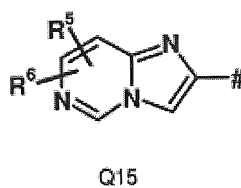
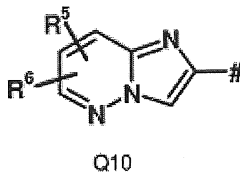
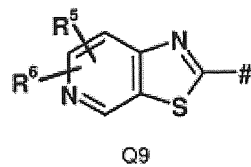
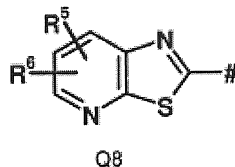
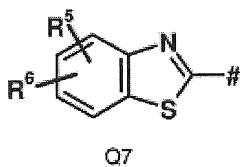
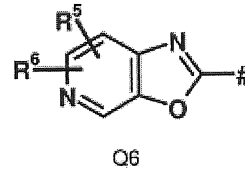
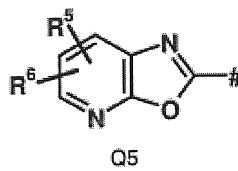
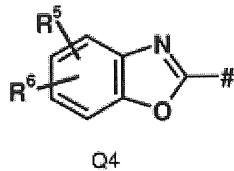
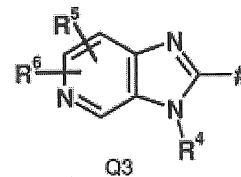
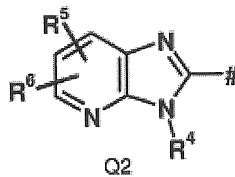
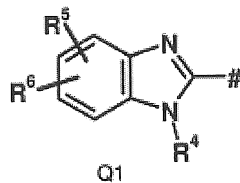
các hệ vòng sau:



trong đó X và Y, mà có thể

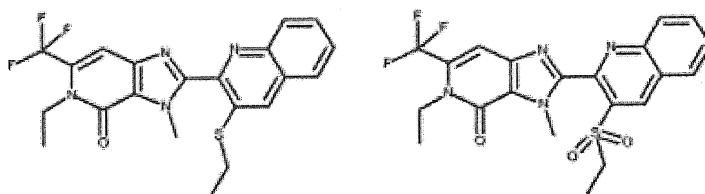
giống hoặc khác nhau, là cacbon hoặc nito, R''' là hydro, aldehyt, oxim hoặc $-C(O)O-R_a$, với điều kiện X là cacbon, trong đó R_a là C_1-C_6 -alkyl, R' và R'', mà có thể giống hoặc khác nhau, là hydro, halogen, xyano, nitro, C_1-C_6 -alkyl hoặc C_1-C_6 -alkoxy,

và, ngoài ra, khi Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17,



R^4 là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R^5, R^6 độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl hoặc di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl,



trừ

2. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó:

Aa là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab là nitơ hoặc =C(H)-,

