(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) **1-0037184**

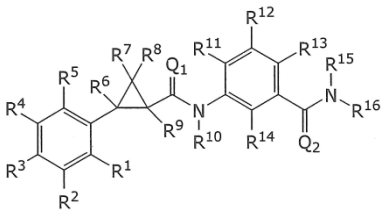
(51)[2022.01] **C07C 237/42**; C07C 255/29; C07C 259/10; C07C 311/46; C07C 317/28; C07C 323/42; C07C 323/59; C07D 333/58; C07D 213/40; C07D 213/84; C07D 231/12; C07D 233/36; C07D 249/08; C07D 277/28; C07D 307/38; A01N 53/00; C07D 207/10

(13) **B**

(21) 1-2017-03871 (22) 07/04/2016
(86) PCT/US2016/026413 07/04/2016 (87) WO2016/168058 20/10/2016
(30) 62/148,809 17/04/2015 US; 62/148,814 17/04/2015 US; 62/148,837 17/04/2015 US; 62/148,824 17/04/2015 US; 62/148,830 17/04/2015 US; 62/148,818 17/04/2015 US
(45) 25/10/2023 427 (43) 26/03/2018 360A
(73) CORTEVA AGRISCIENCE LLC (US)
9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268, United States of America
(72) MARTIN Timothy P. (US); ECKELBARGER Joseph D. (US); ROSS Ronald (US); DEKORVER Kyle A. (US); HEEMSTRA Ronald J. (US); KNUEPPEL Daniel I. (US); VEDNOR Peter (US); HUNTER Ricky (US); DEMETER David A. (US); TRULLINGER Tony K. (US); BAUM Erich W. (US); BENKO Zoltan L. (US); CHOY Nakyen (US); CROUSE Gary D. (US); DAEUBLE John F. (US); LI Fangzheng (US); NISSEN Jeffrey (US); SPARKS Thomas C. (US); WESSELS Frank J. (US); YAP Maurice C. (MY).
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT PHENYL-XYCLOPROPYL CARBOXAMIDO-BENZAMIT, CHẾ PHẨM DIỆT SINH VẬT GÂY HẠI CHỨA HỢP CHẤT NÀY, VÀ QUY TRÌNH KIỂM SOÁT SINH VẬT GÂY HẠI

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất phenyl-xyclopropylcarboxamido-benzamit có công thức (I); chế phẩm diệt sinh vật gây hại chứa hợp chất này; và quy trình kiểm soát sinh vật gây hại.



(I)

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất diệt sinh vật gây hại đối với sinh vật gây hại trong các ngành Chân khớp (Phyla Arthropoda), ngành Thân mềm (Mollusca), và ngành Giun tròn (Nematoda), các hợp chất trung gian được sử dụng trong quy trình xử lý này, các chế phẩm diệt sinh vật gây hại chứa các hợp chất này, và các quy trình xử lý có sử dụng các chế phẩm diệt sinh vật gây hại đối với sinh vật gây hại này. Các chế phẩm diệt sinh vật gây hại này có thể được sử dụng, ví dụ, làm thuốc diệt ve, thuốc diệt côn trùng, thuốc trừ nhện, chất diệt động vật thân mềm, và thuốc diệt giun tròn.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

"Nhiều bệnh nguy hiểm nhất của con người được truyền bởi các sinh vật truyền bệnh dạng côn trùng" (Rivero et al.). "Theo lịch sử, bệnh sốt rét, sốt xuất huyết, sốt vàng, bệnh dịch hạch, bệnh lao, bệnh sốt rét, bệnh lao, và các bệnh do sinh vật truyền bệnh khác gây ra bệnh và cái chết ở người từ thế kỷ thứ 17 đến trước thế kỷ 20 nhiều hơn tất cả các nguyên nhân khác kết hợp" (Gubler). Các bệnh do côn trùng truyền nhiễm chiếm khoảng 17% của bệnh ký sinh trùng và bệnh truyền nhiễm toàn cầu. Chỉ riêng bệnh sốt rét gây ra hơn 800,000 ca tử vong mỗi năm, 85% trong số đó xảy ra ở trẻ em dưới năm tuổi. Mỗi năm có khoảng từ 50 đến 100 triệu ca sốt dengue. Còn có từ 250,000 đến 500,000 trường hợp sốt xuất huyết dengue xảy ra mỗi năm (Matthews). Việc kiểm soát sinh vật lây nhiễm đóng vai trò rất quan trọng trong việc ngăn ngừa và kiểm soát các bệnh truyền nhiễm. Tuy nhiên, sức đề kháng với thuốc diệt côn trùng, bao gồm khả năng đề kháng với nhiều chất diệt côn trùng, đã xuất hiện ở tất cả các loài côn trùng gây hại cho con người (Rivero et al.). Hiện này, có hơn 550 loài động vật chân đốt đã phát triển sức đề kháng với ít nhất một loại thuốc diệt sinh vật gây hại (Whalon et al.). Hơn nữa, các trường hợp kháng côn trùng tiếp tục vượt quá do cách xa số trường hợp kháng thuốc diệt cỏ và thuốc kháng nấm (Sparks et al.).

Mỗi năm côn trùng, mầm bệnh thực vật, và cỏ dại, phá hủy hơn 40% sản lượng thực phẩm. Tổn thất này xảy ra mặc dù áp dụng thuốc diệt sinh vật gây hại và sử dụng

một loạt các kiểm soát phi hóa học, như, luân canh, và kiểm soát sinh học. Nếu chính một số thực phẩm này có thể được cứu, thì nó có thể được sử dụng để cấp cho nhiều hơn ba tỷ người trên thế giới bị suy dinh dưỡng (Pimental).

Giun tròn ký sinh thực vật là một trong số các sinh vật gây hại phổ biến nhất, và thường là một trong số sinh vật khó tiêu diệt và mất nhiều chi phí nhất. Ước tính là tổn hại do giun tròn gây ra từ khoảng 9% ở các nước phát triển đến khoảng 15% ở các nước kém phát triển. Tuy nhiên, ở Hoa Kỳ của một cuộc khảo sát của 35 tiểu bang trên các loại cây trồng khác nhau cho thấy thiệt hại do giun tròn gây ra lên đến 25% (Nicol et al.).

Lưu ý là động vật chân bụng (sên và ốc sên) là các loại sinh vật gây hại có ít quan trọng về kinh tế hơn nếu động vật chân đốt hoặc giun tròn, nhưng ở những nơi nhất định, về cơ bản chúng có thể làm giảm năng suất, ảnh hưởng nghiêm trọng đến sản phẩm thu hoạch, cũng như, truyền bệnh cho người, động vật, và thực vật. Mặc dù chỉ có một vài loài động vật chân bụng là các loài sinh vật gây hại nghiêm trọng ở khu vực, nhưng một số ít loài là các sinh vật gây hại quan trọng trên quy mô toàn cầu. Cụ thể, động vật chân bụng ảnh hưởng đến nhiều loại cây trồng nông nghiệp và cây trồng vườn, như cây canh tác, cây cỏ, cây lấy sợi; rau; cây bụi và cây ăn quả; các loại thảo mộc; và cây trồng trang trí (Speiser).

Mối gây thiệt hại đối với các loại công trình cá nhân và công cộng, cũng như nguồn tài nguyên nông nghiệp và lâm nghiệp. Trong năm 2005, đã ước tính là mối gây ra thiệt hại trên 50 tỷ US$ toàn thế giới mỗi năm (Korb).

Do đó, vì một số nguyên nhân, bao gồm các nguyên nhân nêu trên, vẫn cần chi phí (ước tính khoảng 256 triệu US$ cho thuốc diệt sinh vật gây hại trong 2010), tiêu tốn thời gian (trung bình khoảng 10 năm cho thuốc diệt sinh vật gây hại), và khó khăn, cho việc phát triển thuốc diệt sinh vật gây hại mới (CropLife America).

Tài liệu tham khảo

CropLife America, The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future, 2010.

Drewes, M., Tietjen, K., Sparks, T.C., High-Throughput Screening in Agrochemical Research, *Modern Methods in Crop Protection Research*, Part I, *Methods*

for the Design and Optimization of New Active Ingredients, Edited by Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., and Matthias W., p. 1-20, 2012.

Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, Emerging Infectious Diseases, Vol. 4, No. 3, p. 442-450, 1998.

Korb, J., Termites, *Current Biology*, Vol. 17, No. 23, 2007.

Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases, Ch. 1, p. 1, 2011.

Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hocksland, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, *Genomic and Molecular Genetics of Plant - Nematode Interactions*, p. 21-43, 2011.

Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, *Agricultural Sciences* - Vol. II, 2009.

Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector-Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem? *Public Library of Science Pathogens*, Vol. 6, No. 8, p. 1-9, 2010.

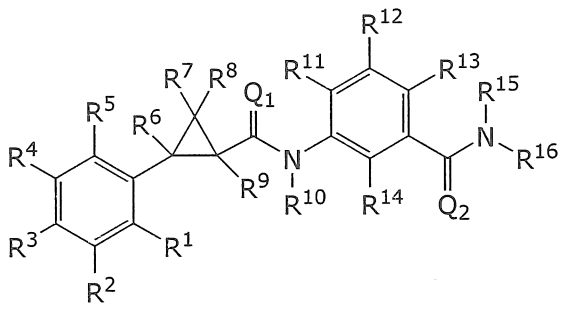
Sparks T.C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management, *Pesticide Biochemistry and Physiology* (2014) available online 4 December 2014.

Speiser, B., Molluscicides, *Encyclopedia of Pest Management*, Ch. 219, p. 506-508, 2002.

Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Ch. 1, p. 5-33, 2008.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I)



(I)

trong đó:

(A) R^1 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(B) R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(C) R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(D) R^4 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-$

C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(E) R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(F) R^6 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl;

(G) R^7 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, và I;

(H) R^8 được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, và I;

(I) R^9 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl;

(J) R^{10} được chọn từ nhóm bao gồm H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl(C_1-C4)alkoxy, C(=O)(C_1-C_4)alkyl, và (C_1-C_4)alkoxyC(=O)(C_1-C_4)alkyl;

(K) R^{11} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(L) R^{12} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(M) R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-

C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(N) R^{14} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(O) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl(C_1-C4)alkoxy, C(=O)(C_1-C_4)alkyl, và (C_1-C_4)alkoxyC(=O)(C_1-C_4)alkyl;

(P) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkylphenyl, (C_2-C_8)alkenyl, (C_2-C_8)alkynyl, (C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)alkyl, O-phenyl, O-(C_2-C_8)alkenyl, O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, O-(C_1-C_8)alkylphenyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-C(=O) nH-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-NHC(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)haloalkyl, và (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-NH$_2$,

trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN, OH, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkoxy, (C_1-C_8)haloalkyl, N((C_1-C_8)alkyl)$_2$, C(O)O(C_1-C_8)alkyl, benzothioenyl, 2,3-dihydro-1*H*-imidazolonyl, furanyl, pyrazolyl, pyridinyl, thiazolyl, và triazolyl;

(Q) R^{15} và R^{16} có thể tùy ý cùng tạo ra liên kết hydrocarbyl no hoặc không no có từ 2 đến 5 cạnh, mà có thể chứa một hoặc nhiều nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, lưu huỳnh, và oxy,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, và NO$_2$;

(R) mỗi Q^1 và Q^2 được chọn độc lập từ nhóm bao gồm O và S; và

N-oxit, muối cộng hợp axit nông dụng, dẫn xuất muối, solvat, dẫn xuất este, dạng tinh thể đa hình, chất đồng vị, chất đồng phân lập thể được hòa tan, và chất hỗ biến, của hợp chất có công thức (I).

Mô tả chi tiết sáng chế

Các định nghĩa được sử dụng trong sáng chế

Các ví dụ được đưa ra trong các định nghĩa này thường là không đầy đủ và phải được hiểu là không làm giới hạn sáng chế. Được hiểu là nhóm thế cần được tuân theo quy tắc liên kết hóa học và các liên kết tương thích việc bố trí các hợp chất trong không gian liên quan đến hợp chất cụ thể mà được gắn vào đó. Các định nghĩa này chỉ được sử dụng nhằm mục đích của sáng chế.

Thuật ngữ "hoạt chất" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ có hoạt tính hữu ích trong việc kiểm soát sinh vật gây hại, và/hoặc là hữu ích trong việc giúp các vật liệu khác có hoạt tính tốt hơn trong việc kiểm soát sinh vật gây hại, ví dụ về các vật liệu này bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, thuốc diệt ve, thuốc diệt tảo, thuốc diệt sinh vật ăn lá, thuốc diệt chim, thuốc diệt vi khuẩn, thuốc đuổi chim, thuốc triệt sản, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ an toàn, thuốc diệt cỏ, thuốc thu hút côn trùng, thuốc đuổi côn trùng, thuốc diệt côn trùng, thuốc chống động vật có vú, thuốc gây rối loạn giao phối, thuốc diệt ốc sên, thuốc diệt giun tròn, thuốc hoạt hóa thực vật, thuốc điều chỉnh sự tăng trưởng thực vật, thuốc diệt động vật gặm nhấm, thuốc có tác dụng hiệp đồng, và thuốc diệt virut (xem trên alanwood.net). Các ví dụ cụ thể về các vật liệu này bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, các vật liệu được liệt kê trong nhóm hoạt chất alpha.

Thuật ngữ "nhóm hoạt chất alpha" (sau được gọi là "AIGA") có nghĩa là bao gồm tập hợp các hoạt chất sau đây:

(1)(3-etoxypropyl)thủy ngân bromua, 1,2-dibromoetan, 1,2-dicloetan, 1,2-dicloropan, 1,3-dicloropen, 1-MCP, 1-metylxyclopropen, 1-naphthol, 2-(octylthio)etanol, 2,3,3-TPA, axit 2,3,5-tri-iodobenzoic, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4,5-TP, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 2,4-DES, 2,4-DP, 2,4-MCPA, 2,4-MCPB, 2iP, 2-metoxyetylthủy ngân clorua, 2-phenylphenol, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, axit 3,6-diclopicolinic, 4-aminopyridin, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, rượu 4-hydroxyphenetyl, 8-hydroxyquinolin sulfat, 8-phenylmercurioxyquinolin, abamectin, abamectin-aminometyl,

axit abscisic, ACC, axephat, axequinoxyl, axetamiprid, axethion, axetoclo, axetofenat, axetophos, axetoprol, acibenzolar, aciflorfen, aclonifen, ACN, acrep, acrinathrin, acrolein, acrylonitril, axypetacs, afidopyropen, afoxolaner, alaclo, alanap, alanycarb, albendazol, aldicarb, aldicarb sulfone, aldimorph, aldoxycarb, aldrin, allethrin, allicin, allidoclo, allosamidin, alloxydim, rượu allyl, allyxycarb, alorac, *alpha*-xypermetrin, *alpha*-endosulfan, alphametrin, altretamin, nhôm phosphit, nhôm phosphit, ametoctradin, ametridion, ametryn, ametryn, amibuzin, amicarbazon, amicarthiazol, amidithion, amidoflumet, amidosulfuron, aminocarb, aminoxyclopyraclo, aminopyralid, aminotriazol, amiprofos-metyl, amiprophos, amiprophos-metyl, amisulbrom, amiton, amitraz, amitrol, amoni sulfamat, amobam, silica gel vô định hình, silic dioxit vô định hình, ampropylfos, AMS, anabasin, anxymidol, anilazin, anilofos, anisuron, anthraquinon, antu, apholat, aramit, arprocarb, arsen oxit, asomat, aspirin, asulam, athidathion, atraton, atrazin, aureofungin, avermectin B1, AVG, aviglyxin, azaconazol, azadirachtin, azafenidin, azamethiphos, azidithion, azimsulfuron, azinphosetyl, azinphos-etyl, azinphosmetyl, azinphos-metyl, aziprotryn, aziprotryn, azithiram, azobenzen, azoxyclotin, azothoat, azoxystrobin, bachmedesh, barban, barbanat, bari hexaflosilicat, bari polysulfua, bari silicoflorua, barthrin, đồng cacbonat bazơ, đồng clorua bazơ, đồng sulfat bazơ, BCPC, beflubutamid, benalaxyl, benalaxyl-M, benazolin, bencarbazon, benclothiaz, bendaqingbingzhi, bendiocarb, bendioxit, benefin, benfluralin, benfuracarb, benfuresat, benmihuangcaoan, benodanil, benomyl, benoxacor, benoxafos, benquinox, bensulfuron, bensulit, bensultap, bentaluron, bentazon, bentazone, benthiavalicarb, benthiazol, benthiocarb, bentranil, benzadox, benzalkoni clorua, benzamacril, benzamizol, benzamorf, benzen hexaclorua, benzfendizon, benzimin, benzipram, benzobixyclon, benzoepin, benzofenap, benzoflor, axit benzohydroxamic, benzomat, benzophosphat, benzothiadiazol, benzovindiflupyr, benzoximat, benzoylprop, benzthiazuron, benzuocaotong, benzyl benzoat, benzyladenin, berberin, *beta*-xyfluthrin, *beta*-xypermetrin, bethoxazin, BHC, bialaphos, bixyclopyron, bifenazat, bifenox, bifenthrin, bifujunzhi, bilanafos, binapacryl, bingqingxiao, bioallethrin, bioethanometrin, biopermetrin, bioresmetrin, biphenyl, bisazir, bismerthiazol, bismerthiazol-đồng, bisphenylthủy ngân metylendi(x-naphtalen-y-sulphonat), bispyribac, bistrifluron, bisultap, bitertanol, bithionol, bixafen, blasticidin-S, borax, hỗn hợp Bordeaux, axit boric, boscalid, BPPS, brassinolit, brassinolit-etyl, brevicomin, brodifacoum, brofenprox,

brofenvalerat, broflanilit, brofluthrinat, bromaxil, bromadiolon, bromclophos, brometalin, brometrin, bromfenvinfos, bromoaxetamit, bromobonil, bromobutit, bromociclen, bromoxyclen, bromo-DDT, bromofenoxim, bromofos, bromometan, bromophos, bromophos-etyl, bromopropylat, bromothalonil, bromoxynil, brompyrazon, bromuconazol, bronopol, BRP, BTH, bucarpolat, bufencarb, buminafos, bupirimat, buprofezin, hỗn hợp Burgundy, busulfan, busulphan, butacarb, butaclo, butafenacil, butam, butamifos, butan-fipronil, butathiofos, butenaclo, buten-fipronil, butethrin, buthidazol, buthiobat, buthiuron, butifos, butocarboxim, butonat, butopyronoxyl, butoxycarboxim, butralin, butrizol, butroxydim, buturon, butylamin, butylat, butylclophos, butylen-fipronil, axit cacodylic, cadusafos, cafenstrol, calciferol, canxi arsenat, canxi cloat, canxi xyanamit, canxi xyanit, canxi polysulfua, calvinphos, cambendiclo, campheclo, camphor, captafol, captan, carbam, carbamorph, carbanolat, carbaril, carbaryl, carbasulam, carbathion, carbendazim, carbendazol, carbetamit, carbofenotion, carbofuran, carbon disulfua, carbon tetraclorua, carbonyl sulfua, carbophenothion, carbophos, carbosulfan, carboxazol, carboxit, carboxin, carfentrazon, carpropamid, cartap, carvacrol, carvon, CAVP, CDAA, CDEA, CDEC, xenloxidin, CEPC, xeralure, xerenox, xevadilla, hỗn hợp Cheshunt, chinalphos, chinalphos-metyl, chinomethionat, chinomethionat, chiralaxyl, chitosan, clobenthiazon, clometoxyfen, cloaloza, cloamben, cloamin phospho, cloamphenicol, cloaniformetan, cloanil, cloanocryl, cloantraniliprol, cloazifop, cloazin, clobensit, clobenzuron, clobixyclen, clobromuron, clobufam, clodan, clodecon, clodimeform, cloempentrin, cloetazat, cloethephon, cloetoxyfos, cloeturon, clofenac, clofenapyr, clofenazol, clofenethol, clofenidim, clofenprop, clofenson, clofensulphit, clofenvinphos, clofenvinphos-metyl, clofluazuron, cloflurazol, cloflurecol, clofluren, cloflurenol, cloidazon, cloimuron, cloinat, clo-IPC, clomephos, clomequat, clomesulon, clometoxynil, clonidin, clonitrofen, axit cloaxetic, clobenzilat, clodinitronaphtalens, clofenizon, cloform, clomebuform, clomethiuron, cloneb, clophaxinon, clophos, clopicrin, clopon, clopropylat, clothalonil, clotoluron, cloxifenidim, cloxuron, cloxynil, clophoni, clophoxim, cloprazophos, cloprocarb, clopropham, clopyrifos, clopyrifos-metyl, cloquinox, closulfuron, clothal, clothiamid, clothiophos, clotoluron, clozolinat, chltosan, cholecalciferol, cholin clorua, chromafenozit, cicloheximit, cimectacarb, cimetacarb, cinerin I, xinerin II, xinerins, xinidon-etyl, xinmetylin, xinosulfuron, xintofen, xiobutit, xisanilit, xismetrin, claxyfos,