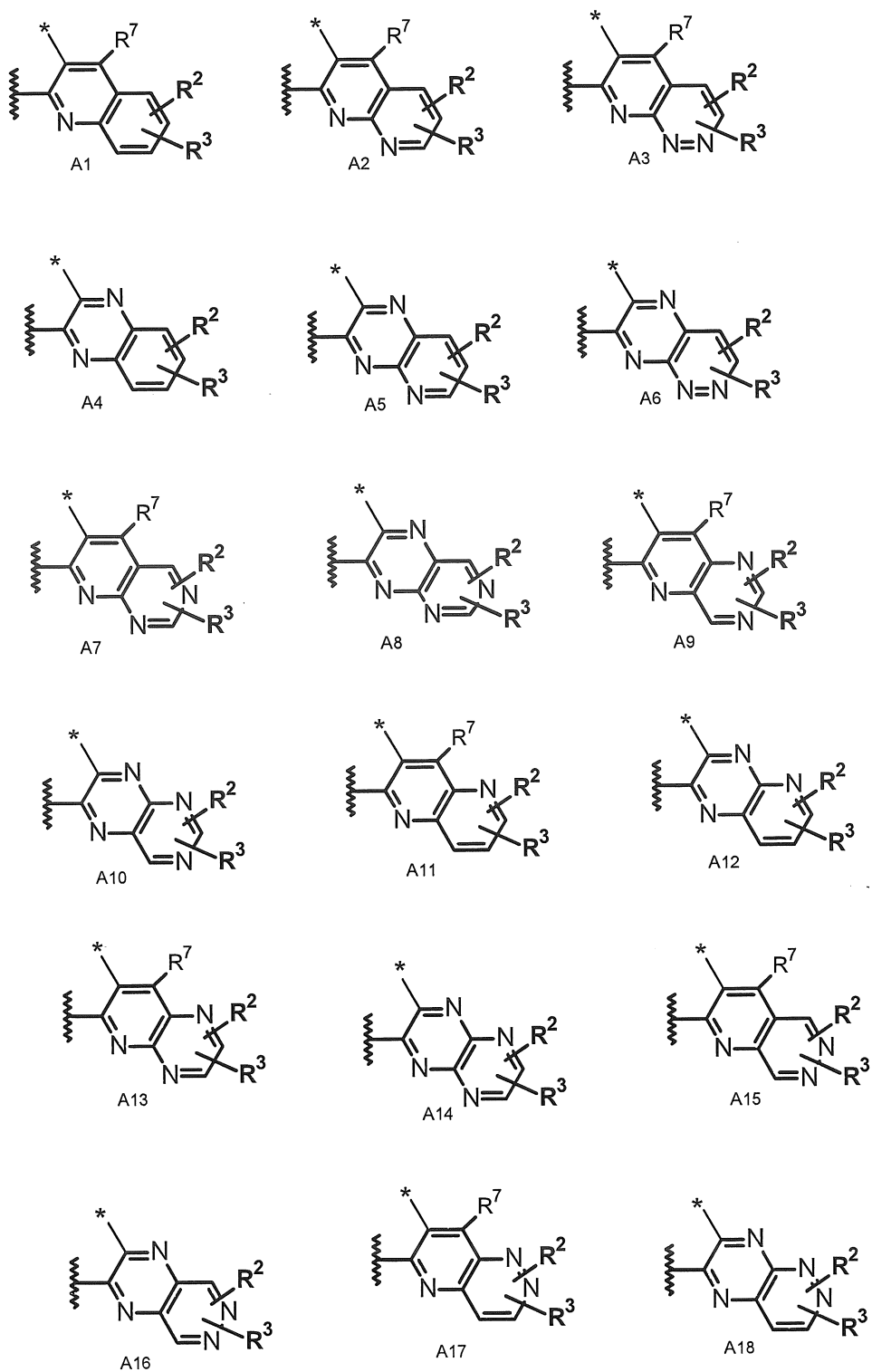
Ac là nitơ hoặc =C(H)-,

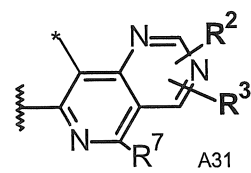
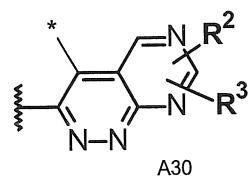
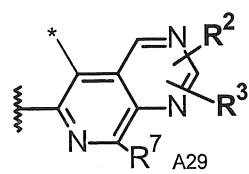
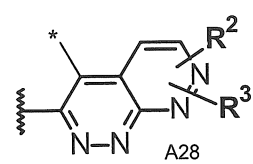
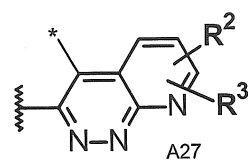
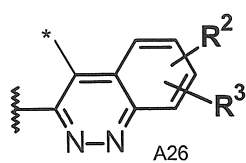
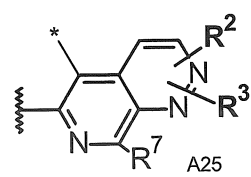
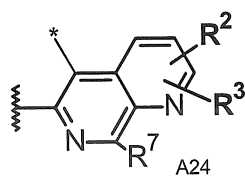
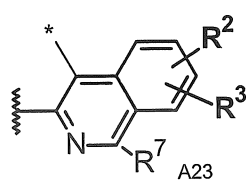
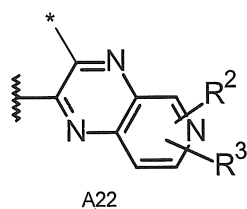
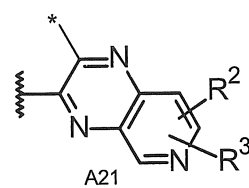
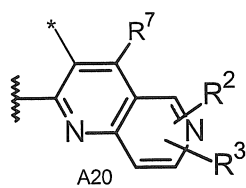
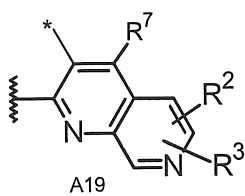
Ad là nitơ hoặc =C(H)-,

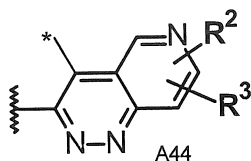
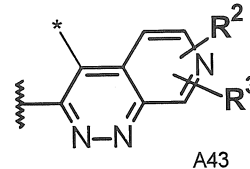
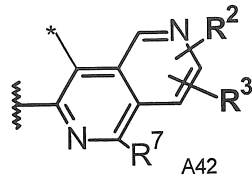
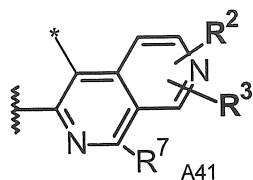
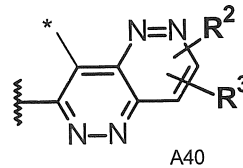
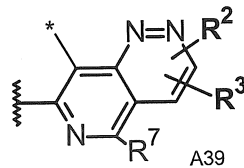
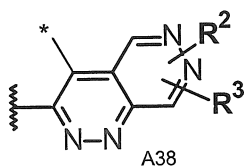
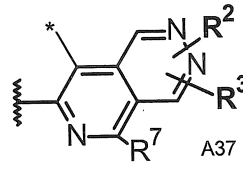
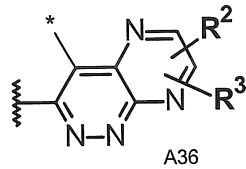
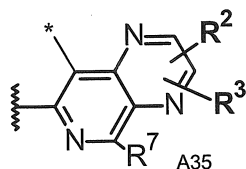
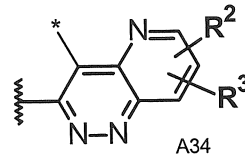
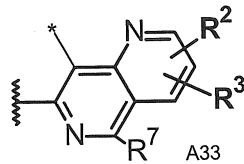
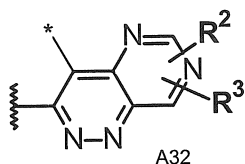
Ae là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nito,

tốt hơn là tạo ra các đơn vị cấu trúc A1 đến A44 sau:







trong đó liên kết với phần tử thế Q được xác định bằng đường lượn sóng và liên kết với nguyên tử lưu huỳnh được xác định bằng dấu hoa thị *,

R¹ là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄) xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄) haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄) haloalkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆) xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆) xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino,