clefoxydim, clenpirin, clenpyrin, clethodim, climbazol, cliodinat, clodinafop, cloethocarb, clofenxet, clofenotan, clofentezin, clofenvinfos, axit clofibric, clofop, clomazon, clomeprop, clonitralid, cloprop, cloproxydim, clopyralid, cloquintoxet, cloansulam, closantel, clothianidin, clotrimazol, cloxyfonac, cloxylacon, clozylacon, CMA, CMMP, CMP, CMU, codlelure, colecalciferol, colophonat, đồng 8-quinolinolat, đồng axetat, đồng axetoarsenit, đồng arsenat, đồng carbonat, bazơ, đồng hydroxit, đồng naphtenat, đồng oleat, đồng oxyclorua, đồng silicat, đồng sulfat, đồng sulfat, bazơ, đồng kẽm cromat, coumaclo, coumafen, coumafos, coumafuryl, coumaphos, coumatetralyl, coumetoxystrobin, coumithoat, coumoxystrobin, CPMC, CPMF, CPPC, credazin, cresol, axit cresylic, crimidin, crotamiton, crotoxyfos, crotoxyphos, crufomate, cryolit, cue-lure, cufraneb, cumyleron, cumyluron, cuprobam, cuprous oxit, curcumenol, CVMP, xyanamit, xyanatryn, xyanazin, xyanofenphos, xyanogen, xyanophos, xyanthoat, xyantraniliprol, axit xyanuric, xazofamid, xybutryne, xyclafuramid, xyclanilit, xyclaniliprol, xyclethrin, xycloat, xycloheximit, xycloprat, xycloprothrin, xyclopyrimorat, xyclosulfamuron, xycloxydim, xycluron, xyenopyrafen, xyflufenamid, xyflumetofen, xyfluthrin, xyhalofop, xyhalothrin, xyhexatin, xymiazol, xymoxanil, xyometrinil, xypendazol, xypermetrin, xyperquat, xyphenothrin, xyprazin, xyprazol, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, xypromid, xyprosulfamit, xyromazin, xythioat, xytrex, daimuron, dalapon, daminozit, dayoutong, dazomet, DBCP, d-camphor, DCB, DCIP, DCPA, DCPTA, DCU, DDD, DDPP, DDT, DDVP, debacarb, decafentin, decametrin, decarbofuran, deet, axit dehydroaxetic, deiquat, delaclo, delnav, deltametrin, demephion, demephion-O, demephion-S, demeton, demeton-metyl, demeton-O, demeton-O-metyl, demeton-S, demeton-S-metyl, demeton-S-metyl sulphon, demeton-S-metylsulphon, DEP, depallethrin, derris, desmedipham, desmetryn, desmetryn, d-fanshiluquebingjuzhi, diafenthiuron, dialifor, dialifos, diallat, diamidafos, dianat, đất tảo cát, diatomit, diazinon, dibrom, dibutyl phtalat, dibutyl sucxinat, dicamba, dicapthon, diclobenil, diclofenthion, diclofluanid, diclon, dicloalurea, diclobenzuron, diclofenidim, dicloflurecol, dicloflurenol, diclomat, diclomid, diclometan, dicloomezotiaz, diclophen, dicloprop, dicloprop-P, diclovos, diclozolin, diclozolin, diclobutrazol, dicloxymet, diclofop, diclomezin, dicloan, diclosulam, dicofol, dicophan, dicoumarol, dicresyl, dicrotophos, dicryl, dicumarol, dixyclanil, dixyclonon, dieldrin, dienoclo, diethamquat, dietatyl, diethion, diethion, diethofencarb, dietholat, diethon, dietyl pyrocarbonat,

dietyltoluamit, difenacoum, difenoconazol, difenopenten, difenoxuron, difenzoquat, difethialon, diflovidazin, diflubenzuron, diflufenican, diflufenicanil, diflufenzopyr, diflumetorim, dikegulac, dilor, dimatif, dimefluthrin, dimefox, dimefuron, dimehypo, dimepiperat, dimetaclon, dimetan, dimethacarb, dimethaclon, dimethaclo, dimethametryn, dimethenamit, dimethenamit-P, dimethipin, dimethirimol, dimethoat, dimethomorph, dimetrin, dimetyl carbat, dimetyl disulfua, dimetyl phtalat, dimetylvinphos, dimetilan, dimexano, dimidazon, dimoxystrobin, dimpylat, dimuron, dinex, dingjunezuo, diniconazol, diniconazol-M, dinitramin, dinitrophenols, dinobuton, dinocap, dinocap-4, dinocap-6, dinocton, dinofenat, dinopenton, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinosulfon, dinotefuran, dinoterb, dinoterbon, diofenolan, dioxabenzofos, dioxacarb, dioxathion, dioxation, diphaxin, diphaxinon, diphenadion, diphenamit, diphenamit, diphenyl sulfon, diphenylamin, diphenylsulphit, axit diprogulic, dipropalin, dipropetryn, dipterex, dipymetitron, dipyrithion, diquat, disodium tetraborat, disosultap, disparlure, disugran, disul, disulfiram, disulfoton, ditalimfos, dithianon, dithicrofos, dithioether, dithiometon, dithiopyr, diuron, dixanthogen, d-limonen, DMDS, DMPA, DNOC, dodemorph, dodixin, dodin, dofenapyn, doguadin, dominicalure, doramectin, DPC, drazoxolon, DSMA, *d-trans*-allethrin, *d-trans*-resmetrin, dufulin, dymron, EBEP, EBP, ebufos, ecdysteron, eclomezol, EDB, EDC, EDDP, edifenphos, eglinazin, emamectin, EMPC, empentrin, enadenin, endosulfan, endothal, endothall, endothion, endrin, enestroburin, enilconazol, enoxastrobin, ephirsulfonat, EPN, epocholeon, epofenonan, epoxiconazol, eprinomectin, epronaz, EPTC, erbon, ergocalciferol, erlujixiancaoan, esdépalléthrin, esfenvalerat, ESP, esprocarb, etacelasil, etaconazol, etaphos, etem, ethaboxam, ethaclo, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethaproclo, ethephon, ethidimuron, ethiofencarb, ethiolat, ethion, ethiozin, ethiprol, ethirimol, ethoat-metyl, etobenzanid, ethofumesat, etohexadiol, etoprop, etoprophos, etoxyfen, etoxyquin, etoxysulfuron, ethyclozat, etyl format, etyl pyrophosphat, etylan, etyl-DDD, etylen, etylen dibromua, etylen diclorua, etylen oxit, etylicin, etylthủy ngân 2,3-dihydroxypropyl mercaptit, etylthủy ngân axetat, etylthủy ngân bromua, etylthủy ngân clorua, etylthủy ngân phosphat, etinofen, ETM, etnipromid, etobenzanid, etofenprox, etoxazol, etridiazol, etrimfos, étrimphos, eugenol, EXD, famoxadon, famphur, fenac, fenamidon, fenaminosulf, fenaminstrobin, fenamiphos, fenapanil, fenarimol, fenasulam, fenazaflor, fenazaquin, fenbuconazol, fenbutatin oxit, fencloazol, fenclophos, fenclofos, fencloim,

fenethacarb, fenfluthrin, fenfuram, fenhexamit, fenidin, fenitropan, fenitrothion, fénizon, fenjuntong, fenobucarb, fenolovo, fenoprop, fenothiocarb, fenoxacrim, fenoxanil, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxasulfon, fenoxycarb, fenpiclonil, fenpirithrin, fenpropathrin, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fenpyroximat, fenquinotrion, fenridazon, fenson, fensulfothion, fenteracol, fenthiaprop, fenthion, fenthion-etyl, fentiaprop, fentin, fentrazamit, fentrifanil, fenuron, fenuron-TCA, fenvalerat, ferbam, ferimzon, ferric phosphat, ferrous sulfat, fipronil, flamprop, flamprop-M, flazasulfuron, flocoumafen, flometoquin, flonicamit, florasulam, fluacrypyrim, fluazifop, fluazifop-P, fluazinam, fluazolat, fluazuron, flubendiamit, flubenzimin, flubroxythrinat, flucarbazon, flucetosulfuron, flucloalin, flucofuron, fluxycloxuron, fluxythrinat, fludioxonil, fluénéthyl, fluenetil, fluensulfone, flufenaxet, flufenerim, flufenican, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufenprox, flufenpyr, flufenzin, flufiprol, fluhexafon, flumetrin, flumetover, flumetralin, flumetsulam, flumezin, flumicloac, flumioxazin, flumipropyn, flumorph, flometuron, flopicolit, flopyram, florbensit, floridamit, floaxetamit, axit floaxetic, flocloidon, flodifen, floglycofen, floimide, flomit, flomidin, flonitrofen, floxypyr, flothiuron, flotrimazol, floxastrobin, flupoxam, flupropacil, flupropadin, flupropanat, flupyradifuron, flupyrsulfuron, fluquinconazol, fluralaner, flurazol, flurecol, flurenol, fluridon, flurocloidon, fluromidin, fluroxypyr, flurprimidol, flursulamit, flurtamon, flusilazol, flusulfamit, flutenzin, fluthiaxet, fluthiamit, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluvalinate, fluxapyroxad, fluxofenim, folpel, folpet, fomesafen, fonofos, foramsulfuron, forclofenuron, formaldehyt, formetanat, formothion, formparanat, fosamin, fosetyl, fosmethilan, fospirat, fosthiazat, fosthietan, frontalin, fthalit, fuberidazol, fucaojing, fucaomi, fujunmanzhi, fulumi, fumarin, funaihecaoling, fuphenthiourea, furalan, furalaxyl, furametrin, furametpyr, furan tebufenozide, furathiocarb, furcarbanil, furconazol, furconazol-cis, furethrin, furfural, furilazol, furmexyclox, furophanat, furyloxyfen, *gamma*-BHC, *gamma*-xyhalothrin, *gamma*-HCH, genit, axit gibberellic, gibberellin A3, gibberellins, gliftor, glitor, glucocloaloza, glufosinat, glufosinat-P, glyodin, glyoxim, glyphosat, glyphosin, gossyplure, grandlure, griseofulvin, guanoctin, guazatin, halacrinat, halauxifen, halfenprox, halofenozit, halosafen, halosulfuron, haloxydin, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-R, HCA, HCB, HCH, hemel, hempa, HEOD, heptaclo, heptafluthrin, heptenophos, heptopargil, herbimyxin, herbimycin A, heterophos, hexaclo, hexacloan, hexacloaxeton,

hexaclobenzen, hexaclobutadien, hexaclophen, hexaconazol, hexaflumuron, hexafloramin, hexaflurat, hexalure, hexamit, hexazinon, hexylthiofos, hexythiazox, HHDN, holosulf, homobrassinolit, huancaiwo, huanchongjing, huangcaoling, huanjunzuo, hydrametylnon, hydrargaphen, vôi hydrat hóa, hydrogen xyanamit, hydrogen xyanit, hydropren, hydroxyisoxazol, hymexazol, hyquincarb, IAA, IBA, IBP, icaridin, imazalil, imazamethabenz, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazethapyr, imazosulfuron, imibenconazol, imixyafos, imidacloprid, imidaclothiz, iminoctadin, imiprothrin, inabenfit, indanofan, indaziflam, indoxacarb, inezin, đầy infusoria, iodobonil, iodocarb, iodofenphos, iodometan, iodosulfuron, iofensulfuron, ioxynil, ipazin, IPC, ipconazol, ipfencarbazon, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb, iprymidam, ipsdienol, ipsenol, IPSP, IPX, isamidofos, isazofos, isobenzan, isocarbamit, isocarbamit, isocarbophos, isocil, isodrin, isofenphos, isofenphos-metyl, isofetamit, isolan, isomethiozin, isonoruron, isopamphos, isopolinat, isoprocarb, isoprocil, isopropalin, isopropazol, isoprothiolane, isoproturon, isopyrazam, isopyrimol, isothioat, isotianil, isouron, isovaledione, isoxaben, isoxaclotol, isoxadifen, isoxaflutol, isoxapyrifop, isoxathion, isuron, ivermectin, ixoxaben, izopamfos, izopamphos, japonilure, japothrins, jasmolin I, jasmolin II, axit jasmonic, jiahuangchongzong, jiajizengxiaolin, jiaxiangjunzhi, jiecaowan, jiecaoxi, jinganmycin A, jodfenphos, juvenile hormone I, juvenile hormone II, juvenile hormone III, kadethrin, kappa-bifenthrin, kappa-tefluthrin, karbutilate, karetazan, kasugamycin, kejunlin, kelevan, ketospiradox, kieselguhr, kinetin, kinopren, kiralaxyl, kresoxim-metyl, kuicaoxi, lactofen, *lambda*-xyhalotrin, latilure, chì arsenat, lenaxil, lepimectin, leptophos, lianbenjingzhi, vôi lưu huỳnh, lindan, lineatin, linuron, lirimfos, litlure, looplure, lufenuron, lüxiancaolin, lvdingjunzhi, lvfumijvzhi, lvxiancaolin, lythidathion, M-74, M-81, MAA, magiê phosphit, malathion, maldison, maleic hydrazit, malonoben, maltodextrin, MAMA, mancopper, mancozeb, mandestrobin, mandipropamit, maneb, matrin, mazidox, MCC, MCP, MCPA, MCPA-thioetyl, MCPB, MCPP, mebenil, mecarbam, mecarbinzid, mecarphon, mecoprop, mecoprop-P, medimeform, medinoterb, medlure, mefenaxet, mefenoxam, mefenpyr, mefluidid, axit megatomoic, melissyl rượu, melitoxin, MEMC, menazon, MEP, mepanipyrim, meperflutrin, mephenat, mephosfolan, mepiquat, mepronil, meptyldinocap, mercaptodimethur, mercaptophos, mercaptophos thiol, mercaptothion, thủy ngân clorua, thủy ngân oxit, thủy ngân clorua, merphos, merphos

oxit, mesoprazin, mesosulfuron, mesotrion, mesulfen, mesulfenfos, mesulphen, metacresol, metaflumizon, metalaxyl, metalaxyl-M, metaldehyt, metam, metamifop, metamitron, metaphos, metaxon, metazaclor, metazosulfuron, metazoxolon, metconazol, metepa, metflurazon, metabenzthiazuron, metacrifos, metalpropalin, metam, metamitophos, metasulfocarb, metazol, methfuroxam, metibenzuron, metidathion, metiobencarb, metiocarb, metiopyrisulfuron, metiotepa, metiozolin, metiuron, metocrotophos, metolcarb, metometon, metomyl, metopren, metoprotryn, metoprotryn, metoquin-butyl, metotrin, metoxyclor, metoxyfenozit, metoxyphenon, metyl apholat, metyl bromit, metyl eugenol, metyl iodua, metyl isothioxyanat, metyl parathion, metylaxetophos, metylcloroform, axit metyldithiocarbamic, metyldymron, metylen clorua, metyl-isofenphos, metylmercaptophos, metylmercaptophos oxit, metylmercaptophos thiol, thủy ngân metyl benzoat, thủy ngân metyl dixyandiamit, thủy ngân metyl pentaclophenoxit, metylneodecanamit, metylnitrophos, metyltriazothion, metiozolin, metiram, metiram-kẽm, metobenzuron, metobromuron, metoflutrin, metolaclor, metolcarb, metometuron, metominostrobin, metosulam, metoxadiazon, metoxuron, metrafenon, metriam, metribuzin, metrifonat, metriphonat, metsulfovax, metsulfuron, mevinphos, mexacarbat, miechuwei, mieshuan, miewenjuzhi, milbemectin, milbemyxin oxim, milneb, mima2nan, mipafox, MIPC, mirex, MNAF, moguchun, molinat, molosultap, momflotrin, monalit, monisuron, monoamitraz, axit monocloaxetic, monocrotophos, monolinuron, monomehypo, monosulfiram, monosulfuron, monosultap, monuron, monuron-TCA, morfamquat, moroxydin, morphothion, morzid, moxitctin, MPMC, MSMA, MTMC, muscalure, myclobutanil, myclozolin, rượu myrixyl, N-(thủy ngân etyl)-p-toluensulphonanilit, NAA, NAAm, nabam, naftalofos, naled, naphtalen, naphtalenaxetamit, naphtalic anhydrit, naphtalophos, axit naphtoxyaxetic, axit naphtylaxetic, naphtylindan-1,3-diones, axit naphtyloxyaxetic, naproanilit, napropamit, napropamit-M, naptalam, natamyxin, NBPOS, neburea, neburon, nendrin, neonicotin, niclorfos, niclofen, niclosamit, nicobifen, nicosulfuron, nicotin, nicotin sulfat, nifluridide, nikkomyxins, NIP, nipyraclofen, nipyralofen, nitenpyram, nithiazin, nitralin, nitrapyrin, nitrilacarb, nitrofen, nitroflofen, nitrostyren, nitrothal-isopropyl, nobormit, nonanol, norbormit, norea, norflurazon, nornicotin, noruron, novaluron, noviflumuron, NPA, nuarimol, nuranon, OCH, octaclodipropyl ete, octhilinon, *o*-diclobenzen, ofurace, ometoat, *o*-phenylphenol, orbencarb, orfralure, orthobencarb, ortho-diclobenzen,

orthosulfamuron, oryctalure, orysastrobin, oryzalin, osthol, osthol, ostramon, ovatron, ovex, oxabetrinil, oxadiargyl, oxadiazon, oxadixyl, oxamat, oxamyl, oxapyrazon, oxapyrazon, oxasulfuron, oxathiapiprolin, oxaziclomefon, oxin-đồng, oxin-Cu, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, oxydemeton-metyl, oxydeprofos, oxydisulfoton, oxyenadenin, oxyflofen, oxymatrin, oxytetraxyclin, oxythioquinox, PAC, paclobutrazol, paichongding, palletrin, PAP, para-diclobenzen, parafluron, paraquat, parathion, parathion-metyl, parinol, Paris xanh lá cây, PCNB, PCP, PCP-Na, *p*-diclobenzen, PDJ, pebulat, pedinex, pefurazoat, axit pelargonic, penconazol, penxycuron, pendimetalin, penfenat, penflufen, penfluron, penoxalin, penoxsulam, pentaclophenol, pentaclophenyl laurat, pentanoclor, penthiopyrad, pentmetrin, pentoxazon, perclordecon, perfluidon, permetrin, petoxamit, PHC, phenamacril, phenamacril-etyl, phenaminosulf, phenazin oxit, phenetacarbe, phenisopham, phenkapton, phenmedipham, phenmedipham-etyl, phenobenzuron, phenothiol, phenotrin, phenproxit, phenthoat, thủy ngân phenyl ure, thủy ngân phenyl axetat, thủy ngân phenyl clorua, dẫn xuất thủy ngân phenyl của pyrocatechol, thủy ngân phenyl nitrat, thủy ngân phenyl salixylat, phorat, phosaxetim, phosalon, phosametin, phosazetim, phosazetin, phosxyclotin, phosdiphen, phosetyl, phosfolan, phosfolan-metyl, phosglyxin, phosmet, phosniclor, phosphamit, phosphamiton, phosphin, phosphinothrixin, phosphocarb, phosphorus, phostin, phoxim, phoxim-metyl, phthalit, phthalophos, phthaltrin, picarbutrazox, picaridin, picloram, picolinafen, picoxystrobin, pimarixin, pindon, pinoxaden, piperalin, piperazin, piperonyl butoxit, piperonyl xyclonen, piperophos, piproctanly, piproctanyl, piprotal, pirimetaphos, pirimicarb, piriminil, pirimioxyphos, pirimiphos-etyl, pirimiphos-metyl, pival, pivaldion, plifenat, PMA, PMP, polybuten, polycarbamat, polyclorcamphen, polyetoxyquinolin, polyoxin D, polyoxin, polyoxorim, polythialan, kali arsenit, kali azit, kali xyanat, kali etylxantat, kali naphtenat, kali polysulfit, kali thioxyanat, pp'-DDT, pralletrin, precoxen I, precoxen II, precoxen III, pretilaclor, primidophos, primisulfuron, probenazol, procloraz, proclonol, proxyazin, proxymidon, prodiamin, profenofos, profluazol, profluralin, proflutrin, profoxydim, profurit-amin, proglinazin, prohexadion, prohydrojasmon, promaxyl, promecarb, prometon, prometryn, prometryn, promurit, pronamit, propaclor, propafos, propamitin, propamocarb, propanil, propaphos, propaquizafop, propargit, propartrin, propazin, propetamphos, propham, propiconazol, propidin, propineb, propisoclor, propoxur, propoxycarbazon, đồng phân propyl,