(C₃-C₆)xycloalkylamino, (C₁-C₄)alkylcacbonylamino, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄) alkyl,
 (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl,
 (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl,
 (C₁-C₄)alkylcacbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylcacbonyl-(C₁-C₄)alkyl,
 (C₁-C₄)alkylsulfonylamino,

hoặc là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl,
 mỗi nhóm này tùy ý được thế một hoặc hai lần giống hoặc khác nhau bằng aryl, hetaryl
 và heteroxycyl, trong đó aryl, hetaryl và heteroxycyl mỗi nhóm có thể tùy ý được thế
 một hoặc hai lần giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, aminosulfonyl,
 (C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy,
 (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄) alkylsulfimino,
 hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một hoặc hai lần
 giống hoặc khác nhau bằng halogen, xyano, carbamoyl, (C₁-C₄)alkyl,
 (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy,
 (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄) alkylsulfimino,
 (C₁-C₄)alkylsulfoximino, (C₁-C₄)alkylcacbonyl, (C₃-C₄) trialkylsilyl, (=O) (chỉ trong
 trường hợp heteroxycyl) hoặc (=O)₂ (chỉ trong trường hợp heteroxycyl),

R², R³ độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN,
 tri(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl,
 (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)
 haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl,
 (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl,
 (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy,
 (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino,
 (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)
 haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio,
 (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl,
 (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄) haloalkylsulfonyl,
 (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcacbonyl,
 (C₁-C₄)haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, aminothiocabonyl,
 (C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocacbonyl,

(C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, aminothiocabonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcabonylamino),

R⁷ là hydro, xyano, halogen, axetyl, hydroxyl, amino, (C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl,

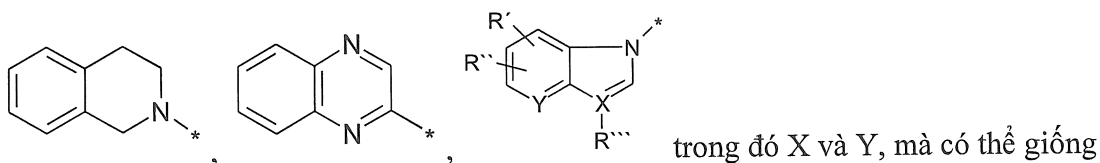
Q là hệ dị vòng thơm 8-, 9-, 10-, 11- hoặc 12-cạnh, hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ, trong đó hệ vòng này tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈) xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆) alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆) alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆) haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆) alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcabonyl, (C₁-C₆)alkylcabonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocabonyl, (C₁-C₆) haloalkylcabonyl, (C₁-C₆)alkylcabonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycabonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycabonyl, aminocabonyl, (C₁-C₆)alkylaminocabonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocabonyl, di-(C₁-C₆) alkylaminothiocabonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocabonyl, (C₁-C₆) alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino,

di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl,
 di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆) alkylsulfoximino, aminothiocabonyl,
 (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl,
 (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆) alkyl ((C₁-C₆)alkylcabonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế có thể độc lập được chọn từ phenyl hoặc dị vòng thơm 5- hoặc 6-cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng này có thể tùy ý được thế một hoặc nhiều lần giống hoặc khác nhau bằng C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-Xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, trong trường hợp đơn vị cấu trúc A4, Q không phải là các hệ vòng sau:



hoặc khác nhau, là cacbon hoặc nitơ, R''' là hydro, aldehyt, oxim hoặc -C(O)O-R_a, với điều kiện X là cacbon, trong đó R_a là C₁-C₆-alkyl, R' và R'', mà có thể giống hoặc khác nhau, là hydro, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆-alkyl hoặc C₁-C₆-alkoxy,

và, ngoài ra, khi Aa là =C(H)-, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

3. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó:

Aa là nitơ hoặc =C(R⁷)-,

Ab là nitơ hoặc =C(H)-,

Ac là nitơ hoặc =C(H)-,

Ad là nitơ hoặc =C(H)-,

Ae là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

tốt hơn là tạo ra các đơn vị cấu trúc sau: A1, A2, A3, A4, A5, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A17, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A39, A41, A42, A43,

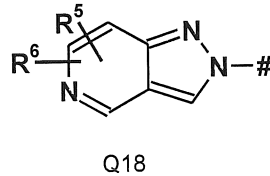
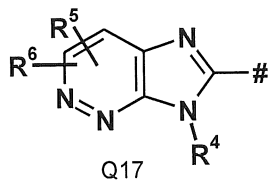
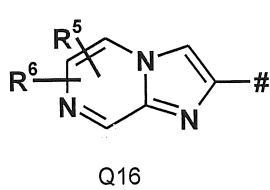
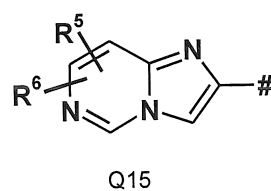
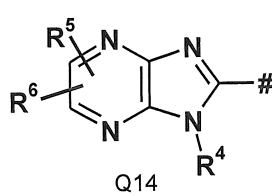
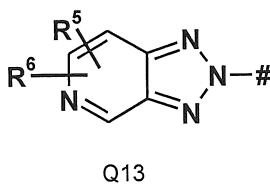
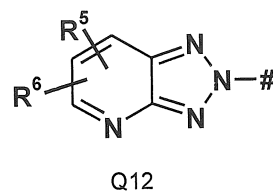
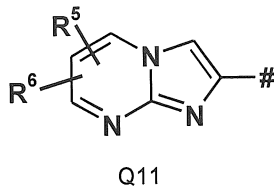
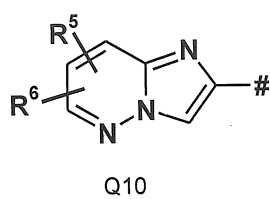
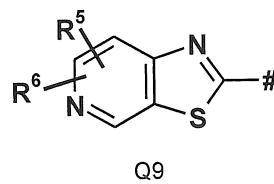
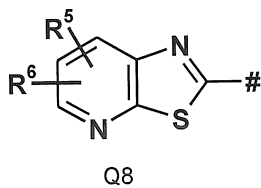
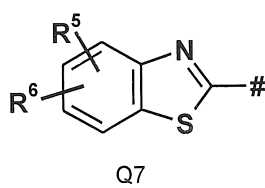
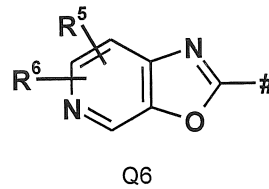
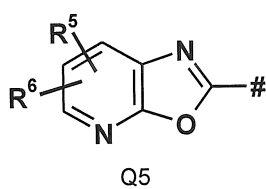
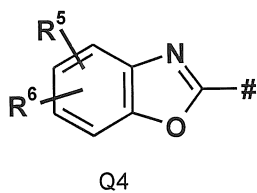
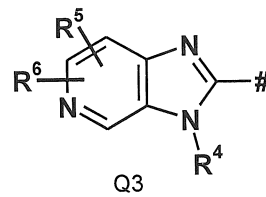
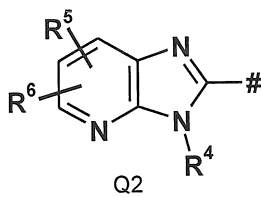
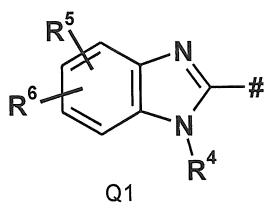
A44,

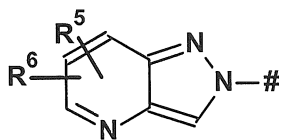
R^1 là (C_1-C_4) -alkyl, (C_1-C_4) hydroxyalkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfinyl- (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkylsulfonyl- (C_1-C_4) alkyl,