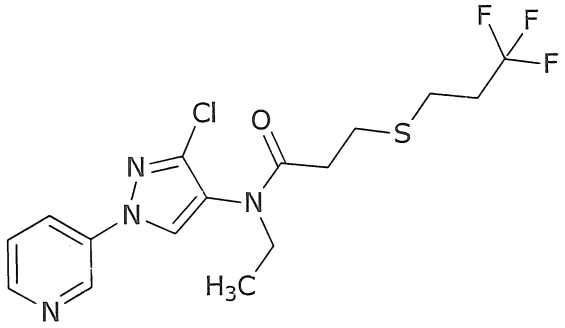
propyrisulfuron, propyzamit, proquinazid, prosuler, prosulfalin, prosulfocarb, prosulfuron, prothidathion, prothiocarb, prothioconazol, prothiofos, prothoat, protrifenbute, proxan, prymidophos, prynaclor, psoralen, psoralene, pydanon, pyflubumit, pymetrozin, pyracarbolid, pyraclofos, pyraclonil, pyraclostrobin, pyraflufen, pyrafluprol, pyramat, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrasulfotol, pyraziflumid, pyrazolat, pyrazolynat, pyrazon, pyrazophos, pyrazosulfuron, pyrazothion, pyrazoxyfen, pyresmetrin, pyretrin I, pyretrin II, pyretrins, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribencarb, pyribenzoxim, pyributicarb, pyriclor, pyridaben, pyridafol, pyridalyl, pyridaphenthion, pyridaphenthion, pyridat, pyridinitril, pyrifenox, pyrifluquinazon, pyriftalid, pyrimétaphos, pyrimetanil, pyrimicarbe, pyrimidifen, pyriminobac, pyriminostrobin, pyrimiphos-etyl, pyrimiphos-metyl, pyrimisulfan, pyrimitat, pyrinuron, pyriofenon, pyriprol, pyripropanol, pyriproxyfen, pyrisoxazol, pyrithiobac, pyrolan, pyroquilon, pyroxasulfon, pyroxsulam, pyroxyclor, pyroxyfur, qincaosuan, qingkuling, quassia, quinaxetol, quinalphos, quinalphos-metyl, quinazamit, quinclorac, quinconazol, quinmerac, quinoclamin, quinometionat, quinonamit, quinothion, quinoxyfen, quintiofos, quintozen, quizalofop, quizalofop-P, quwenzhi, quyingding, rabenzazol, rafoxanit, R-diniconazol, rebemit, reglon, renriduron, rescalure, resmetrin, rhodetanil, rhodojaponin-III, ribavirin, rimsulfuron, rizazole, R-metalaxyl, rodéthanil, ronnel, rotenon, ryania, sabadilla, saflufenaxil, saijunmao, saisentong, salixylanilit, saliflofen, sanguinarine, santonin, S-bioalletrin, schradan, sxillirosit, sebutylazin, secbumeton, sedaxan, selamectin, semiamitraz, sesamex, sesamolin, seson, setoxydim, sevin, shuangjiaancaolin, shuangjianancaolin, S-hydroprene, siduron, sifumijvzhi, siglure, silaflofen, silatran, silica aerogel, silica gel, silthiofam, silthiopham, silthiophan, silvex, simazin, simeconazole, simeton, simetryn, simetryn, sintofen, S-kinopren, vôi đã tôi, SMA, S-metopren, S-metolaclor, natri arsenit, natri azit, natri clorat, natri xyanua, natri floit, natri floaxetat, natri hexaflosilicat, natri naphtenat, natri o-phenylphenoxit, natri orthophenylphenoxit, natri pentaclophenat, natri pentaclophenoxit, natri polysulfit, natri silicflorua, natri tetrathiocarbonat, natri thioxyanat, solan, sophamit, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, spiroxamin, stirofos, streptomyxin, strychnin, sulcatol, sulcofuron, sulcotrion, sulfallat, sulfentrazon, sulfiram, sulfluramit, sulfodiazol, sulfometuron, sulfosat, sulfosulfuron, sulfotep, sulfotepp, sulfoxaflor, sulfoxit, sulfoxim, lưu huỳnh, axit sulfuric, sulfuryl floide, sulglycapin,

sulphosat, sulprofos, sultropen, swep, *tau*-fluvalinat, tavron, tazimcarb, TBTO, TBZ, TCA, TCBA, TCMTB, TCNB, TDE, tebuconazol, tebufenozit, tebufenpyrad, tebufloquin, tebupirimfos, tebutam, tebuthiuron, tecloftalam, tecnazen, tecoram, tedion, teflubenzuron, teflutrin, tefuryltrion, tembotrion, temefos, temephos, tepa, TEPP, tepraloxydim, teproloxydim, teralletrin, terbaxil, terbucarb, terbuclor, terbufos, terbumeton, terbutylazin, terbutol, terbutryn, terbutryn, terraclor, terramixin, terramyxin, tetxyclacis, tetracloetan, tetraclorvinphos, tetraconazol, tetradifon, tetradisul, tetrafluron, tetrametrin, tetrametylflutrin, tetramin, tetranactin, tetraniliprol, tetrapion, tetrasul, thallium sulfat, thallous sulfat, thenylclor, *theta*-xypermetrin, thiabendazol, thiacloprid, thiadiazin, thiadiflo, thiametoxam, thiameturon, thiapronil, thiazafluron, thiazfluron, thiazon, thiazopyr, thicrofos, thixyofen, thidiazimin, thidiazuron, thiencarbazon, thifensulfuron, thifluzamit, thimerosal, thimet, thiobencarb, thiocarboxim, thioclorfenphim, thioclorphenphim, thioxyanatodinitrobenzens, thioxyclam, thiodan, thiodiazole-đồng, thiodicarb, thiofanocarb, thiofanox, thiofloximat, thiohempa, thiomersal, thiometon, thionazin, thiophanat, thiophanat-etyl, thiophanat-metyl, thiophos, thioquinox, thiosemicarbazit, thiosultap, thiotepa, thioxamyl, thiram, thiuram, thuringiensin, tiabendazol, tiadinil, tiafenaxil, tiaojiean, TIBA, tifatol, tiocarbazil, tioclorim, tioxazafen, tioxymid, tirpat, TMTD, tolclofos-metyl, tolfenpyrad, tolprocarb, tolpyralat, tolyfluanid, tolylfluanid, tolylthủy ngân axetat, tomarin, topramezon, toxaphen, TPN, tralkoxydim, traloxytrin, tralometrin, tralopyril, transflutrin, transpermetrin, tretamin, triacontanol, triadimefon, triadimenol, triafamon, triallat, tri-allat, triamiphos, triapenthenol, triarathen, triarimol, triasulfuron, triazamat, triazbutil, triaziflam, triazophos, triazothion, triazoxit, tri đồng bazơ clorua, tri đồng bazơ sulfat, tribenuron, tribufos, tributyltin oxit, tricamba, trichlamit, triclopyr, triclorfon, triclormetaphos-3, triclonat, triclonat, triclotrinitrobenzen, triclorphon, triclopyr, triclopyricarb, tricresol, trixyclazol, trixyclohexyltin hydroxit, tridemorph, tridiphan, trietazin, trifenmorph, trifenofos, trifloxystrobin, trifloxysulfuron, trifludimoxazin, triflumezopyrim, triflumizol, triflumuron, trifluralin, triflusulfuron, trifop, trifopsim, triforin, trihydroxytriazin, trimedlure, trimetacarb, trimeturon, trinexapac, triphenyltin, tripren, tripropindan, triptolit, tritac, trithialan, triticonazol, tritosulfuron, trunc-call, tuoyelin, uniconazol, uniconazol-P, urbacide, uredepa, valerat, validamyxin, validamyxin A, valifenalat, valon, vamitothion, vangard, vaniliprol, vernolat, vinclozolin, vitamin D3,

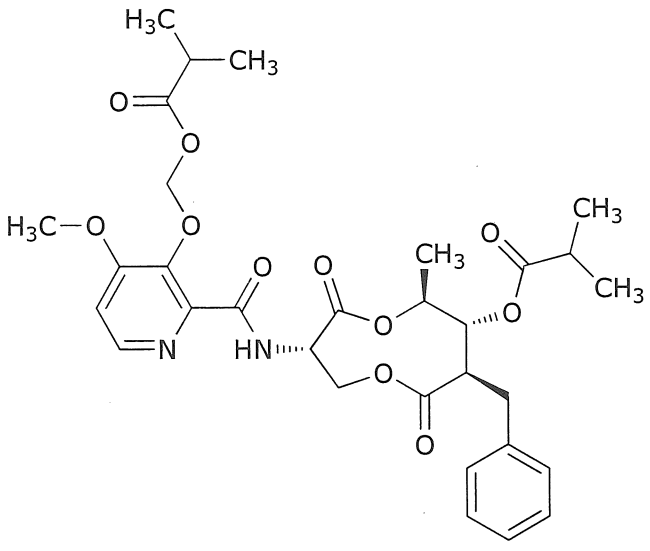
warfarin, xiaochongliulin, xinjunan, xiwojunan, xiwojunzhi, XMC, xylaclor, xylenols, xylylcarb, xymiazol, yishijing, zarilamit, zeatin, zengxiaoan, zengxiaolin, *zeta*-xypermetrin, kẽm naphtenat, kẽm phosphit, kẽm thiazol, kẽm thiozol, kẽm triclophenat, kẽm triclophenoxit, zineb, ziram, zolaprofos, zoocoumarin, zoxamit, zuoanjunzhi, zuocaoan, zuojunzhi, zuomihuanglong, α-clohydrin, α-ecdyson, α-multistriatin, axit α-naphtalenaxetic, và β-ecdyson;

(2)các hợp chất sau đây

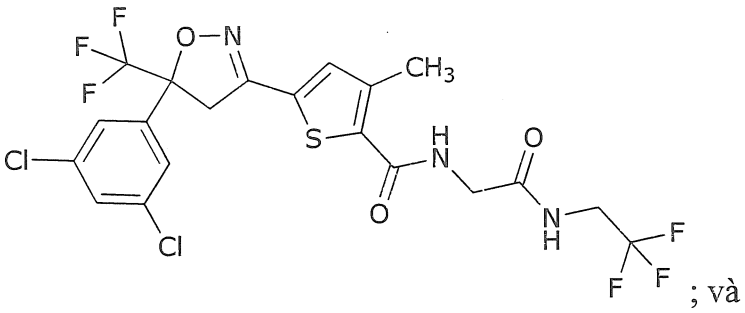
(a) n-(3-clo-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-4-yl)-N-etyl-3-((3,3,3-triflopropyl)thio) propanamit (sau đây được gọi là "AI-1")



(b)(3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-8-benzyl-3-(3-((isobutyryloxy)metoxy)-4-metoxypicolinamido)-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl isobutyrat (sau đây được gọi là "AI-2")



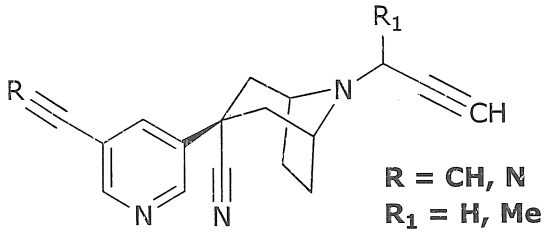
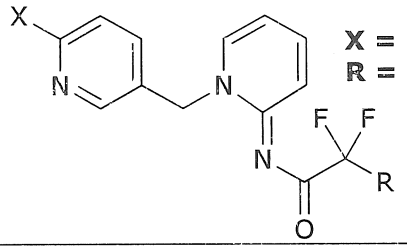
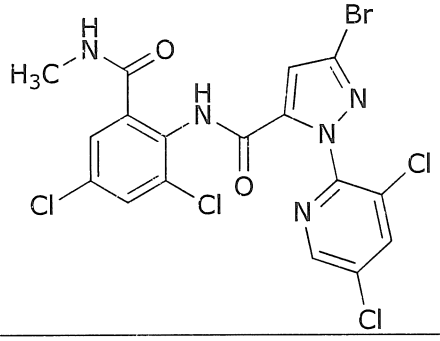
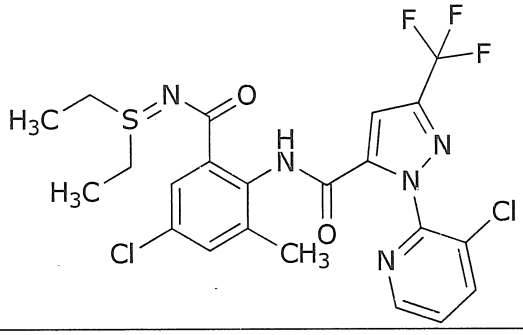
(3)hợp chất đã biết là Lotilaner có cấu trúc sau

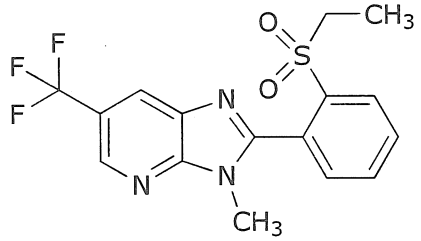
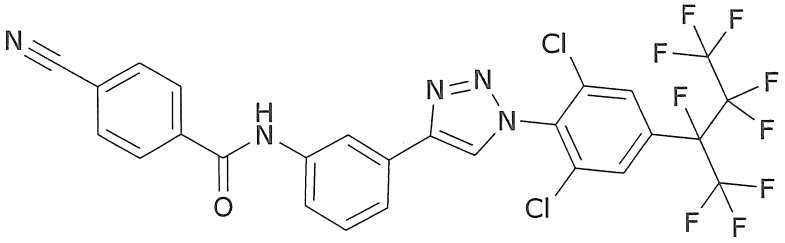


; và

(4)các hợp chất sau trên Bảng A

Bảng A - Cấu trúc là M# - các hoạt chất

M#	Cấu trúc
M1	 **R = CH, N** **R_1 = H, Me**
M2	 **X = F, Cl** **R = H, F**
M3	
M4	

M5	
M6	

Như được sử dụng trong phần mô tả này, mỗi cấu trúc nêu trên là hoạt chất. Để biết thêm thông tin tham khảo "Compendium of Pesticide Common Names" trên Alanwood.net và các phiên bản khác, bao gồm phiên bản trực tuyến, là "The Pesticide Manual" được đặt trên bcpcdata.com.

Các hoạt chất ưu tiên chọn cụ thể là 1,3 dicloropen, clopyrifos, hexaflumuron, metoxyfenozit, noviflumuron, spinetoram, spinosad, và sulfoxaflor (sau đây được gọi là "AIGA-2").

Ngoài ra, các hoạt chất khác ưu tiên chọn cụ thể là axequinoxyl, axetamiprid, axetoprol, avermectin, azinphos-metyl, bifenazat, bifenthrin, carbaryl, carbofuran, clofenapyr, clofluazuron, chromafenozit, clothianidin, xyfluthrin, xypermetrin, deltametrin, diafenthiuron, emamectin benzoat, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etoxazol, fipronil, flonicamit, fluacrypyrim, *gamma*-xyhalothrin, halofenozit, indoxacarb, *lambda*-xyhalothrin, lufenuron, malathion, metomyl, novaluron, permetrin, pyridalyl, pyrimidifen, spirodiclofen, tebufenozit, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, tolfenpyrad, và *zeta*-cypermetrin (sau đây được gọi là "AIGA-3").

Thuật ngữ "alkenyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế phân nhánh hoặc không phân nhánh, không no (ít nhất một liên kết đôi cacbon-cacbon), không phải dạng vòng, bao gồm cacbon và hydro, ví dụ, vinyl, allyl, butenyl, pentenyl, và hexenyl.

Thuật ngữ "alkenyloxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ alkenyl còn bao gồm liên kết đơn cacbon-oxy, ví dụ, allyloxy, butenyloxy, pentenyloxy, hexenyloxy.

Thuật ngữ "alkoxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ alkyl còn bao gồm liên kết đơn cacbon-oxy, ví dụ, metoxy, etoxy, propoxy, isopropoxy, butoxy, isobutoxy, và tertbutoxy.

Thuật ngữ "alkyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế phân nhánh hoặc không phân nhánh, no, không phải dạng vòng bao gồm cacbon và hydro, ví dụ, metyl, etyl, propyl, isopropyl, butyl, và tertbutyl.

Thuật ngữ "alkynyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế phân nhánh hoặc không phân nhánh, không no (ít nhất một liên kết ba cacbon-cacbon), không phải dạng vòng, bao gồm cacbon và hydro, ví dụ, etynyl, propargyl, butynyl, và pentynyl.

Thuật ngữ "alkynyloxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ alkynyl còn bao gồm liên kết đơn cacbon-oxy, ví dụ, pentynyloxy, hexynyloxy, heptynyloxy, và octynyloxy.

Thuật ngữ "aryl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế thơm, có dạng vòng, bao gồm hydro và carbon, ví dụ, phenyl, naphtyl, và biphenyl.

Thuật ngữ "thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ tác nhân kiểm soát sinh vật gây hại vi sinh mà, thông thường, được áp dụng theo cách tương tự như thuốc diệt sinh vật gây hại hóa học. Chúng thường là vi khuẩn, nhưng cũng có ví dụ là tác nhân kiểm soát nấm, bao gồm *Trichoderma* spp. và *Ampelomyces quisqualis*. Một ví dụ về thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học đã biết là *loài Bacillus*, bệnh vi khuẩn của cánh vẩy (Lepidoptera), cánh cứng (Coleoptera), và hai cánh (diptera). Thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm các sản phẩm có nguồn gốc từ nấm côn trùng (entomopathogenic fungi) (*ví dụ Metarhizium anisopliae*), giun tròn ký sinh và gây bệnh cho côn trùng (entomopathogenic nematodes) (*ví dụ Steinernema feltiae*), và virut gây bệnh cho côn trùng (entomopathogenic virutes) (*ví dụ. Cydia pomonella* granulovirut). Các ví dụ khác về sinh vật gây bệnh cho côn trùng bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, baculovirut, động vật nguyên sinh, và Microsporidia. Để tránh nghi ngờ, thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học là hoạt chất.

Thuật ngữ "xycloalkenyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế có dạng đơn vòng hoặc dạng đa vòng, không no (ít nhất một liên kết đôi cacbon-cacbon) bao gồm

cacbon và hydro, ví dụ, xyclobutenyl, xyclopentenyl, xyclohexenyl, norbornenyl, bixyclo[2,2,2]octenyl, tetrahydronaphtyl, hexahydronaphtyl, và octahydronaphtyl.

Thuật ngữ "xycloalkenyloxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ xycloalkenyl còn bao gồm liên kết đơn cacbon-oxy, ví dụ, xyclobutenyloxy, xyclopentenyloxy, norbornenyloxy, và bixyclo[2,2,2]octenyloxy.

Thuật ngữ "xycloalkyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế có dạng đơn vòng hoặc đa vòng, no bao gồm cacbon và hydro, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, norbornyl, bixyclo[2,2,2]octyl, và decahydronaphtyl.

Thuật ngữ "xycloalkoxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ xycloalkyl còn bao gồm liên kết đơn cacbon-oxy, ví dụ, xyclopropyloxy, xyclobutyloxy, xyclopentyloxy, norbornyloxy, và bixyclo[2,2,2]octyloxy.

Thuật ngữ "halo" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ flo, clo, brom, và iot.

Thuật ngữ "haloalkoxy" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ alkoxy còn bao gồm, từ một đến tối đa số nhóm halogen có thể có giống hoặc khác nhau, ví dụ, flometoxy, triflometoxy, 2,2-diflopropoxy, clometoxy, triclometoxy, 1,1,2,2-tetrafloetoxy, và pentafloetoxy.

Thuật ngữ "haloalkyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ alkyl còn bao gồm, từ một đến tối đa số nhóm halogen có thể giống hoặc khác nhau, ví dụ, flometyl, triflometyl, 2,2-diflopropyl, clometyl, triclometyl, và 1,1,2,2-tetrafloetyl.

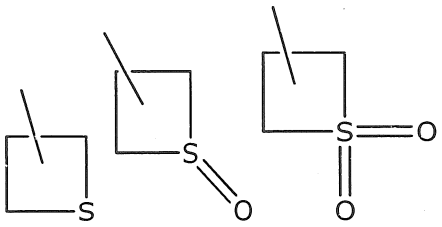
Thuật ngữ "heterocyclyl" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ nhóm thế có dạng vòng mà có thể là nhóm thơm, no hoàn toàn, hoặc không no một phần hoặc hoàn toàn, mà cấu trúc dạng vòng chứa ít nhất một nguyên tử cacbon và ít nhất một nguyên tử khác loại, mà nguyên tử khác loại là nitơ, lưu huỳnh, hoặc oxy. Các ví dụ là:

(1) nhóm thế thơm dị vòng bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, benzofuranyl, benzoisothiazolyl, benzoisoxazolyl, benzothienyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, xinnolinyl, furanyl, imidazolyl, indazolyl, indolyl, isoindolyl, isoquinolinyl, isothiazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, oxazolinyl, oxazolyl, phtalazinyl, pyrazinyl, pyrazolinyl, pyrazolyl, pyridazinyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrolyl, quinazolinyl, quinolinyl, quinoxalinyl, tetrazolyl, thiazolinyl, thiazolyl, thienyl, triazinyl, và triazolyl;

(2) nhóm thế dị vòng no hoàn toàn bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, piperazinyl, piperidinyl, morpholinyl, pyrolidinyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiophenyl-oxit, tetrahydrothiophenyl-dioxit;

(3) nhóm thế dị vòng không no một phần hoặc hoàn toàn bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, 4,5-dihydro-isoxazolyl, 4,5-dihydro-oxazolyl, 4,5-dihydro-1*H*-pyrazolyl, 2,3-dihydro-[1,3,4]-oxadiazolyl, 2,5-dioxoimidazolidinyl, 2,4-dioxo-1,3-diazaspiro[4,4]nonanylisoxazolidinonyl, oxazolidinonyl, imidazolidinonyl, isoxazolidinonyl, pyrolidinonyl, 1,2,3,4-tetrahydro-quinolinyl, và thioxothiazolidinonyl; và

(4)Các ví dụ bổ sung về các nhóm dị vòng bao gồm như sau:



thietanyl thietanyl-oxitvàthietanyl-dioxit.

Thuật ngữ "khu vực cần kiểm soát" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ môi trường sống, môi trường chăn nuôi, thực vật, hạt, đất, vật liệu, hoặc môi trường, mà trong đó sinh vật gây hại đang sinh trưởng, có thể sinh trưởng, hoặc có thể đi ngang qua. Ví dụ, khu vực cần kiểm soát có thể là: nơi mà cây trồng, cây lấy gỗ, cây ăn quả, ngũ cốc, loài cỏ cho gia súc, cây dây leo, lớp đất có cỏ, và/hoặc cây cảnh, đang sinh trưởng; nơi mà động vật nuôi trú ngụ; bề mặt bên trong hoặc bên ngoài của các tòa nhà (như nơi cất giữ thóc lúa); vật liệu xây dựng được sử dụng sử dụng trong các tòa nhà (như gỗ đã ngâm tẩm); và đất xung quanh các tòa nhà.

Thuật ngữ "hoạt chất MoA" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ hoạt chất có cách hoạt động ("MoA") được chỉ ra trong IRAC MoA Classification v. 7.3, ở trên irac-online.org., mà mô tả các nhóm sau đây.

(1) hợp chất ức chế axetylcolinsteraza (AChE), bao gồm các hoạt chất sau đây alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox,

triazamat, trimetacarb, XMC, xylylcarb, axephat, azamethiphos, azinphos-etyl, azinphos-metyl, cadusafos, cloetoxyfos, clofenvinphos, clomephos, clopyrifos, clopyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, diclovos/DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazat, heptenophos, imixyafos, isofenphos, isopropyl *O*-(metoxyaminothio-phosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetraclovinphos, thiometon, triazophos, triclofon, vamidothion.

(2) hợp chất đối kháng kênh clorua có cổng GABA, bao gồm các hoạt chất sau clodan, endosulfan, ethiprol, và fipronil.

(3) hợp chất điều hòa kênh natri, bao gồm các hoạt chất sau đây acrinathrin, alletrin, *d-cis-trans* alletrin, *d-trans* alletrin, bifenthrin, bioalletrin, bioalletrin S-xyclopentenyl, bioresmetrin, xycloprothrin, xyflutrin, *beta*-xyflutrin, xyhalothrin, *lambda*-xyhalothrin, *gamma*-xyhalothrin, xypermetrin, *alpha*-xypermetrin, *beta*-xypermetrin, *theta*-xypermetrin, *zeta*-xypermetrin, xyphenothrin [(Các chất đồng phân trans 1*R*)], deltametrin, empentrin [các chất đồng phân(*EZ*)-(1*R*)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, fluxythrinat, flumetrin, *tau*-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadetrin, permetrin, phenothrin [chất đồng phân trans (1*R*)], pralletrin, pyretrin (pyretrum), resmetrin, silafluofen, teflutrin, tetrametrin, tetrametrin [các chất đồng phân (1*R*)], tralometrin, và transflutrin, và metoxyclo.