R^2, R^3 độc lập là hydro, xyano, halogen, nitro, hydroxyl, amino, SCN, tri- (C_1-C_4) alkylsilyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, halo- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) xyanoalkyl, (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) xyanoalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_2-C_4) xyanoalkynyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) xyanoalkoxy, (C_1-C_4) alkylhydroxyimino, (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkyl- (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyloxy, (C_1-C_4) alkylcacbonyl, (C_1-C_4) haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, (C_1-C_4) alkylaminocacbonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminocacbonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonylamino, (C_1-C_4) alkylamino, di- (C_1-C_4) alkylamino, aminosulfonyl, (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl hoặc $NHCO-(C_1-C_4)$ alkyl $((C_1-C_4)$ alkylcacbonylamino),

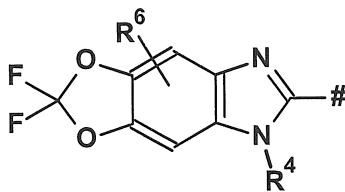
R^7 là hydro, halogen, xyano, (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) haloalkyl,

Q là hệ dị vòng thơm 9-cạnh hoặc 12-cạnh, hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm Q1 đến Q20:





Q19



Q20

R^4 là hydro, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) xyanoalkyl, (C_1-C_4) hydroxyalkyl, (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) alkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) xyanoalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) alkynyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, halo- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfinyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl- (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkylcacbonyl- (C_1-C_4) alkyl,

R^5, R^6 độc lập là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyloxy, (C_1-C_4) alkylcacbonyl, (C_1-C_4) haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, (C_1-C_4) alkylaminocacbonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminocacbonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonylamino, (C_1-C_4) alkylamino, di- (C_1-C_4) alkylamino, aminosulfonyl, (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl hoặc di- (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl,

n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, khi Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

4. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó

Aa là nito hoặc $=C(R^7)-$,

Ab là nito hoặc $=C(H)-$,

Ac là nitơ hoặc =C(H)-,

Ad là nitơ hoặc =C(H)-,

Ae là nitơ hoặc =C(H)-,

trong đó Ab, Ac, Ad và Ae không thể đều là nitơ,

còn tốt hơn nữa nếu tạo ra các đơn vị cấu trúc sau: A1, A2, A4, A5, A7, A9, A11, A12, A13, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A26, A27, A29, A31, A33, A34, A35, A41, A42, A43, A44,

R¹ là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl hoặc (C₃-C₆)-xycloalkyl,

R², R³ độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkylcacbonylamino),

R⁷ là hydro, halogen, xyano, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkyl,

Q là hệ dị vòng thơm 9-cạnh hoặc 12-cạnh hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 hoặc Q20,

R⁴ là hydro, (C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)alkyl,

R⁵ là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆) xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄) haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylcacbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcacbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocacbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄) alkylaminosulfonyl hoặc di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl,

R⁶ là hydro,

n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, khi Aa là =C(H)-, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

5. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó

Aa là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab là $=C(H)-$,

Ac là $=C(H)-$,

Ad là $=C(H)-$,

Ae là nitơ hoặc $=C(H)-$,

đặc biệt là tạo ra các đơn vị cấu trúc sau: A1, A4, A23, A26, A33,

R^1 là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^2, R^3 độc lập là hydro, flo, clo, brom, iot, xyano, metyl, etyl, metoxy, triflometyl, triflometoxy hoặc triflometylthio,

R^7 là hydro, flo, clo, brom, xyano, metyl, etyl hoặc triflometyl,

Q là hệ dị vòng thơm 9-cạnh, hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q16, Q17 hoặc Q20,

R^4 là hydro, metyl, etyl, isopropyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R^5 là flo, clo, brom, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl (CH_2CFH_2 , $CHFCH_3$), difloetyl (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , $CHFCFH_2$), trifloetyl (CH_2CF_3 , $CHFCHF_2$, CF_2CFH_2), tetrafloetyl ($CHFCF_3$, CF_2CHF_2), pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfinyl hoặc triflometylsulfanyl,

R^6 là hydro,

n là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, khi Aa là $=C(H)-$, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q17.

6. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó

Aa là nitơ hoặc $=C(R^7)-$,

Ab là $=C(H)-$,

Ac là =C(H)-,

Ad là =C(H)-,

Ae là nitor hoặc =C(H)-,

tạo ra các đơn vị cấu trúc sau: A1, A4, A23, A26, A33

R¹ là metyl hoặc etyl,

R² là hydro, clo, metoxy hoặc triflometyl,

R³ là hydro,

R⁷ là hydro,

Q là hệ dị vòng thơm 9-cạnh hoặc 12-cạnh hai vòng ngưng tụ từ nhóm gồm Q1, Q2, Q3, Q16, Q17, Q20,

R⁴ là hydro hoặc metyl,

R⁵ is triflometyl hoặc pentafloretyl,

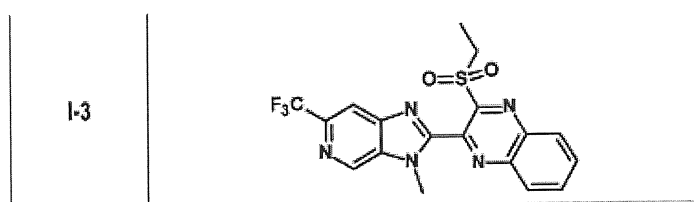
R⁶ là hydro,

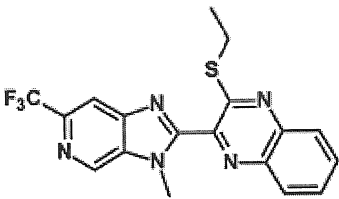
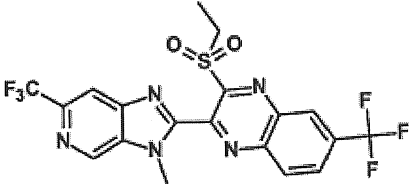
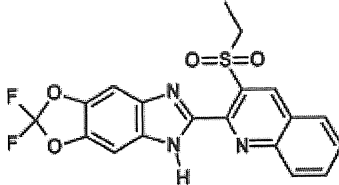
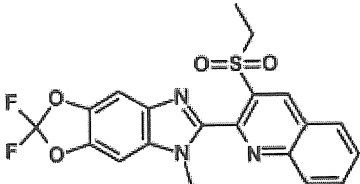
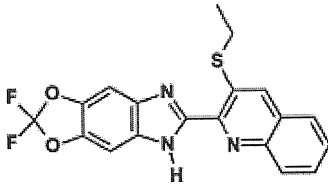
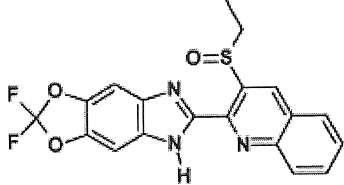
n là 0, 1 hoặc 2,

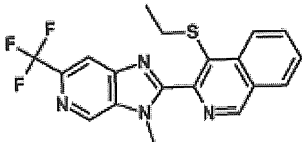
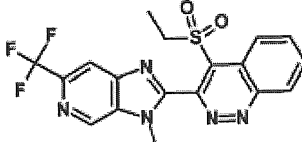
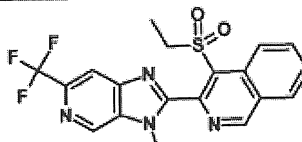
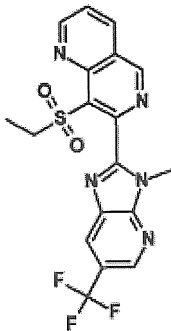
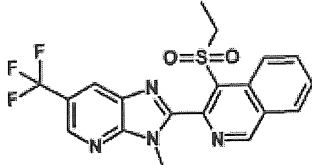
trong đó, khi Aa là =C(H)-, trong trường hợp hợp chất có công thức (I), Q không phải là Q1, Q2, Q3, Q17.