(4) hợp chất chủ vận thụ thể nicotinic axetylcolin (nAChR), bao gồm các hoạt chất sau đây

(4A)axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiaxloprid, thiametoxam,

(4B) nicotin,

(4C)sulfoxaflor,

(4D)flupyradifuron,

(4E)triflumezopyrim và diclomezotiaz.

(5) hợp chất hoạt hóa ở vị trí khác trên thụ thể nicotinic axetylcolin (nAChR), bao gồm các hoạt chất sau spinetoram và spinosad.

(6) hợp chất hoạt hóa kênh clorua, bao gồm các hoạt chất sau abamectin, emamectin benzoat, lepimectin, và milbemectin.

(7) hợp chất tương tự hoocmon trẻ, bao gồm các hoạt chất sau hydropren, kinopren, metopren, fenoxycarb, và pyriproxyfen.

(8) hợp chất ức chế không đặc hiệu khác nhau (đa vị trí), bao gồm các hoạt chất sau metyl bromua, clopicrin, sulfuryl florua, borax, và tartar emetic.

(9) hợp chất điều hòa cơ quan dây âm, bao gồm các hoạt chất sau pymetrozin và flonicamit.

(10) hợp chất ức sự sinh trưởng của mạt, bao gồm các hoạt chất sau đây clofentezin, hexythiazox, diflovidazin, và etoxazol.

(11) hợp chất phá vỡ vi khuẩn màng ruột giữa của côn trùng, bao gồm các hoạt chất sau *Vi khuẩn gram dương* subsp. *Israelensis, Vi khuẩn gram dương* subsp. a*izawai*, *Vi khuẩn gram dương* subsp. *Kurstaki, Vi khuẩn gram dương* subsp. *tenebrionenis*, các protein cây trồng Bt (Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/Cry35Ab1), và *Bacillus sphaericus*.

(12) hợp chất ức chế ATP syntaza trong ty thể, bao gồm các hoạt chất sau tetradifon, propargit, azoxyclotin, xyhexatin, fenbutatin oxit, và diafenthiuron.

(13) hợp chất không ghép đôi của sự phospharyl hóa oxi hóa qua việc phá vỡ của gradien proton, bao gồm các hoạt chất sau clofenapyr, DNOC, và sulfluramit.

(14) hợp chất phong bế kênh thụ thể axetylcolin nicotin (nAChR), bao gồm các hoạt chất sau bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và natri thiosultap.

(15) hợp chất ức chế sinh tổng hợp chitin, kiểu 0, bao gồm các hoạt chất sau bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, và triflumuron.

(16) hợp chất ức chế sinh tổng hợp chitin, kiểu 1, bao gồm hoạt chất buprofezin sau đây.

(17) hợp chất phá vỡ quy trình lột xác của côn trùng hai cánh, bao gồm hoạt chất sau xyromazin.

(18) hợp chất chủ vận của thụ thể ecdyson, bao gồm hoạt chất sau chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit, và tebufenozit.

(19) hợp chất chủ vận của thụ thể octopamin, bao gồm hoạt chất sau amitraz.

(20) hợp chất ức chế vận chuyển electron phức III của ty thể, bao gồm các hoạt chất sau hydrametylnon, axequinocyl, và fluacrypyrim.

(21) hợp chất ức chế vận chuyển electron phức I của ty thể, bao gồm các hoạt chất sau fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, và rotenon.

(22) hợp chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện áp, bao gồm các hoạt chất sau indoxacarb và metaflumizon.

(23) hợp chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, bao gồm các hoạt chất sau spirodiclofen, spiromesifen, và spirotetramat.

(24) hợp chất ức chế vận chuyển electron phức IV của ty thể, bao gồm các hoạt chất sau, nhôm phosphit, canxi phosphit, phosphin, kẽm phosphit, và xyanit.

(25) hợp chất ức chế vận chuyển electron phức II của ty thể, bao gồm các hoạt chất sau xyenopyrafen và xyflumetofen. và

(28) hợp chất điều hòa thụ thể ryanodin, bao gồm các hoạt chất sau cloantraniliprol, xyantraniliprol, và flubendiamit.

Các nhóm 26 và 27 không được xác định trong phiên bản của sơ đồ phân loại này. Ngoài ra, có Nhóm UN mà chứa các hoạt chất theo cách hoạt động chưa biết hoặc không chắc chắn. Nhóm này bao gồm các hoạt chất sau, azadirachtin, benzoximat, bifenazat, brompropylat, chinomethionat, cryolit, dicofol, pyridalyl, và pyrifluquinazon.

Thuật ngữ "sinh vật gây hại" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ sinh vật làm thiệt hại cho người, hoặc liên quan đến người (như, cây trồng, thực phẩm, vật nuôi, v.v...), nơi có sinh vật đã nêu từ ngành chân khớp, ngành thân mềm, hoặc ngành Giun tròn. Các ví dụ cụ thể là are kiến, rệp cây, rệp giường, bọ cánh cứng, bọ dài đuôi, sâu bướm, gián, dế, sâu tai, bọ chét, ruồi, châu chấu, giòi, ong bắp cày, ong châm, bọ rầy

xanh, rận, châu chấu, ấu trùng ruồi, mạt, nhậy, giun tròn, rầy, rệp lá, ong cắn lá, rệp cây, bọ bạc, sên đất, ốc sên, nhện, bọ đuôi bật, bọ xít, rết tơ (Symphyla) n (lớp rết tơ), mối, bọ trĩ, ve, ong bắp cày, ruồi trắng, và bọ bổ củi.

Các ví dụ bổ sung là sinh vật gây hại thuộc

(1) phân ngành là động vật chân kìm (Chelicerata), nhiều chân (Myriapoda), và sáu chân (Hexapoda).

(2) các lớp là hình nhện (Arachnida), rết tơ (Symphyla), và côn trùng (Insecta).

(3) bộ chấy rận (Anoplura). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Haematopinus* spp., *Hoplopleura* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Polyplax* spp., *Solenopotes* spp., và *Neohaematopinis* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Haematopinus asini*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Linognathus ovillus*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus*, và *Pthirus pubis*.

(4) bộ cánh cứng (Coleoptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acanthoscelides* spp., *Agriotes* spp., *Anthonomus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Araecerus* spp., *Aulacophora* spp., *Bruchus* spp., *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp., *Ceutorhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *xyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Dinoderus* spp., *Gnathocerus* spp., *Hemicoelus* spp., *Heterobostruchus* spp., *Hypera* spp., *Ips* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Meligethes* spp., *Mezium* spp., *Niptus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Ptinus* spp., *Rhizotrogus* spp., *Rhynchites* spp., *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp., *Tenebrio* spp., and *Tribolium* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acanthoscelides obtectus*, *Agrilus planipennis*, *Ahasverus advena*, *Alphitobius diaperinus*, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus verbasci*, *Anthrenus falvipes*, *Ataenius spretulus*, *Atomaria linearis*, *Attagenus unicolor*, *Bothynoderes punctiventris*, *Bruchus pisorum*, *Callosobruchus maculatus*, *Carpophilus hemipterus*, *Cassida vittata*, *Cathartus quadricollis*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus napi*, *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmosus*, *Conotrachelus nenuphar*, *Cotinis nitida*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes*

ferrugineus, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptolestes turcicus*, *Cylindrocopturus adspersus*, *Deporaus marginatus*, *Dermestes lardarius*, *Dermestes maculatus*, *Epilachna varivestis*, *Euvrilletta peltata*, *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus hampei*, *Lasioderma serricorne*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius canus*, *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lophocateres pusillus*, *Lyctus planicollis*, *Maecolaspis joliveti*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Necrobia rufipes*, *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus mercator*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Phyllophaga cuyabana*, *Polycaon stoutti*, *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*, *Tenebroides mauritanicus*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma granarium*, *Trogoderma variabile*, *Xestobium rufovillosum*, và *Zabrus tenebrioides*.

(5) bộ cánh da (Dermaptera). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Forficula auricularia*.

(6) bộ gián (Blattaria). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Blatta orientalis*, *Blatta lateralis*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pycnoscelus surinamensis*, và *Supella longipalpa*.

(7) họ hai cánh (diptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., *Bactrocera* spp., *Ceratitis* spp., *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Dasineura* spp., *Delia* spp., *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Hylemya* spp., *Liriomyza* spp., *Musca* spp., *Phorbia* spp., *Pollenia* spp., *Psychoda* spp., *Simulium* spp., *Tabanus* spp., và *Tipula* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Agromyza frontella*, *Anastrepha suspensa*, *Anastrepha ludens*, *Anastrepha obliqua*, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens*, *Bactrocera zonata*, *Ceratitis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platura*, *Fannia canicularis*, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hypoderma lineatum*, *Liriomyza brassicae*, *Melophagus*

ovinus, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya betae*, *Piophila casei*, *Psila rosae*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Rhagoletis mendax*, *Sitodiplosis mosellana*, và *Stomoxys calcitrans*.

(8) bộ cánh nửa. Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Adelges* spp., *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Ceroplastes* spp., *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Empoasca* spp., *Euschistus* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lagynotomus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nephotettix* spp., *Nezara* spp., *Nilaparvata* spp., *Philaenus* spp., *Phytocoris* spp., *Piezodorus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Triatoma* spp., và *Unaspis* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acrosternum hilare*, *Acyrthosiphon pisum*, *Aleyrodes proletella*, *Aleurodicus dispersus*, *Aleurothrixus floccosus*, *Amrasca biguttula biguttula*, *Aonidiella aurantii*, *Aphis gossypii*, *Aphis glycines*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bagrada hilaris*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Blissus leucopterus*, *Boisea trivittata*, *Brachycorynella asparagi*, *Brevennia rehi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla pyri*, *Cacopsylla pyricola*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Diuraphis noxia*, *Diaphorina citri*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa meditabunda*, *Eriosoma lanigerum*, *Eurygaster maura*, *Euschistus conspersus*, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Halyomorpha halys*, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, *Icerya purchasi*, *Idioscopus nitidulus*, *Laodelphax striatellus*, *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus hesperus*, *Maconellicoccus hirsutus*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum granarium*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva frimbiolata*, *Megacopta cribraria*, *Metopolophium dirhodum*, *Mictis longicornis*, *Myzus persicae*, *Nephotettix cincticeps*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, *Nilaparvata lugens*, *Parlatoria pergandii*, *Parlatoria ziziphi*, *Peregrinus maidis*, *Phylloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildinii*, *Poecilocapsus lineatus*, *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudococcus brevipes*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Saissetia*

oleae, *Scaptocoris castanea*, *Schizaphisgaminum*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trialeurodes abutiloneus*, *Unaspis yanonensis*, và *Zulia entrerriana*.

(9) họ Hymenoptera. Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acromyrmex* spp., *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Diprion* spp., *Dolichovespula* spp., *Formica* spp., *Monomorium* spp., *Neodiprion* spp., *Paratrechina* spp., *Pheidole* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., *Solenopsis* spp., *Technomyrmex*, spp., *Tetramorium* spp., *Vespula* spp., *Vespa* spp., và *Xylocopa* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Athalia rosae*, *Atta texana*, *Caliroa cerasi*, *Cimbex americana*, *Iridomyrmex humilis*, *Linepithema humile*, *Mellifera Scutellata*, *Monomorium minimum*, *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion sertifer*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis molesta*, *Solenopsis richtery*, *Solenopsis xyloni*, *Tapinoma sessile*, và *Wasmannia auropunctata*.

(10) bộ cánh đều (Isoptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Coptotermes* spp., *Cornitermes* spp., *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp., *Kalotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp., và *Zootermopsis* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Coptotermes acinaciformis*, *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchi*, *Coptotermes formosanus*, *Coptotermes gestroi*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes tenuis*, *Incisitermes minor*, *Incisitermes snyderi*, *Microtermes obesi*, *Nasutitermes corniger*, *Odontotermes formosanus*, *Odontotermes obesus*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, và *Reticulitermes virginicus*.

(11) bộ cánh vẩy (Lepidoptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Adoxophyes* spp., *Agrotis* spp., *Argyrotaenia* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia* spp., *Chilo* spp., *Chrysodeixis* spp., *Colias* spp., *Crambus* spp., *Diaphania* spp., *Diatraea* spp., *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Epimecis* spp., *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Indarbela* spp., *Lithocolletis* spp., *Loxagrotis* spp., *Malacosoma* spp., *Nemapogon* spp., *Peridroma* spp., *Phyllonorycter*

spp., *Pseudaletia* spp., *Plutella* spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., and *Yponomeuta* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Achaea janata*, *Adoxophyes orana*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, *Amorbia cuneana*, *Amyelois transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, *Anomis sabulifera*, *Anticarsia gemmatalis*, *Archips argyrospila*, *Archips rosana*, *Argyrotaenia citrana*, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, *Chlumetia transversa*, *Choristoneura rosaceana*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conopomorpha cramerella*, *Corcyra cephalonica*, *Cossus cossus*, *Cydia caryana*, *Cydia funebrana*, *Cydia molesta*, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Darna diducta*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea saccharalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Ecdytolopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erionota thrax*, *Estigmene acrea*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euxoa auxiliaris*, *Galleria mellonella*, *Grapholita molesta*, *Hedylepta indicata*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis virescens*, *Hellula undalis*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera malifoliella*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria dispar*, *Lyonetia clerkella*, *Mahasena corbetti*, *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Maruca testulalis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nymphula depunctalis*, *Operophtera brumata*, *Ostrinia nubilalis*, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, *Pandemis heparana*, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Perileucoptera coffeella*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter blancardella*, *Pieris rapae*, *Plathypena scabra*, *Platynota idaeusalis*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Polychrosis viteana*, *Prays endocarpa*, *Prays oleae*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Sâu xanh da láng (Beet Armyworm)*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera eridania*, *Thecla basilides*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, *Zeuzera coffeae*, và *Zeuzea pyrina*.Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Achaea janata*, *Adoxophyes orana*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, *Amorbia cuneana*, *Amyelois transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, *Anomis sabulifera*, *Anticarsia*

gemmatalis, *Archips argyrospila*, *Archips rosana*, *Argyrotaenia citrana*, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, *Chlumetia transversa*, *Choristoneura rosaceana*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conopomorpha cramerella*, *Corcyra cephalonica*, *Cossus cossus*, *Cydia caryana*, *Cydia funebrana*, *Cydia molesta*, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Darna diducta*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea saccharalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Ecdytolopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erionota thrax*, *Estigmene acrea*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euxoa auxiliaris*, *Galleria mellonella*, *Grapholita molesta*, *Hedylepta indicata*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis virescens*, *Hellula undalis*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera malifoliella*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria dispar*, *Lyonetia clerkella*, *Mahasena corbetti*, *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Maruca testulalis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nymphula depunctalis*, *Operophtera brumata*, *Ostrinia nubilalis*, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, *Pandemis heparana*, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Perileucoptera coffeella*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter blancardella*, *Pieris rapae*, *Plathypena scabra*, *Platynota idaeusalis*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Polychrosis viteana*, *Prays endocarpa*, *Prays oleae*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, Sâu xanh da láng (*Beet Armyworm*), *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera eridania*, *Thecla basilides*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, *Zeuzera coffeae*, và *Zeuzea pyrina*.

(12) bộ ăn lông (Mallophaga). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Anaticola* spp., *Bovicola* spp., *Chelopistes* spp., *Goniodes* spp., *Menacanthus* spp., và *Trichodectes* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Bovicola bovis*, *Bovicola caprae*, *Bovicola ovis*, *Chelopistes meleagridis*, *Goniodes dissimilis*, *Goniodes gigas*, *Menacanthus stramineus*, *Menopon gallinae*, và *Trichodectes canis*.

(13) bộ cánh thẳng (Orthoptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Melanoplus* spp. và *Pterophylla* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acheta domesticus*, *Anabrus simplex*, *Gryllotalpa africana*, *Gryllotalpa australis*, *Gryllotalpa brachyptera*, *Gryllotalpa hexadactyla*, *Locusta migratoria*, *Microcentrum retinerve*, *Schistocerca gregaria*, và *Scudderia furcata*.

(14) bộ Psocoptera (Rệp sát, mọt). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Liposcelis decolor*, *Liposcelis entomophila*, *Lachesilla quercus*, và *Trogium pulsatorium*.

(15) bộ không cánh (Siphonaptera). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Ceratophyllus gallinae*, *Ceratophyllus niger*, *Ctenocephalogenua canis*, *Ctenocephalogenua felis*, và *Pulex irritans*.

(16) bộ cánh viền (Thysanoptera). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Caliothrips* spp., *Frankliniella* spp., *Scirtobọ trĩ* spp., và *Thrips*spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Frankliniella bispinosa*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella williamsi*, *Heliobọ trĩ haemorrhoidalis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips citri*, *Scirtothrips dorsalis*, *Taeniothrips rhopalantennalis*, *Thrips hawaiiensis*, *Thrips nigropilosus*, *Thrips orientalis*, *Thrips palmi*, và*Thrips tabaci*.

(17) bộ ba đuôi (Thysanura). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Lepisma* spp. và *Thermobia* spp.

(18) bộ ve (Acarina). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acarus* spp., *Aculops* spp., *Argus* spp., *Boophilus* spp., *Demodex* spp., *Dermacentor* spp., *Epitrimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp., *Oligonychus* spp., *Panonychus* spp., *Rhizoglyphus* spp., và *Tetranychus* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Acarapis woodi*, *Acarus siro*, *Aceria mangiferae*, *Aculops lycopersici*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma americanum*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Dermacentor variabilis*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Eotetranychus carpini*,

Liponyssoides sanguineus, *Notoedres cati*, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus ilicis*, *Ornithonyssus bacoti*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Sarcoptes scabiei*, *Tegolophus perseaflorae*, *Tetranychus urticae*, *Tyrophagus longior*, và *Varroa destructor*.

(19) bộ nhện (Araneae). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Loxosceles* spp., *Latrodectus* spp., và *Atrax* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Loxosceles reclusa*, *Latrodectus mactans*, và *Atrax robustus*.

(20) lớp rết tơ (Symphyla). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Scutigerella immaculata*.

(21) phân lớp bọ đuôi bật (Collembola). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Bourletiella hortensis*, *Onychiurus armatus*, *Onychiurus fimetarius*, và *Sminthurus viridis*.

(22) ngành giun tròn (Nematoda). Danh sách không đầy đủ của các chi cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus* spp., *Criconemella* spp., *Ditylenchus* spp., *Globodera* spp., *Heterodera* spp., *Hirschmanniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., và *Radopholus* spp. Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Dirofilaria immitis*, *Globodera pallida*, *Heterodera glycines*, *Heterodera zeae*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Onchocerca volvulus*, *Pratylenchus penetrans*, *Radopholus similis*, và *Rotylenchulus reniformis*.

(23) ngành thân mềm (Mollusca). Danh sách không đầy đủ của các loài cụ thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, *Arion vulgaris*, *Cornu aspersum*, *Deroceras reticulatum*, *Limax flavus*, *Milax gagates*, và *Pomacea canaliculata*.

Nhóm sinh vật gây hại để kiểm soát được ưu tiên cụ thể là sinh vật gây hại hút nhựa cây. Sinh vật gây hại hút nhựa cây, thông thường, có phần miệng khoan và/hoặc hút và sống bằng nhựa cây và các mô bên trong thực vật. Các ví dụ về sinh vật gây hại hút nhựa cây có liên quan cụ thể đến nông nghiệp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, rệp cây, bọ rầy xanh, nhậy, rệp cây, bọ trĩ, rệp lá, sâu ăn bột, bọ xít, và ruồi trắng. Các ví dụ cụ thể về các họ mà có sinh vật gây hại hút nhựa cây liên quan đến nông nghiệp bao gồm

nhưng không bị giới hạn ở, bộ cháy rận và bộ cánh nửa. Các ví dụ cụ thể về bộ cánh nửa mà liên quan đến nông nghiệp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Coccus* spp., *Euschistus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nezara* spp., và *Rhopalosiphum* spp.

Các nhóm sinh vật gây hại để kiểm soát được ưu tiên cụ thể là sinh vật gây hại loại nhai nghiền. Sinh vật gây hại loại nhau nghiền, thông thường, có các phần phụ miệng mà cho phép chúng nhai nghiền mô thực vật bao gồm rễ, thân, lá, chồi, và các mô sinh sản (bao gồm, nhưng không giới hạn đối với hoa, quả và hạt). Các ví dụ về các sinh vật gây hại loại nhai nghiền liên quan cụ thể đến nông nghiệp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, sâu bướm, bọ cánh cứng, châu chấu, và châu chấu. Các ví dụ cụ thể về các Họ mà có sinh vật gây hại loại nhai nghiền liên quan đến nông nghiệp bao gồm nhưng không bị giới hạn ở, cánh cứng (Coleoptera) và cánh vẩy (Lepidoptera). Các ví dụ cụ thể về cánh cứng (Coleoptera) mà liên quan đến nông nghiệp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, *Anthonomus* spp., *Cerotoma* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *xyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Hypera* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp.

Thuật ngữ "lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại" được sử dụng trong bản mô tả để chỉ lượng thuốc diệt sinh vật gây hại cần để đạt được hiệu quả tối ưu trên sinh vật gây hại, ví dụ, hiệu quả là tử hoại, chết, chậm phát triển, ngăn ngừa, loại bỏ, tiêu diệt, hoặc cách khác là làm giảm sự xuất hiện và/hoặc hoạt tính của sinh vật gây hại ở vị trí. Hiệu quả này có thể đạt được khi quần thể sinh vật gây hại bị đẩy ra khỏi vùng chứa chúng, sinh vật gây hại bị làm mất khả năng ở, hoặc xung quanh, vị trí, và/hoặc sinh vật gây hại bị tiêu diệt ở, hoặc xung quanh, ở vị trí. Tất nhiên, sự kết hợp của hiệu quả này có thể xảy ra. Thông thường, quần thể sinh vật gây hại, hoạt tính của sinh vật gây hại, hoặc cả hai mong muốn được giảm hơn năm mươi phần trăm, tốt hơn nếu lớn hơn 90 phần trăm, và tốt nhất là lớn hơn 99 phần trăm. Nhìn chung, lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại, cho mục đích nông nghiệp, nằm trong khoảng từ 0,0001g/ha đến 5000g/ha, tốt hơn nếu nằm trong khoảng từ 0,0001g/ha đến 500g/ha, và thậm chí tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 0,0001g/ha đến 50g/ha.

Các hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại ở dạng đồng phân hình học hoặc đồng phân quang học khác nhau hoặc các dạng đồng phân hỗ biến khác nhau. Một hoặc nhiều

tâm bất đối xứng có thể có trong trường hợp mà các hợp chất có công thức (I) có thể có mặt làm các đồng phân đối hình thuần túy, hỗn hợp các đồng phân đối hình, đồng phân phi đối hình thuần túy hoặc hỗn hợp đồng phân phi đối hình. Sẽ được đánh giá bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này mà một đồng phân lập thể có thể có nhiều hoạt tính hơn các đồng phân lập thể khác. Các đồng phân lập thể riêng có thể thu được nhờ quy trình tổng hợp có chọn lọc đã biết, quy trình tổng hợp thông thường sử dụng các nguyên liệu ban đầu được phân tách, hoặc nhờ quy trình phân tách thông thường. Có thể có mặt các liên kết đôi trong hợp chất, trường hợp mà hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại là đồng phân hình học đơn (*cis* hoặc *trans*, *E* hoặc *Z*) hoặc hỗn hợp các đồng phân hình học (*cis* và *trans*, *E* và *Z*). Có thể có mặt tâm của sự hỗ biến. Sáng chế đề xuất tất cả các đồng phân, đồng phân hỗ biến, và hỗn hợp của chúng, trong tất cả các phần.

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I), carboxamido, và phenyl, mà được liên kết với xyclopropan, trong kết cấu *R,R*. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác có R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^1 là H hoặc F. Phươgn án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^4 là F hoặc Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^6 là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^7 được chọn từ nhóm bao gồm Br và Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^8 được chọn từ nhóm bao gồm Br và Cl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^9 là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{10} là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{11} là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{12} là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và (C_1-C_4)haloalkyl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và CF_3. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{14} là H. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{15}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và $(C_1$-$C_4)$alkyl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và CH_3. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{16}, Q^1, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkylphenyl, $(C_2$-$C_8)$alkenyl, $(C_2$-$C_8)$alkynyl, $(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S(O)-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S$(O)_2$-$(C_1$-$C_8)$alkyl, O-phenyl, O-$(C_2$-$C_8)$alkenyl, O-$(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, O-$(C_1$-$C_8)$alkylphenyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-C(=O) nH-$(C_1$-$C_8)$haloalkyl, và $(C_1$-$C_8)$alkyl-NHC(O)-$(C_1$-$C_8)$alkyl,

trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, I, CN, $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkoxy, $(C_1$-$C_8)$haloalkyl, N$((C_1$-$C_8)$alkyl$)_2$, và pyridinyl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, Q^2, và R^{15}.

Theo một phương án khác, R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_2$, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH(CH_3)_2$, CH_2xyclopropyl, CH_2CH_2xyclopropyl, CH_2xyclobutyl, CH_2phenyl, CH_2CH_2phenyl, $CH_2C{=}CH$, $CH_2C{=}CH$, CH_2CF_3, CH_2CHF_2, $CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2F$, $CH_2CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2S(O)CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $C(CH_3)_2CH_2S(O)_2CH_3$, Ophenyl, $OCH_2CH{=}CH_2$, OCH_2xyclopropyl, OCH_2phenyl, $CH_2CH_2OCH_2$xyclopropyl, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CF_3$, $CH_2C(=O)$ $nHCH_2CF_3$, và $CH_2CH_2NHC(=O)CH_3$,

trong đó mỗi CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, xyclopropyl, xyclobutyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, $C(CH_3)_3$, CF_3, OCH_3, OCH_2CH_3, $N(CH_3)_2$, và pyridinyl. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, Q^2, và R^{15}.

Theo một phương án khác, R^{15} và R^{16} đều là liên kết hydrocarbyl no có 4 cạnh,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu được thế bằng một hoặc nhiều F. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, và Q^2.

Theo một phương án khác, R^{15} và R^{16} đều là $-CH_2CH_2CF_2CH_2-$. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, và Q^2.

Theo một phương án khác Q^1 là O. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, và Q^2.

Theo một phương án khác Q^2 là O. Phương án này có thể được sử dụng kết hợp với các phương án khác là R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, và Q^1.

Theo một phương án khác:

(A) R^1 là H;

(B) R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H và Cl;

(C) R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H và Cl;

(D) R^4 là Cl;

(E) R^5 là H;

(F) R^6 là H;

(G) R^7 được chọn từ nhóm bao gồm Cl và Br;

(H) R^8 được chọn từ nhóm bao gồm Cl và Br;

(I) R^9 là H;

(J) R^{10} là H;

(K) R^{11} là H;

(L) R^{12} là H;

(M) R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và CF_3;

(N) R^{14} là H;

(O) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và CH_3;

(P) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_2$, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH(CH_3)_2$, CH_2xyclopropyl, CH_2CH_2xyclopropyl, CH_2xyclobutyl, CH_2phenyl, CH_2CH_2phenyl, $CH_2C{=}CH$, $CH_2C{=}CH$, CH_2CF_3, CH_2CHF_2, $CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2F$, $CH_2CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2S(O)CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $C(CH_3)_2CH_2S(O)_2CH_3$, Ophenyl, $OCH_2CH{=}CH_2$, OCH_2xyclopropyl, OCH_2phenyl, $CH_2CH_2OCH_2$xyclopropyl, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CF_3$, $CH_2C(=O)$ $nHCH_2CF_3$, và $CH_2CH_2NHC(=O)CH_3$,

trong đó mỗi CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, xyclopropyl, xyclobutyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, $C(CH_3)_3$, CF_3, OCH_3, OCH_2CH_3, $N(CH_3)_2$, và pyridinyl; và

(Q) R^{15} và R^{16} đều là liên kết hydrocarbyl no có 4 cạnh,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu được thế bằng một hoặc nhiều F.

(R) Q^1 và Q^2 là O.

Theo một phương án khác:

(A) Mỗi R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{11}, R^{12}, R^{13}, và R^{14} được chọn độc lập từ nhóm bao gồm H, Cl, và $(C_1$-$C_4)$haloalkyl;

(B) R^6 và R^9 là H;

(C) R^7 là Cl;

(D) R^8 là Cl;

(E) Q^1 và Q^2 là O;

(F) R^{10} là H;

(G) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm (I), H, và $(C_1$-$C_4)$alkyl;

(H) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm (I), $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkylphenyl, $(C_2$-$C_8)$alkenyl, $(C_2$-

C_8)alkynyl, (C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)alkyl, Ophenyl, O-(C_2-C_8)alkenyl, O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, O-(C_1-C_8)alkylphenyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-C(=O) nH-(C_1-C_8)haloalkyl, và (C_1-C_8)alkyl-NHC(O)-(C_1-C_8)alkyl,

trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkoxy, (C_1-C_8)haloalkyl, và N((C_1-C_8)alkyl)$_2$; và

(I) R^{15} và R^{16} có thể tùy ý cùng tạo ra liên kết hydrocarbyl no có từ 2 đến 5 cạnh,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu có thể được thế tùy ý với một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, và I.

Theo một phương án khác:

(A) Mỗi R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{11}, R^{12}, R^{13}, và R^{14} được chọn độc lập từ nhóm bao gồm H, Cl, và (C_1-C_4)haloalkyl;

(B) R^6 và R^9 là H;

(C) R^7 là Cl;

(D) R^8 là Cl;

(E) Q^1 và Q^2 là O;

(F) R^{10} là H;

(G) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm (I), H, và (C_1-C_4)alkyl;

(H) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm (I), (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkylphenyl, (C_2-C_8)alkenyl, (C_2-C_8)alkynyl, (C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)alkyl, O-(C_2-C_8)alkenyl, O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, O-(C_1-C_8)alkylphenyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-C(=O) nH-(C_1-C_8)haloalkyl, và (C_1-C_8)alkyl-NHC(O)-(C_1-C_8)alkyl,

trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, (C_1-C_8)alkoxy, và (C_1-C_8)haloalkyl; và

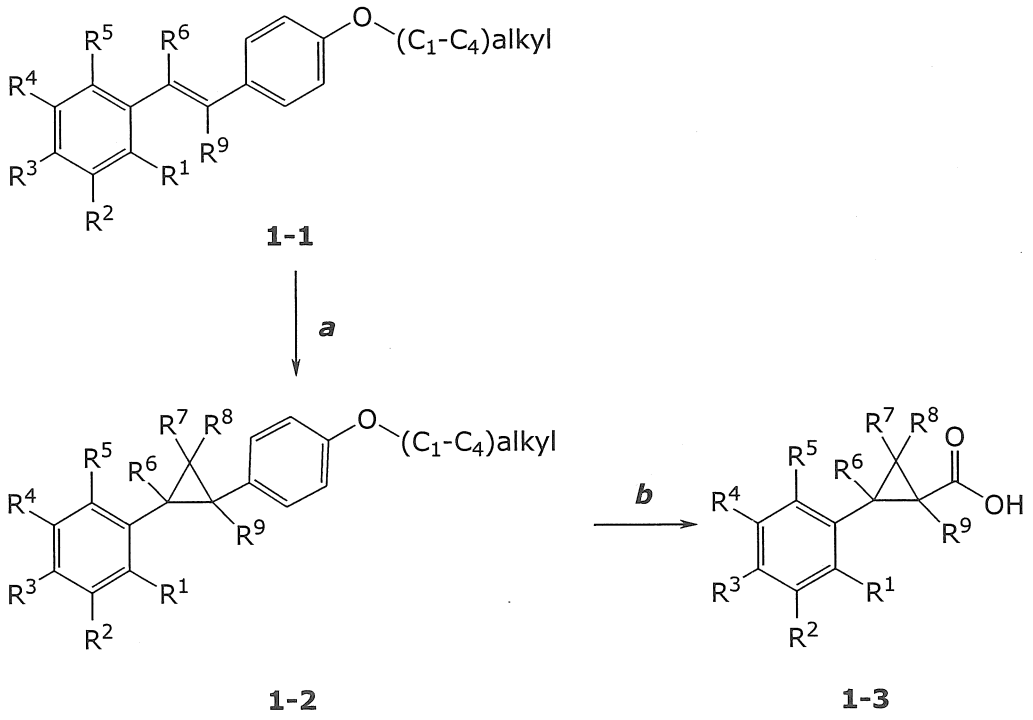
(I) R^{15} and R^{16} có thể tùy ý cùng tạo ra liên kết hydrocarbyl no có từ 2 đến 5 cạnh,,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu có thể được thế tùy ý với một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, và I.

Phương pháp điều chế axit xyclopropyl carboxylic

Sitlben 1-1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, và R^9 được bộc lộ trước đây, có thể được xử lý bằng bazơ như natri hydroxit với sự có mặt của gốc carben như cloroform hoặc bromform và xúc tác chuyển pha như *N*-benzyl-*N*,*N*-dietyletanamin clorua trong dung môi proton phân cực như nước ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 °C đến 40 °C để tạo ra diaryl xyclopropan 1-2, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 được bộc lộ trước đây (Sơ đồ 1, bước *a*). Xử lý diaryl xyclopropan 1-2 bằng kim loại chuyển tiếp như ruteni(III) clorua với sự có mặt của chất oxy hóa theo hệ số tỷ lượng như natri periodat trong hỗn hợp dung môi tốt hơn nếu nước, etyl axetat, và axetonitril ở nhiệt độ nằm trong khoảng 0 °C nằm trong khoảng từ 40 °C có thể tạo ra axit xyclopropyl carboxylic 1-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 được bộc lộ trước đây (Sơ đồ 1, bước *b*).

Sơ đồ 1

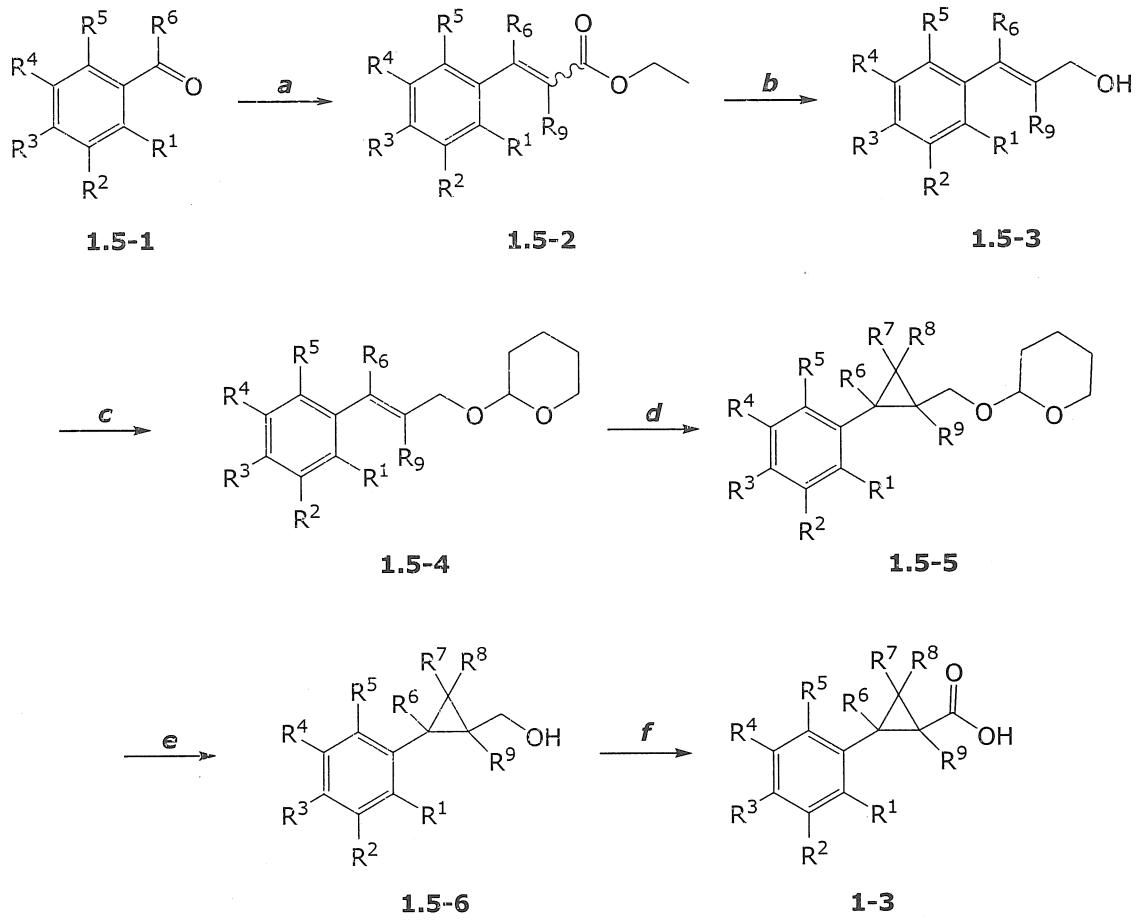


Vẫn theo các phương án khác, 1-3 có thể được điều chế từ aryl keton 1,5-1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, và R^5 đã được bộc lộ trước đây, và R^6 là metyl. Hợp chất axetophenon

1,5-1 có thể đạt được theo bước thứ nhất bằng carbanion phosphonat ổn định, được tạo ra bằng cách xử lý phosphonat, như etyl 2-(dietoxyphosphoryl)-axetat bằng các bazơ mạnh như natri hydrua hoặc kali *tert*-butoxit trong dung môi không proton phân cực, như tetrahydrofuran ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 °C đến 5 °C (Sơ đồ 1,5, bước *a*). Phản ứng này, tương tự các phản ứng khác bao gồm việc xử lý aldehyt hoặc keton bằng carbanion phosphonat ổn định để tạo ra olefin, sẽ được thừa nhận dễ dàng bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này như phản ứng olefin hóa Horner-Wadsworth-Emmons. Theo bước thứ hai, este không no α,β 1,5-2, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, và R^6 được xác định như trên, có thể được xử lý bằng chất khử, ví dụ kim loại hydrua tương tự như nhôm hydrua diisobutyl, trong dung môi hydrocarbon thơm như toluen ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ -78 °C đến 22 °C để tạo ra rượu bậc một trung gian 1,5-3 (Sơ đồ 1,5, bước *b*), trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, và R^6 được xác định như trên và R^9 được bộc lộ trước đây. Việc bảo vệ rượu bậc một 1,5-3 cần cho sự hoàn thiện thành công của các biến đổi hóa học theo thứ tự, và sự thay đổi rộng rãi của các hoạt động của nhóm bảo vệ có thể được sử dụng. Ví dụ, xử lý rượu 1,5-3 bằng 3,4-dihydro-2-*H*-pyran với sự có mặt của lượng xúc tác là axit hữu cơ, như axit *para*-toluensulfonic monohydrat, trong dung môi không proton tương tự như dietyl ete nằm trong khoảng nhiệt độ từ 0 °C đến nhiệt độ môi trường tạo ra rượu bảo vệ tetrahydro-2-*H*-pyran (THP)1,5-4 (Sơ đồ 1,5, bước *c*), trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 và R^9 được định như trên. Hợp chất trung gian styryl bảo vệ THP có thể được chuyển thành hợp chất trung gian xyclopropan bảo vệ THP 1,5-5, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 và R^9 được xác định như trên và R^7 và R^8 đã được bộc lộ trước đây, bằng cách xử lý bằng gốc carben như cloroform với sự có mặt của bazơ, như natri hoặc kali hydroxit, và chất xúc tác như tetrabutylammoni hexaflophosphat ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 25 đến 45°C (Sơ đồ 1,5, bước *d*). Việc khử bảo vệ của hợp chất trung gian xyclopropan được bảo vệ bằng THP 1,5-5, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 được xác định như trên, có thể đạt được bằng cách xử lý bằng lượng xúc tác là axit hữu cơ, như axit *para*-toluensulfonic monohydrat, trong dung môi proton phân cực, như metanol, ở nhiệt độ khoảng là 22 °C để tạo ra hợp chất trung gian metanol xyclopropyl 1,5-6 (Sơ đồ 1,5, bước *e*). Việc oxi hóa hợp chất trung gian rượu bậc một 1,5-6, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 được xác định như trên, có thể đạt được sử dụng khoảng rộng rãi của các chất phản ứng và điều kiện đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật

(Figadere, B. và Franck, X., "Carboxylic Acids: Synthesis from Alcohols" Science of Synthesis 2006, (20a) pp 173 - 204), mà nhiều chất trong số đó cung cấp nhóm chức phân biệt có khả năng tương tính và có tính chọn lọc. Ví dụ, xử lý hợp chất trung gian chứa gốc rượu 1,5-6 bằng các dung dịch crom trioxit trong dung dịch là axit sulfuric loãng và axeton, chất phản ứng Jones, tạo ra axit xyclopropyl carboxylic 1-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 được xác định như trên (Sơ đồ1,5, bước *f*).

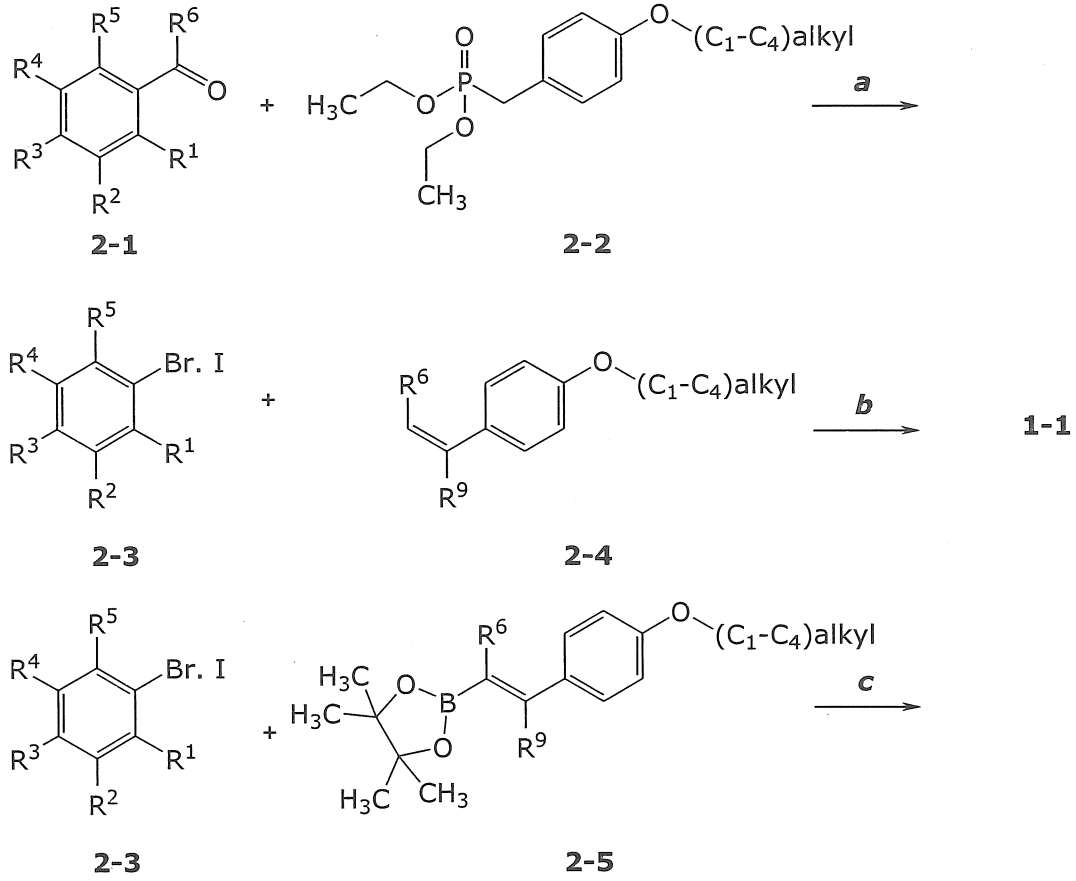
Sơ đồ 1,5



Điều chế stilben

Sitlben 1-1 có thể được điều chế bằng các phương pháp khác nhau như được chỉ ra trên Sơ đồ 2. Phenyl carbonyl 2-1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, và R^6 đã được bộc lộ trước đây, được xử lý bằng alkoxy benzyl phosphonat 2-2 với sự có mặt của bazơ như natri metoxit trong dung môi không proton phân cực như *N*,*N*-dimetylformamit ở nhiệt độ nằm trong khoảng nhiệt độ từ -10°C đến 30°C và sau đó được làm nóng trong khoảng nhiệt độ từ 40°C đến 80°C để tạo ra sitlben 1-1 (Sơ đồ 2, bước *a*).