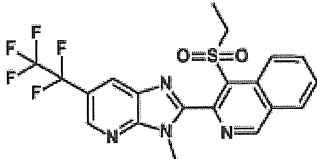
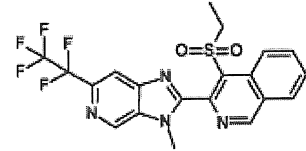
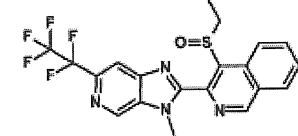
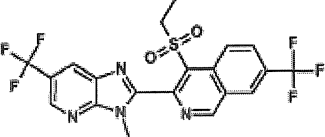
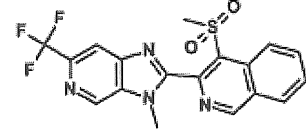
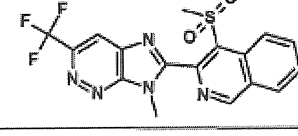
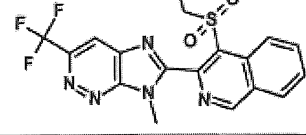
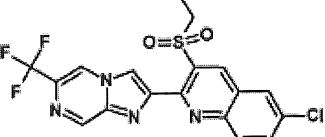
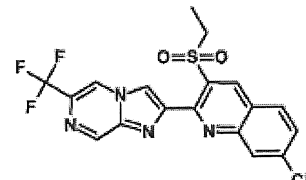
7. Hợp chất có công thức (I') theo điểm 1, trong đó R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae và n có ý nghĩa như được đưa ra trên đây.

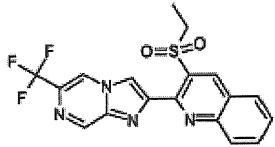
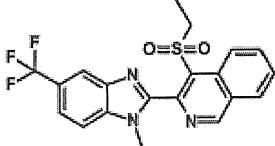
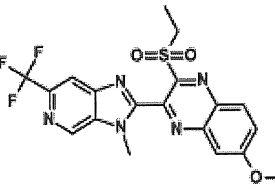
8. Hợp chất có công thức (I) hoặc (I') theo điểm 1, trong đó hợp chất này có công thức theo các ví dụ I-3, I-4, I-9, I-15, I-16, I-31, I-36, I'-42, I'-43, I'-44, I'-45, I'-47, I'-48, I'-49, I'-50, I'-51, I'-52, I'-53, I'-54, I-55, I-56, I-57, I'-58, I-59:



I-4	
I-9	
I-15	
I-16	
I-31	
I-36	

I'-42	
I'-43	
I'-44	
I'-45	
I'-47	

I'-48	
I'-49	
I'-50	
I'-51	
I'-52	
I'-53	
I'-54	
I-55	
I-56	

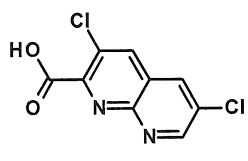
I-57	
I'-58	
I-59	

9. Chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') theo điểm 1 và cả chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt.

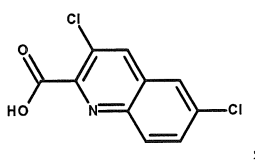
10. Chế phẩm hóa nông theo điểm 9, trong đó chế phẩm này còn chứa thêm thành phần hoạt tính hóa nông khác.

11. Phương pháp phòng trừ động vật gây hại, khác biệt ở chỗ hợp chất có công thức (I) hoặc công thức (I') theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông theo điểm 9 hoặc 10 được để cho tác động đến động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng, loại trừ phương pháp phẫu thuật hoặc điều trị bệnh cho cơ thể người hoặc động vật.

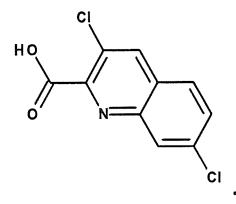
12. Hợp chất có công thức (III-1), (III-2), hoặc (III-3):



(III-1)



(III-2)



(III-3)