Sơ đồ 2

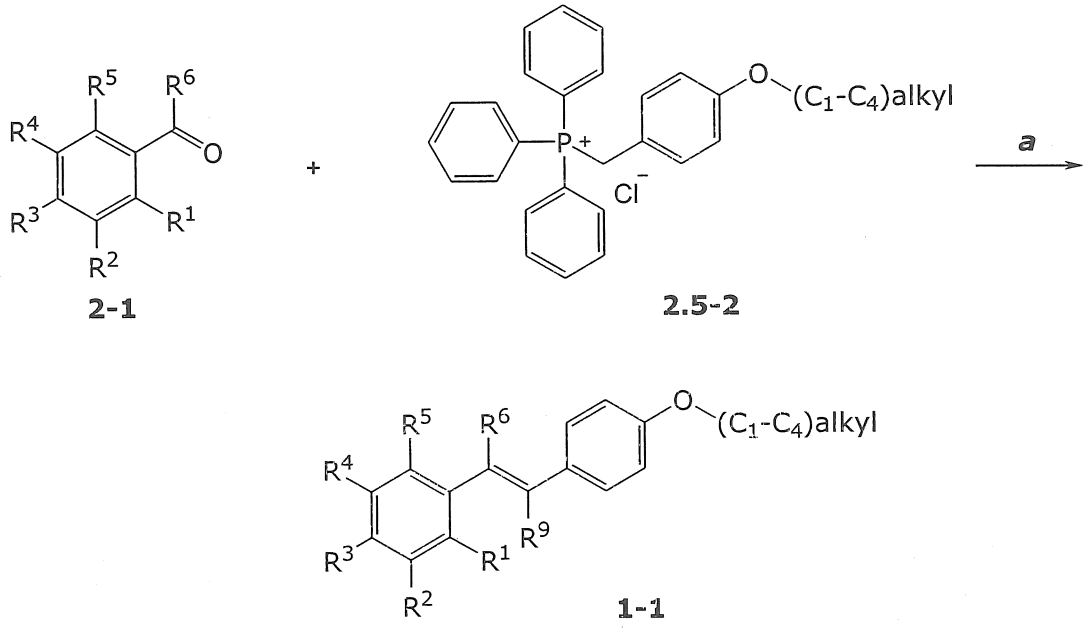


Các aryl halogenua 2-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, và R^5 đã được bộc lộ trước đây, có thể được xử lý bằng vinylbenzen 2-4, trong đó R^6 và R^9 đã được bộc lộ trước đây, với sự có mặt của xúc tác kim loại chuyển tiếp như paladi(II) axetat và phối tử bisphosphin như 1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen trong dung môi bazơ như trietylamin ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 60°C đến 100°C để tạo ra sitlben 1-1 (Sơ đồ 2, bước *b*). Ngoài ra, aryl halogenua 2-3 có thể được xử lý bằng vinylboronat 2-5, trong đó R^6 và R^9 đã được bộc lộ trước đây, với sự có mặt của xúc tác kim loại chuyển tiếp như tetrakis(triphenylphosphin) paladi(0) và bazơ như kali carbonat trong hỗn hợp dung môi như 1,2-dimetoxyetan và nước ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 60°C đến 100°C để tạo ra sitlben 1-1 (Sơ đồ 2, bước *c*).

Vẫn theo một phương án khác, sitlben 1-1 cũng có thể được điều chế bằng phương pháp olefin hóa Wittig (Chalal, M.; Vervandier-Fasseur, D.; Meunier, P.; Cattey, H.; Hierso, J.-C. *Tetrahedron* 2012, *68*, 3899-3907) được chỉ ra trên Sơ đồ 2.5. Phenyl carbonyl 2-1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, và R^5 đã được bộc lộ trước đây và R^6 là H, có thể được xử lý bằng alkoxy benzyl triphenylphosphin clorua 2,5-2 với sự có mặt của bazơ

như *n*-butyl lithi trong dung môi không proton phân cực như tetrahydrofuran ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ -78°C đến nhiệt độ môi trường để tạo ra sitlben 1-1 (Sơ đồ 2.5, bước *a*).

Sơ đồ 2.5



Điều chế các xyclopropyl amit

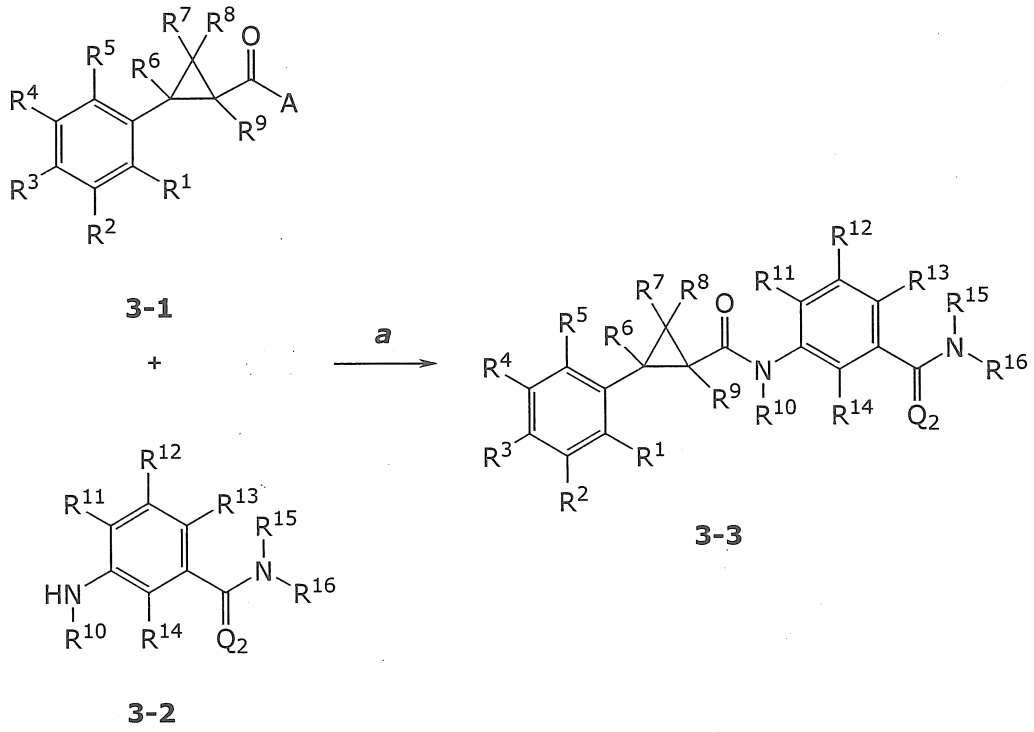
Xyclopropyl amit 3-3, trong đó Q^1 là O, và R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, Q^2, R^{15}, và R^{16} đã được bộc lộ trước đây, có thể được điều chế bằng cách xử lý bằng amin hoặc muối amin 3-2, trong đó R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, Q^2, và R^{15}, và R^{16} đã được bộc lộ trước đây, và các axit carboxylic được hoạt hóa 3-1, trong đó A là nhóm hoạt hóa, và R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 đã được bộc lộ trước đây, bằng bazơ, như trietylamin, diisopropyletylamin, 4-metylmorpholin, hoặc 4-dimetylaminopyridin trong dung môi không có proton khan như diclometan, tetrahydrofuran, 1,2-dicloetan, dimetylformamit, hoặc tổ hợp bất kỳ của chúng, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến 120°C (Sơ đồ 3, bước *a*).

Axit carboxylic được hoạt hóa3-1 có thể là axit halogenua, như axit clorua, axit bromua, hoặc axit florua; este carboxylic, như este*para*-nitrophenyl, pentaflophenyl, este etyl (hydroxyiminio)xyanoaxetat, este metyl, este etyl, este benzyl, este *N*-hydroxysuccinimidyl, este hydroxybenzotriazol-1-yl, hoặc este hydroxypyridyltriazol-1-yl; *O*-acylisourea; axit anhydrua; hoặc thioeste. Axit clorua có thể được điều chế từ các axit carboxylic tương ứng bằng cách xử lý bằng chất clo hóa khử nước, như oxalyl clorua

hoặc thionyl clorua. Các este carboxylic 3-1 được hoạt hóa có thể được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng muối uron, như 1- [bis(dimetylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridin 3-oxit hexaflophosphat (HATU), *O*-(benzotriazol-1-yl)-*N,N,N',N'*-tetrametyluron hexaflophosphat (HBTU), hoặc (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminooxy)dimetylamin-morpholin-carben hexaflophosphat (COMU). Các este carboxylic 3-1 được hoạt hóa được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng muối phosphin như benzotriazol-1-yl-oxytripyrolidinophosphin hexaflophosphat (PyBop). Các este carboxylic 3-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 1-(3-dimetylamino propyl)-3-etylcarbodiimit, hoặc dixyclohexylcarbodiimit với sự có mặt của triazol như hydroxybenzotriazol·monohydrat (HOBt) hoặc 1-hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt). *O*-Axylisourea có thể được điều chế bằng carbodimit khử nước như 1-(3-dimetylamino propyl)-3-etylcarbodiimit hoặc dixyclohexylcarbodiimit. Các este carboxylic 3-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ các axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 2-clo-1,3-dimetylimidazolidin hexaflophosphat (CIP) với sự có mặt của triazol như 1-hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt). Các este carboxylic 3-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ các axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinan 2,4,6-trioxit (T3P®) với sự có mặt của bazơ như pyridin.

Xyclopropyl amit 3-3, trong đó R^{16} chứa sulfit và R^{15} được bộc lộ trước đây, có thể được oxi hóa thành sulfoxit hoặc sulfon tương ứng bằng cách xử lý bằng khoảng một đương lượng của axit *meta*-cloperoxybenzoic trong dung môi không proton phân cực như diclometan (sulfoxit) hoặc khoảng hai đương lượng của axit *meta*-cloperoxybenzoic (sulfon) ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến 40°C. Ngoài ra, xyclopropyl amit 3-3, trong đó R^{16} chứa sulfit có thể được oxi hóa thành sulfoxit hoặc sulfon tương ứng bằng cách xử lý bằng một đương lượng natri perborat trong dung môi proton như axit axetic (sulfoxit) hoặc hai đương lượng của natri perborat (sulfon). Tốt hơn nếu, việc oxi hóa sẽ được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 40°C đến 100°C sử dụng khoảng 1,5 đương lượng natri perborat để tạo ra hỗn hợp phân tách sắc ký của sulfoxit và sulfon xyclopropyl amit 3-3.

Sơ đồ 3

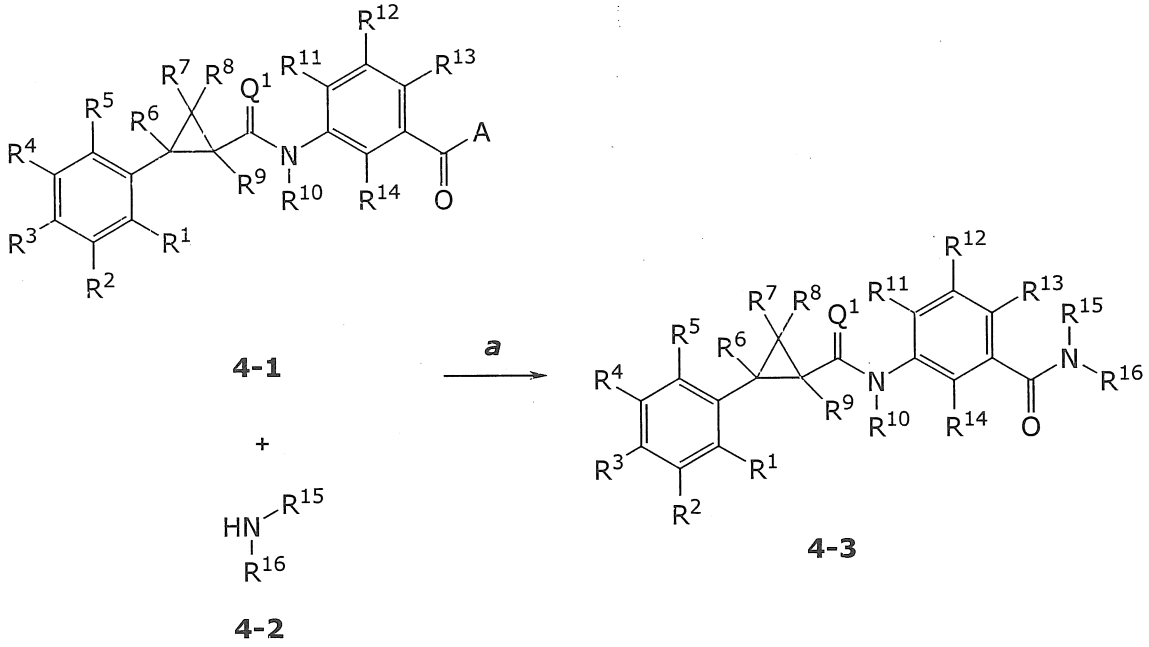


Xyclopropyl amit 4-3, trong đó Q^2 là O, và R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, và R^{16} đã được bộc lộ trước đây, có thể được điều chế bằng cách xử lý bằng amin hoặc muối amin 4-2, trong đó R^{15} và R^{16} đã được bộc lộ trước đây, và axit carboxylic được hoạt hóa4-1, trong đó A là nhóm hoạt hóa, và R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, Q^1, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, và R^{14} đã được bộc lộ trước đây, bằng bazơ, như trietylamin, diisopropyletylamin, 4-metylmorpholin, hoặc 4-dimetylaminopyridin trong dung môi không có proton khan như diclometan, tetrahydrofuran, 1,2-dicloetan, dimetylformamit, hoặc tổ hợp bất kỳ của chúng, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 °C đến 120°C (Sơ đồ 4, bước *a*).

Axit carboxylic 4-1 được hoạt hóa có thể là axit halogenua, như axit clorua, axit bromua, hoặc axit florua; este carboxylic, như este *para*-nitrophenyl, este pentaflophenyl, este etyl (hydroxyiminio)xyanoaxetat,este metyl, este etyl, este benzyl, este *N*-hydroxysuccinimidyl, este hydroxybenzotriazol-1-yl, hoặc este hydroxypyridyltriazol-1-yl; *O*-axylisourea; axit anhydrua; hoặc thioeste. Axit clorua có thể được điều chế từ các axit carboxylic tương ứng bằng cách xử lý bằng chất clo hóa khử nước, như oxalyl clorua hoặc thionyl clorua. Các este carboxylic 4-1 được hoạt hóa có thể được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng muối uron, như 1-[bis(dimetylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-

triazolo[4,5-b]pyridin 3-oxit hexaflophosphat (HATU), *O*-(benzotriazol-1-yl)-*N,N,N',N'*-tetrametyluron hexaflophosphat (HBTU), hoặc (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminooxy)dimetylamin-morpholin-carben hexaflophosphat (COMU). Các este carboxylic 4-1 được hoạt hóa được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng muối phosphin như benzotriazol-1-yl-oxytripyrolidinophosphin hexaflophosphat (PyBop). Các este carboxylic 4-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 1-(3-dimetylamino propyl)-3-etylcarbodiimit, hoặc dixyclohexylcarbodiimit với sự có mặt của triazol như hydroxybenzotriazol·monohydrat (HOBt) hoặc 1-hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt). *O*-Axylisourea có thể được điều chế bằng carbodimit khử nước như 1-(3-dimetylamino propyl)-3-etylcarbodiimit hoặc dixyclohexylcarbodiimit. Các este carboxylic 4-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ các axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 2-clo-1,3-dimetylimidazolidin hexaflophosphat (CIP) với sự có mặt của triazol như 1-hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt). Este carboxylic 4-1 được hoạt hóa cũng có thể được điều chế từ các axit carboxylic *tại chỗ* bằng chất liên kết như 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinane 2,4,6-trioxit (T3P®) với sự có mặt của bazơ như pyridin.

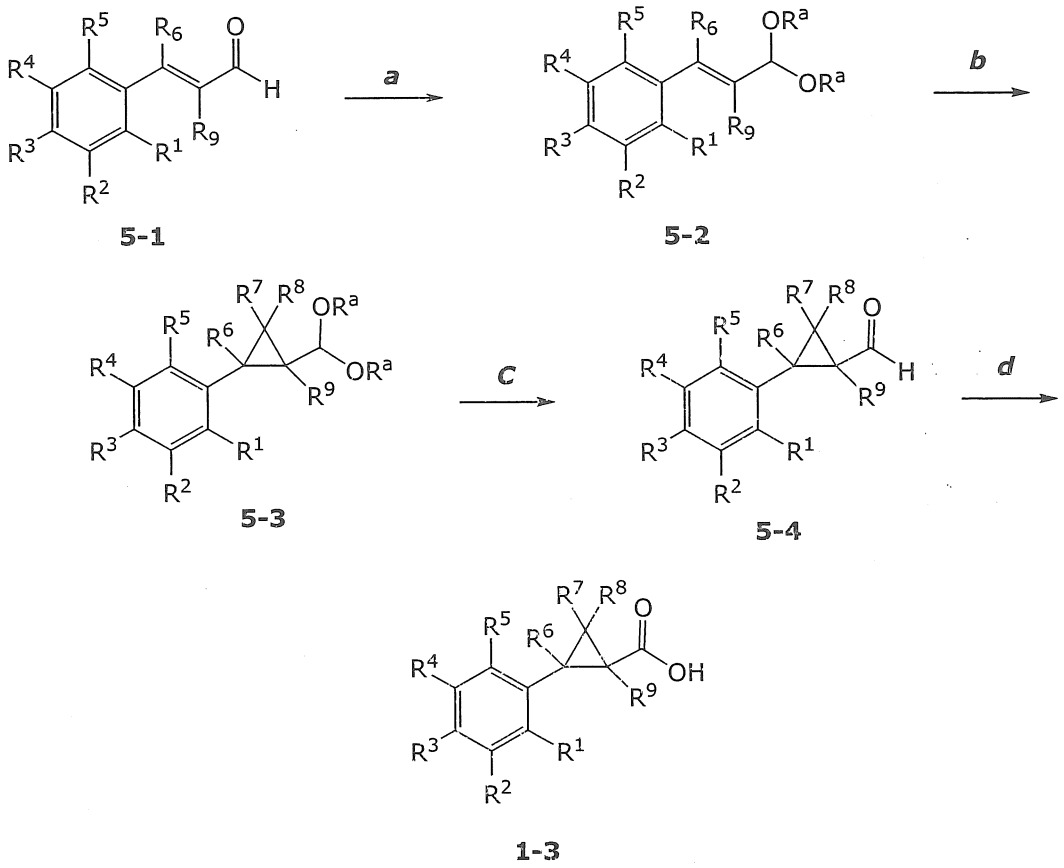
Sơ đồ 4



Theo một số phương án, 1-3 có thể được điều chế từ α,β-aldehyt không no 5-1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, và R^9 như trước đây. Sẽ được hiểu bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này là hợp chất 5-1 có thể được tổng hợp qua sự ngưng tụ Aldol

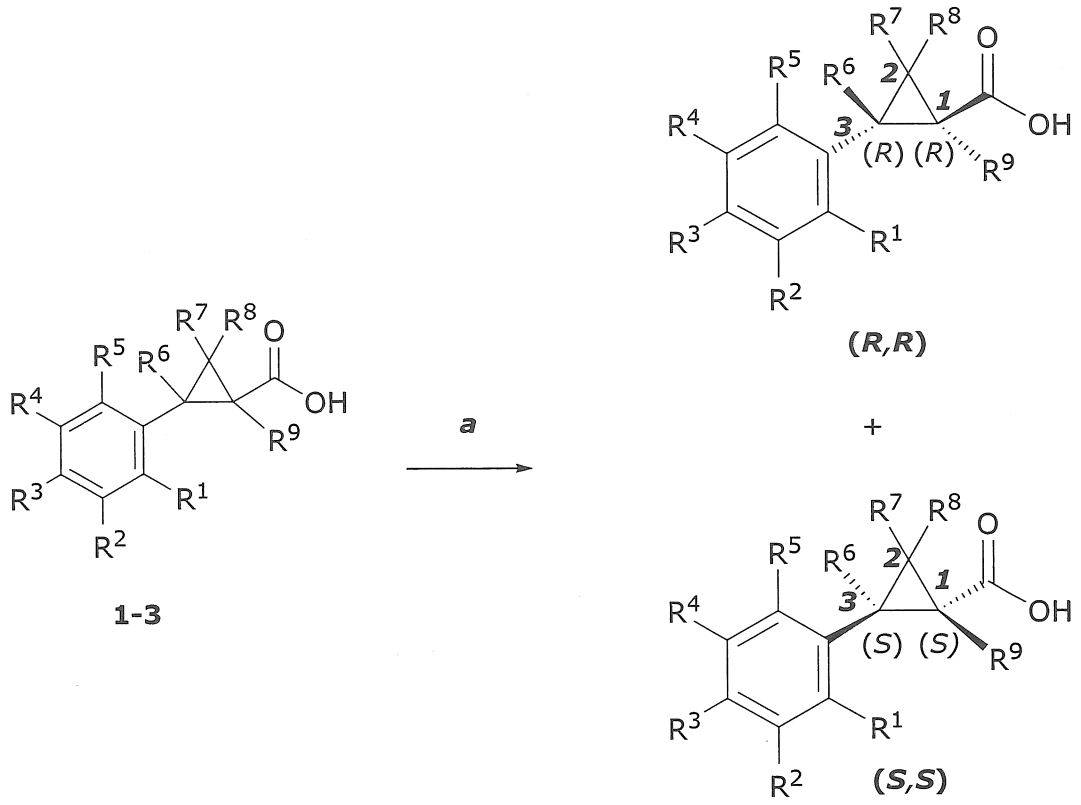
(xem Yoshikawa, M.; Kamei, T. PCT Int. Appl. 2010123006, 2010) của aldehyt và axetaldehyt được thế thích hợp, có bán sẵn trên thị trường. Việc xử lý 5-1 bằng (C_1-C_6)alkyl orthoformat, với sự có mặt của axit có độ pH nằm trong khoảng 0-5 như axit bromhydric, *N*-bromsucxinimit, axit hydrocloric, *N*-closucxinimit, và pyridin *p*-toluensulfonat (PPTS), trong dung môi (C_1-C_6)alkanol, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ môi trường và dưới áp lực môi trường xung quanh tạo ra axetal 5-2, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, và R^9 đã được bộc lộ trước đây và R^a là (C_1-C_6)alkyl hoặc R^a và R^a cùng nhau có thể tạo ra axetal vòng (Sơ đồ 5, bước *a*). Axetal 5-2 có thể được chuyển thành xyclopropyl axetal 5-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, và R^a đã được bộc lộ trước đây, bằng cách xử lý bằng gốc carben như haloform, ví dụ, bromform hoặc cloroform, với sự có mặt của an inorganic base, như natri hoặc kali hydroxit hoặc natri hoặc kali carbonat, và xúc tác chuyển pha như benzyl trietylammoni clorua, (−)-*N*-dodexyl-*N*-metylephedrin bromua, tetrametylammoni bromua, tetrapropylammoni bromua, tetrabutylammoni tetrafloborat, tetrametylammoni clorua hoặc tetrabutylammoni hexaflophosphat ở nhiệt độ môi trường lên đến dưới điểm sôi của haloform (Sơ đồ 5, bước *b*). Chú ý: Bước B là phản ứng tỏa nhiệt và việc kiểm soát cẩn thận sự tỏa nhiệt này nên được tập luyện khi thực hiện phản ứng này. Xyclopropyl axetal 5-3 có thể được chuyển hóa thành aldehyt 5-4, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 đã được bộc lộ trước đây, trong dung môi có cực được chọn từ nhóm bao gồm axeton, axetonitril, metanol, etanol, nitroetan, *N,N*-dimetylformamit, dimetyl sulfoxit, etyl axetat, tetrahydrofuran và 1,4-dioxan, với sự có mặt của axit vô cơ chứa nước được chọn từ nhóm bao gồm nitric acid, axit hydrocloric, axit bromhydric, và axit sulfuric (Sơ đồ 5, bước *c*) ở nhiệt độ môi trường. Axit xyclopropyl 1-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 đã được bộc lộ trước đây, có thể thu được bằng việc oxi hóa aldehyt 5-4 bằng chất oxi hóa như natri permanganat hoặc kali permanganat, hoặc dưới các điều kiện oxi hóa Pinnick trong dung môi không proton phân cực được chọn từ nhóm bao gồm axeton, axetonitril, *N,N*-dimetylformamit, dimetyl sulfoxit, etyl axetat, tetrahydrofuran và 1,4-dioxan ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ môi trường (Sơ đồ 5, bước *d*). Việc phòng ngừa an toàn theo tiêu chuẩn nên được tập luyện do sự tỏa nhiệt có thể xảy ra khi thực hiện phản ứng này.

Sơ đồ 5



Sẽ được hiểu bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này là, theo một số phương án, axit xyclopropyl 1-3, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, và R^9 đã được bộc lộ trước đây, có thể được tạo ra thành các đồng phân đối hình của nó (*R,R*) và (*S,S*) qua phương pháp như phương pháp trong Kovalenko V. N., Kulinkovich O. G. *Tetrahedron: Asymmetry* 2011, *22*, 26 (Sơ đồ 6, bước *a*).

Sơ đồ 6

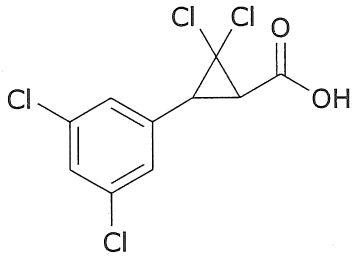


Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ này là nhằm mục đích minh họa và không được hiểu là giới hạn sáng chế đối với chỉ các phương án được bộc lộ trong các ví dụ này.

Nguyên liệu ban đầu, chất phản ứng, và dung môi mà thu được từ nguồn thương mại được sử dụng mà không cần tinh chế thêm. Dung môi khan được mua là Sure/Seal™ từ Aldrich và sử dụng như đã được thừa nhận. Điểm nóng chảy thu được trên thiết bị đo điểm nóng chảy bằng ống mao quản Thomas Hoover Unimelt hoặc hệ thống đo điểm nóng chảy tự động OptiMelt từ Stanford Research Systems và không sửa được. Các ví dụ sử dụng "nhiệt độ trong phòng" hoặc "nhiệt độ môi trường" được thực hiện trong phòng thí nghiệm có điều chỉnh môi trường với nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 °C đến 24 °C. Hợp chất được lấy tên đã biết của chúng, có tên theo các chương trình đặt tên nằm trong ISIS Draw, ChemDraw, hoặc ACD Name Pro. Nếu các chương trình này không thể đặt tên hợp chất,hợp chất này được đặt tên sử dụng các quy tắc đặt tên thông thường. Dữ liệu phổ ^{1}H NMR theo ppm (δ) và ghi ở 300, 400, 500, hoặc 600 MHz; dữ liệu phổ ^{13}C NMR theo ppm (δ) và ghi ở 75, 100, hoặc 150 MHz, và dữ liệu phổ ^{19}F NMR theo ppm (δ) và ghi ở 376 MHz, trừ khi có quy định khác.

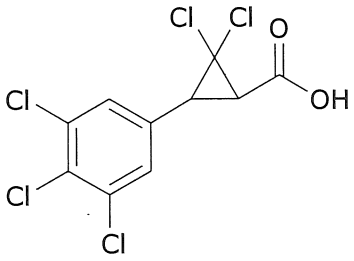
Ví dụ 1: Điều chế hợp chất axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxylic (C1)



Bổ sung ruteni(III) clorua (0,080g, 0,39mmol) vào hỗn hợp được khuấy *trans*-1,3-diclo-5-(-2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C22) (2,8g, 7,7mmol) và natri periodat (33g, 160mmol) theo tỷ lệ nước:etyl axetat:axetonitril (8:1:1, 155ml) ở nhiệt độ 23°C. Hỗn hợp màu nâu hai pha thu được được khuấy mạnh ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 5 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với nước (1000ml) và chiết tách với diclometan (4 x 200ml). Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô Phần còn lại được pha loãng với dung dịch natri hydroxit (1 M, 100ml) và tinh chế bằng dietyl ete (4 x 50ml). Lớp chứa nước được điều chỉnh đến độ pH 2, sử dụng axit clohydric cô đặc, và chiết tách với diclometan (3 x 50ml). Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô để thu được title product là bột màu nâu nhạt (0,78g, 34%): mp 117 - 120°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,38 (br s, 1H), 7,52 - 7,65 (m, 3H), 3,57 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); IR (màng mỏng) 3083 (s), 3011 (s), 1731 (s), 1590 (w), 1566 (s), 1448 (w), 1431 (m), 1416 (m) cm^{-1}.

Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 1:

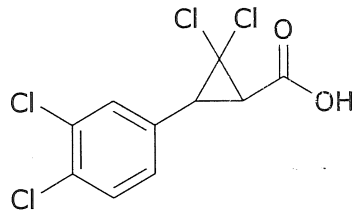
Axit trans-2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropancarboxylic(C2)



Được phân lập dưới dạng bột màu vàng (1,5g, 39%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,31 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 3,40 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 2,86 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR

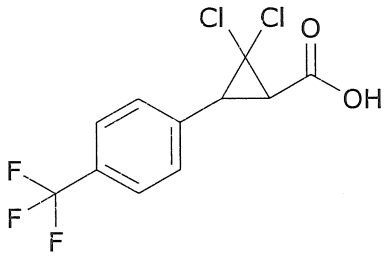
(101 MHz, $CDCl_3$) δ 171,05, 134,55, 132,44, 131,75, 128,89, 61,18, 39,26, 37,14; ESIMS *m/z* 333 ([M-H]$^-$).

axit trans-2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropancarboxylic(C3)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (3,2g, 51%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,47 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 7,37 (d, *J* = 1,6 Hz, 1H), 7,12 (ddd, *J* = 8,3, 2,1, 0,6 Hz, 1H), 3,43 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 2,86 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 171,52, 132,91, 132,76, 132,29, 130,66, 130,62, 128,02, 61,48, 39,65, 37,13; ESIMS *m/z* 298 ([M-H]$^-$).

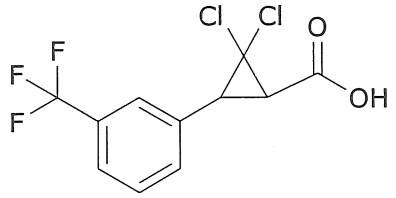
Ví dụ 2: Điều chế hợp chất axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-(triflometyl) phenyl)xyclopropancarboxylic(C4)



Bổ sung ruteni(III) clorua (0,100g, 0,400mmol) ở nhiệt độ 23°C vào hỗn hợp được khuấy *trans*-1-(2,2-diclo-3-(4-(triflometyl) phenyl)xyclopropyl)-4-metoxybenzen (C25) (3,50g, 9,60mmol) và natri periodat (30,8g, 144mmol) theo hệ nước:etyl axetat:axetonitril (8:1:1, 200ml). Hỗn hợp thụ được được khuấy mạnh ở nhiệt độ 23°C trong thời gian khoảng 5 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan và tinh chế bằng nước. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh hợp chất mong muốn là chất rắn màu trắng nhạt (0,630g, 38%): mp 100 - 102°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,43 (brs, 1H), 7,77 - 7,73 (m, 2H), 7,67 - 7,64 (m, 2H), 3,55 (d, *J* = 8,8 Hz, 1H), 3,44 (d, *J* = 8,8 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 347 ([M-H]$^-$).

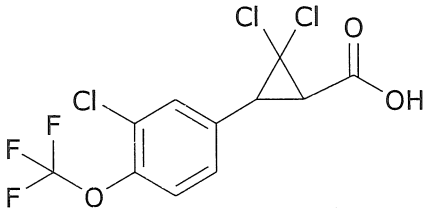
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 2:

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-(triflometyl) phenyl)xyclopropan carboxylic (C5)



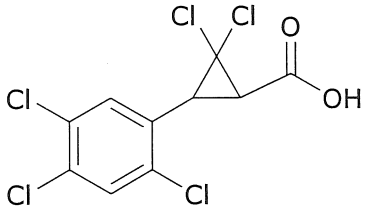
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,81g, 33%): mp 86 - 88°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,37 (brs, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,76 - 7,69 (m, 2H), 7,65 - 7,59 (m, 1H), 3,59 - 3,51 (m, 2H); ESIMS *m/z* 297 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-(triflometoxy) phenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C6)



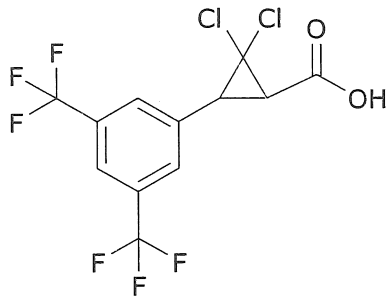
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,3g, 19%): mp 134 - 136°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,45 (brs, 1H), 7,82 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,60 - 7,53 (m, 2H), 3,53 - 3,47 (m, 2H); ESIMS *m/z* 347 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(2,4,5-triclophenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C7)



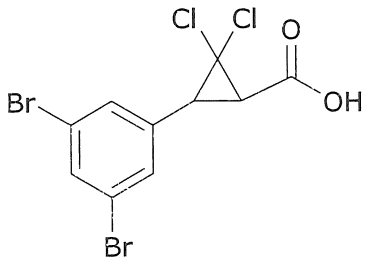
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,267g, 18%): mp 189 - 192°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,44 (brs, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 3,52 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 3,29 (d, J = 8,2 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 333 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3,5-bis(triflometyl) phenyl)-2,2-dicloxyclopropanaxit carboxylic (C8)



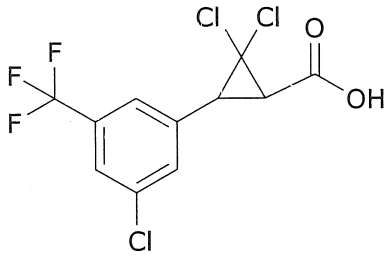
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,5g, 31%): mp 112 - 114°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,43 (brs, 1H), 8,22 (s, 2H), 8,08 (s, 1H), 3,80 - 3,71 (m, 2H); ESIMS *m/z* 365 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-dibromphenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C9)



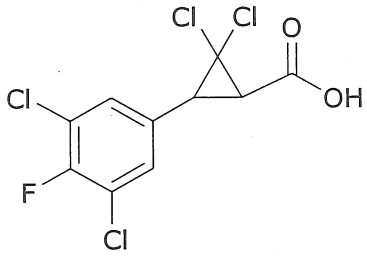
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,5g, 24%): mp 157 - 159°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,36 (brs, 1H), 7,81 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,72 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 3,57 - 3,53 (m, 1H), 3,51 - 3,47 (m, 1H); ESIMS *m/z* 387 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-5-(triflometyl) phenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C10)



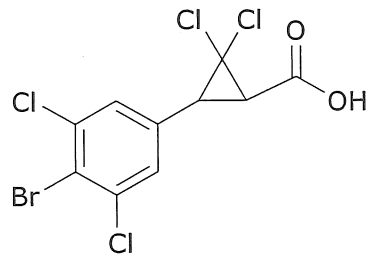
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,73g, 28%): mp 113 - 115°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,39 (brs, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 3,69 - 3,60 (m, 2H); ESIMS *m/z* 333 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-flophenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C11)



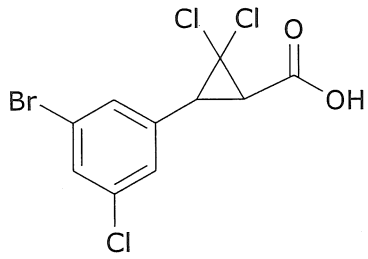
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,539g, 34%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 13,37 (brs, 1H), 7,71 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 3,42 (s, 2H); ESIMS m/z 317 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(4-brom-3,5-diclophenyl)-2,2-dicloxyclopropanaxit carboxylic (C12)



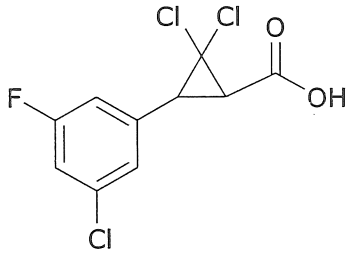
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,100g, 10%): ^{1}H NMR (400MHz, DMSO-d_6) δ 13,37 (brs, 1H), 7,76 (s, 3H), 3,57 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,48 (d, J = 8,8 Hz, 1H); ESIMS m/z 377 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-5-clophenyl)-2,2-dicloxyclopropanaxit carboxylic (C13)



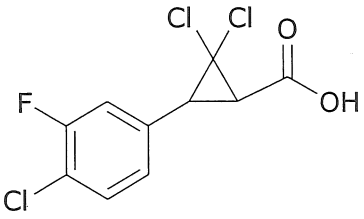
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,4g, 25%): mp 161 - 163°C; ^{1}H NMR (400MHz, DMSO-d_6) δ 13,38 (br s, 1H), 7,70 (d, J = 5,3 Hz, 2H), 7,66 - 7,52 (m, 1H), 3,59 - 3,43 (m, 2H); ESIMS m/z 341 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-5-flophenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C14)



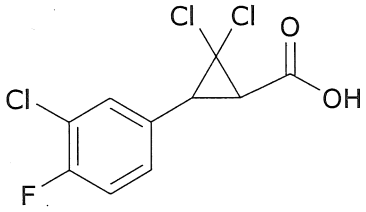
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,700g, 25%): mp 138 - 140°C; ^{1}H NMR (400MHz, DMSO-d_6) δ 13,38 (brs, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,42 (td, J = 2,0, 8,7 Hz, 1H), 7,37 (d, J = 9,8 Hz, 1H), 3,52 (q, J = 8,5 Hz, 2H); ESIMS *m/z* 281 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-flophenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C15)



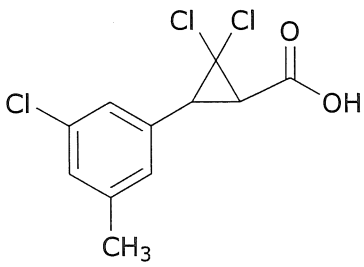
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,500g, 20%): mp 140 - 142°C; ^{1}H NMR (400MHz, DMSO-d_6) δ 13,40 (brs, 1H), 7,59 (m, 1H), 7,55 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,33 (dd, J = 2,0, 8,4 Hz, 1H), 3,55 - 3,38 (m, 2H); ESIMS *m/z* 281 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C16)



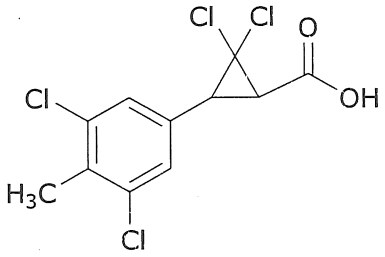
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,0g, 53%): mp 121 - 123°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,35 (brs, 1H), 7,71 (dd, J = 2,0, 7,2 Hz, 1H), 7,53 - 7,35 (m, 2H), 3,50 - 3,41 (m, 2H); ESIMS *m/z* 281 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-5-metylphenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C17)



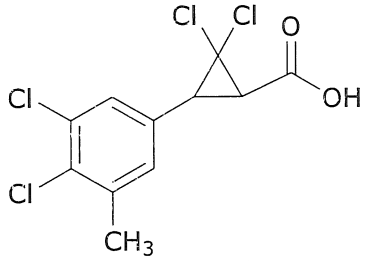
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,0g, 42%): mp 124 - 126°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,33 (brs, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,23 (s, 1H), 7,21 (s, 1H), 3,38 (s, 2H), 2,31 (s, 3H); ESIMS *m/z* 277 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metylphenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C18)



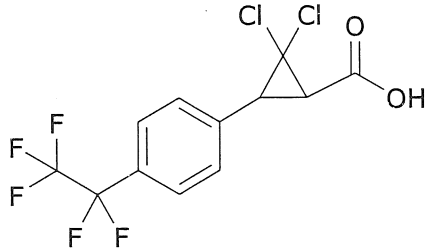
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,8g, 40%): mp 181 - 183°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,40 (s, 1H), 7,56 (s, 2H), 3,53 - 3,50 (m, 1H), 3,46 - 3,43 (m, 1H), 2,40 (s, 3H); ESIMS *m/z* 311 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,4-diclo-5-metylphenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C19)



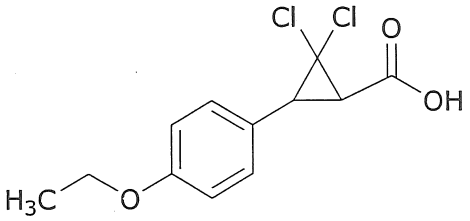
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,73g, 45%): mp 157 - 159°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,40 (s, 1H), 7,59 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,44 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 3,43 (q, J = 8,5 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H); ESIMS *m/z* 311 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-(perfloetyl) phenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C20)



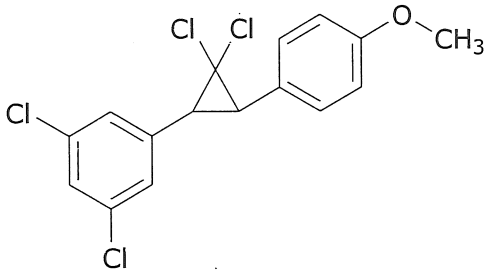
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,020g, 10%): mp 116 - 118°C; ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,63 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,42 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 3,53 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,94 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 347 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-etoxyphenyl)xyclopropanaxit carboxylic (C21)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,025g, 5%): mp 129 - 130°C; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,88 (d, J = 8,31 Hz, 2H), 4,03 (q, J = 6,8 Hz, 2H), 3,41 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 2,81 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 1,41 (t, J = 6,8 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 273 ([M-H]$^-$).

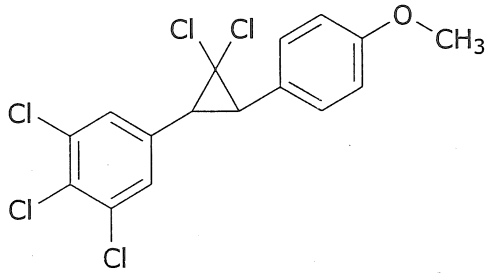
Ví dụ 3: Điều chế hợp chất *trans*-1,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C22)



Bổ sung natri hydroxit chứa nước (50%, 6,8ml, 130mmol) vào dung dịch được khuấy (*E*)-1,3-diclo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C43) (2,4g, 8,6mmol) và *N*-benzyl-*N*,*N*-dietyletanamin clorua (0,20g, 0,86mmol) in cloroform (14ml, 170mmol) ở nhiệt độ 23°C. Hai pha, hỗn hợp màu nâu đậm được khuấy mạnh ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 24 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với nước (200ml) và chiết tách với diclometan (2 x 100ml). Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu nâu (2,8g, 90%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,34 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,21 - 7,30 (m, 4H), 6,93 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,14 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,08 (d, J = 8,5 Hz, 1H); IR (màng mỏng) 3075 (w), 2934 (w), 2836 (w), 1724 (w), 1640 (w), 1609 (m), 1584 (m), 1568 (s), 1513 (s) cm^{-1}.

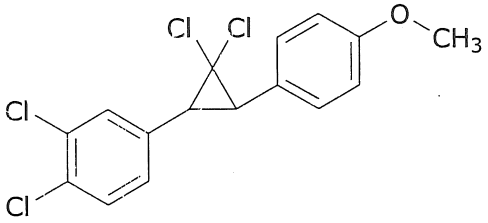
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 3:

trans-1,2,3-triclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C23)



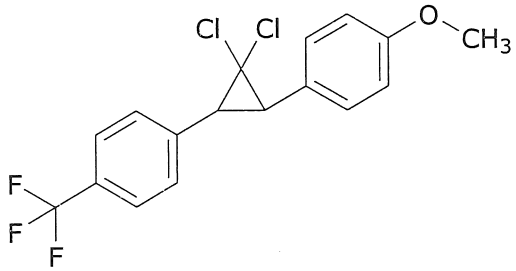
Được phân lập dưới dạng bọt màu tối (4,7g, 100%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,40 (d, J = 0,6 Hz, 2H), 7,29 - 7,22 (m, 2H), 6,96 - 6,89 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,12 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,06 (d, J = 8,7 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 159,46, 135,08, 134,23, 130,91, 129,85, 129,16, 125,42, 114,02, 64,67, 55,32, 39,62, 38,48.

trans-1,2-diclo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C24)



Được phân lập dưới dạng dầu màu cam đỏ (7,6g, 99%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,47 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 7,45 (bs, 1H), 7,30 - 7,23 (m, 2H), 7,21 (dd, J = 8,2, 1,9 Hz, 1H), 6,96 - 6,90 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,11 (app. q, J = 8,8 Hz, 2H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 159,39, 134,90, 132,62, 131,99, 130,90, 130,40, 129,90, 128,33, 125,81, 113,98, 64,94, 55,33, 39,52, 38,75.

Ví dụ 4: Điều chế hợp chất *trans*-1-(2,2-diclo-3-(4-(triflometyl) phenyl)xyclopropyl)-4-metoxybenzen (C25)

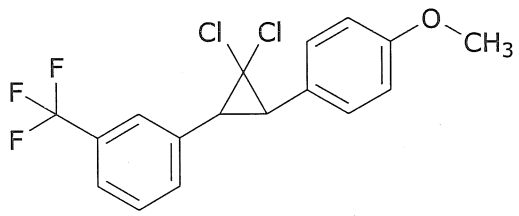


Bổ sung natri hydroxit chứa nước (50%, 8,64g, 216mmol) trong nước (17ml) ở nhiệt độ 23°C, và hỗn hợp thu được được khuấy mạnh ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 16 giờ vào dung dịch được khuấy (*E*)-1-metoxy-4-(4-(triflometyl)styryl)benzen (C46) (4,00g, 14,0mmol) và *N*-benzyl-*N*,*N*-dietyletanamin clorua (0,320g, 14,0mmol) in

cloroform (23,1g, 288mmol). Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với nước và chiết tách với diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô, tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột nhanh để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,70g, 68%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,65 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,94 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,19 (s, 2H); ESIMS *m/z* 361 ($[M+H]^+$).

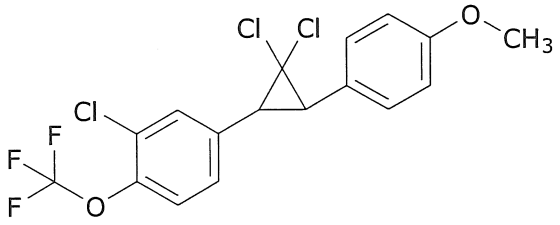
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 4:

trans-1-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-3-(triflometyl)benzen (C26)



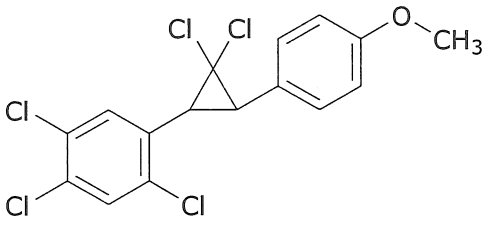
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu(3,5g, 67%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,62 - 7,50 (m, 4H), 7,29 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,94 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,35 - 7,25 (m, 3H), 7,97 - 6,88 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,19 (m, 2H); ESIMS *m/z* 361 ($[M+H]^+$).

trans-2-clo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-1-(triflometoxy)benzen (C27)



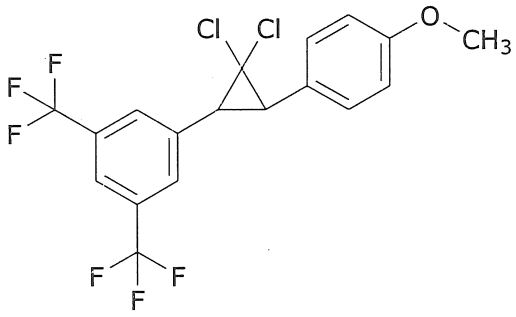
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,5g, 65%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,57 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,44 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,35 - 7,25 (m, 3H), 7,97 - 6,88 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 2H); ESIMS *m/z* 411 ($[M+H]^+$).

trans-1,2,4-triclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C28)



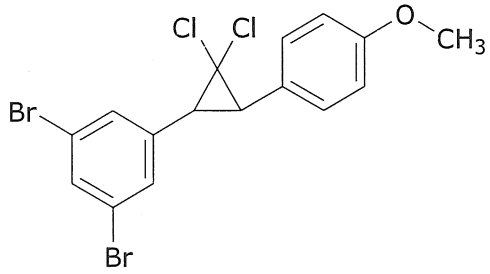
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu(2,0g, 58%): EIMS *m/z* 394 ($[M]^+$).

trans-1-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-3,5-bis(triflometyl)benzen (C29)



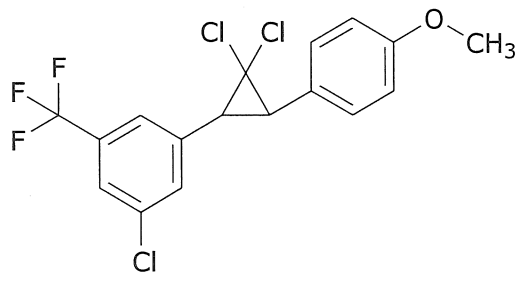
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu (3,0g, 61%): EIMS *m/z* 428 ($[M]^+$).

trans-1,3-dibrom-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C30)



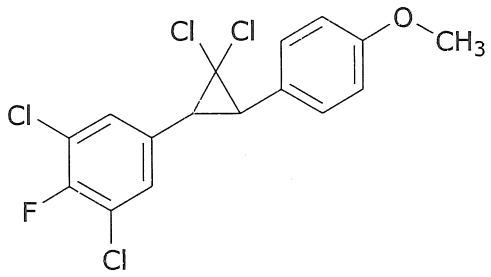
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu (3,0g, 57%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,64 (s, 1H), 7,45 (s, 2H), 7,25 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 6,92 (d, *J* = 9,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 2H); ESIMS *m/z* 453 ($[M+H]^+$).

trans-1-clo-3-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-5-(triflometyl)benzen (C31)



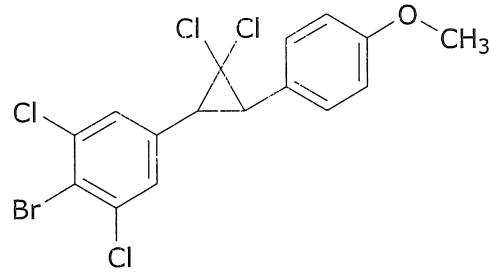
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu (4,0g, 74%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,64 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,26 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 2H); ESIMS *m/z* 395 ($[M+H]^+$).

trans-1,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-2-flobenzen (C32)



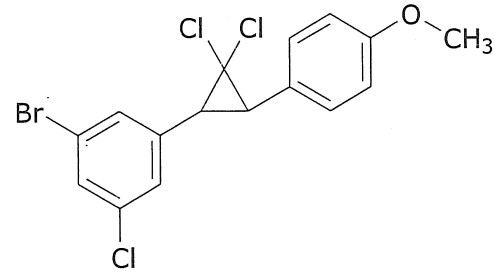
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu (1,6g, 54%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,32 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,12 - 3,05 (m, 2H); ESIMS *m/z* 297 ($[M+H]^+$).

trans-2-brom-1,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C33)



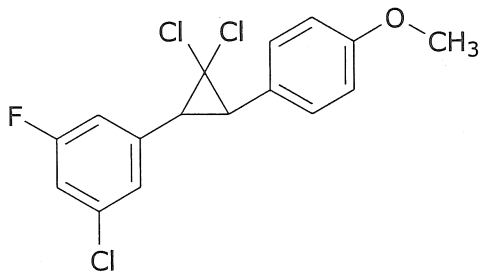
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,5g, 44%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,20 (s, 2H), 6,93 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 2H); ESIMS *m/z* 439 ($[M+H]^+$).

trans-1-brom-3-clo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)benzen (C34)



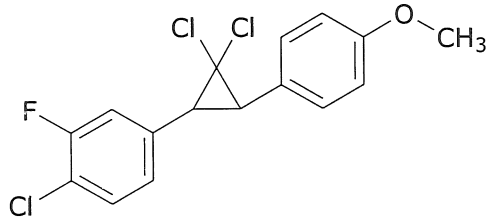
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,5g, 50%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,49 (s, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,28 - 7,24 (m, 3H), 6,92 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,01 (q, J = 8,8 Hz, 2H); ESIMS *m/z* 405 ($[M+H]^+$).

trans-1-clo-3-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-5-flobenzen (C35)



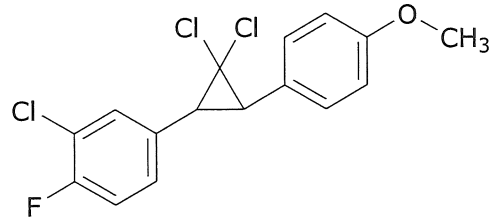
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu (3,5g, 67%): ESIMS *m/z* 345 ($[M+H]^+$).

trans-1-clo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-2-flobenzen (C36)



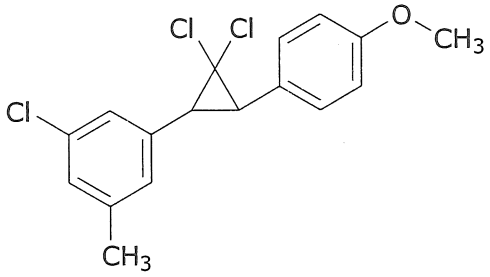
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,5g, 65%): ESIMS *m/z* 345 ($[M+H]^+$).

trans-2-clo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-1-flobenzen (C37)



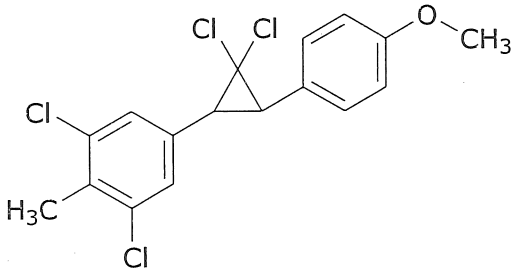
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu(2,0g, 58%): ESIMS *m/z* 345 ($[M+H]^+$).

trans-1-clo-3-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-5-metylbenzen (C38)



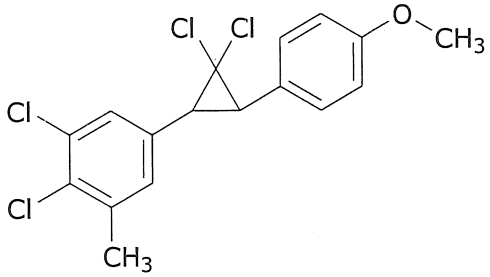
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,0g, 47%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,27 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,14 (s, 2H), 7,06 (s, 1H), 6,92 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,10 (q, J = 8,8 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H); ESIMS *m/z* 341 ($[M+H]^+$).

trans-1,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-2-metylbenzen (C39)



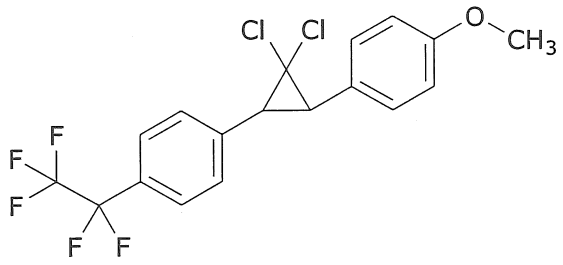
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu (2,5g, 80%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,25 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,88 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H),3,12 - 3,03 (m, 2H), 2,47 (s, 3H); ESIMS *m/z* 375 ($[M+H]^+$).

trans-1,2-diclo-5-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-3-metylbenzen (C40)



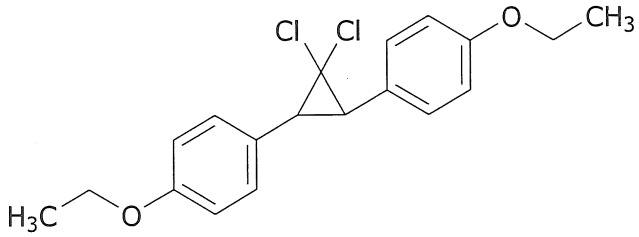
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu (4,0g, 90%): ESIMS *m/z* 375 ($[M+H]^+$).

trans-1-(2,2-diclo-3-(4-(perfloetyl) phenyl)xyclopropyl)-4-metoxybenzen (C41)



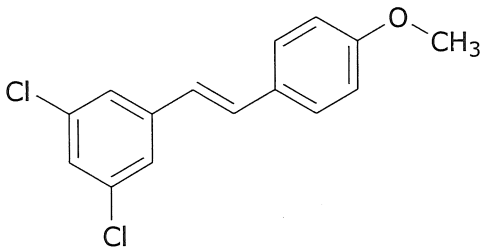
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,5g, 46%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,60 - 7,50 (m, 4H), 7,47 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,92 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,20 (s, 2H); ESIMS *m/z* 411 ($[M+H]^+$).

trans-4,4'-(3,3-dicloxyclopropan-1,2-diyl)bis(etoxybenzen) (C42)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,5g, 45%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,27 (d, J = 8,0 Hz, 4H), 6,90 (d, J = 8,0 Hz, 4H), 4,04 (q, J = 6,8 Hz, 4H), 3,09 (s, 2H), 1,42 (t, J = 6,8 Hz, 6H); ESIMS *m/z* 351 ($[M+H]^+$).

Ví dụ 5: Điều chế hợp chất (*E*)-1,3-diclo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C43)

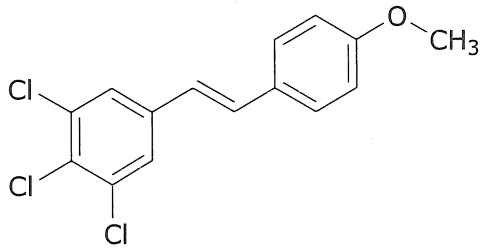


Bột natri metoxit (98%, 0,63g, 11mmol) được bổ sung vào dung dịch được khuấy 3,5-diclobenzaldehyt (2,0g, 11mmol) và dietyl 4-metoxybenzylphosphonat (2,0ml, 11mmol) trong *N,N*-dimetylformamit khô (38ml) ở nhiệt độ 23°C. Hỗn hợp màu xanh đậm không đồng nhất thu được được làm nóng đến nhiệt độ 80°C, thu được thành hỗn hợp màu nâu đậm, và khuấy trong thời gian 24 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm mát được pha loãng với nước (500ml) và chiết tách với dietyl ete (3 x 100ml). Các lớp hữu cơ kết hợp được pha loãng với hexan (150ml) và tinh chế bằng nước (300ml). Lớp hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới

dạng dầu màu nâu nhạt (2,4g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,44 (m, 2H), 7,34 (d, J = 2 Hz, 2H), 7,20 (t, J = 2 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 6,91 (m, 2H), 6,82 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); IR (màng mỏng) 2934 (w), 2835 (w), 1724 (w), 1637 (w), 1605 (m), 1581 (m), 1558 (m), 1511 (s) cm^{-1}.

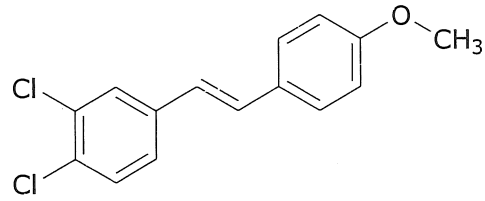
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 5:

(*E*)-1,2,3-triclo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C44)



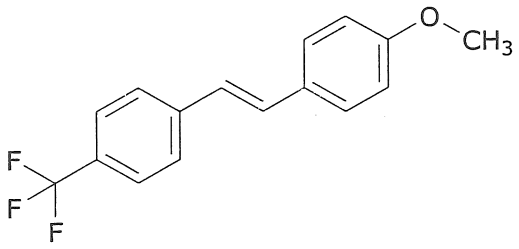
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,7g, 31%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,49 - 7,46 (m, 2H), 7,47 - 7,39 (m, 2H), 7,04 (d, J = 16,3 Hz, 1H), 6,93 - 6,89 (m, 2H), 6,78 (d, J = 16,3 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 159,46, 135,08, 134,23, 130,91, 129,85, 129,16, 125,42, 114,02, 64,67, 55,32, 39,62, 38,48; EIMS *m/z* 313 ($[M]^+$).

(*E*)-1,2-diclo-4-(4-metoxystyryl)benzen (C45)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (6,0g, 53%): mp 91 - 94 °C; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,56 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,46 - 7,42 (m, 2H), 7,39 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,29 (dd, J = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 16,2 Hz, 1H), 6,93 - 6,88 (m, 2H), 6,85 (d, J = 16,3 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 159,75, 137,86, 132,72, 130,58, 130,49, 130,12, 129,33, 127,96, 127,77, 125,37, 123,98, 114,24, 55,35; EIMS *m/z* 279 ($[M]^+$).

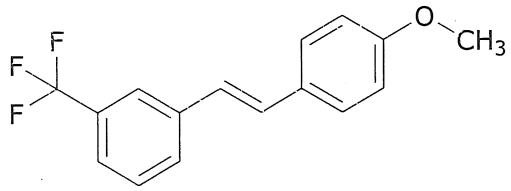
Ví dụ 6: Điều chế hợp chất (*E*)-1-metoxy-4-(4-(triflometyl)styryl)benzen (C46)



Bổ sung natri metoxit powder (1,86g, 34,0mmol) vào dung dịch được khuấy dietyl 4-metoxybenzyl phosphonat (8,89g, 34,0mmol) in *N*,*N*-dimetylformamit (30ml). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm mát về nhiệt độ 0°C và 4-(triflometyl)benzaldehyt (5,00g, 28,0mmol) in *N*,*N*-dimetylformamit (30ml) được bổ sung từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ 60 °C trong thời gian 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước đá lạnh, được lọc, và làm khô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,60g, 80%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,61 - 7,52 (m, 4H), 7,47 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,14 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 6,97 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 6,91 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 279 ($[M+H]^+$).

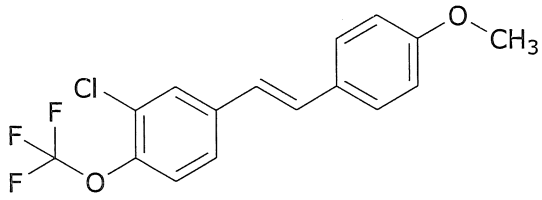
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 6:

(*E*)-1-(4-metoxystyryl)-3-(triflometyl)benzen (C47)



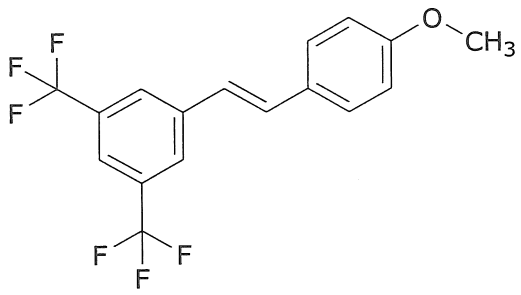
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (4,0g, 85%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,72 (s, 1H), 7,64 (d, *J* = 6,8 Hz, 1H), 7,50 - 7,44 (m, 4H), 7,12 (d, *J* = 16,0 Hz, 1H), 6,98 (d, *J* = 16,0 Hz, 1H), 6,91 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 279 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-clo-4-(4-metoxystyryl)-1-(triflometoxy)benzen (C48)



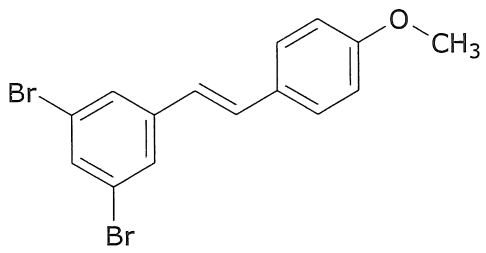
Được phân lập: ESIMS *m/z* 329 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-(4-metoxystyryl)-3,5-bis(triflometyl)benzen (C49)



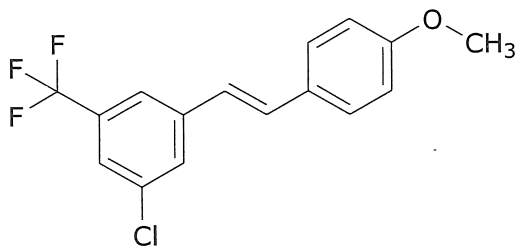
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (4,0g, 56%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,88 (s, 2H), 7,70 (s, 1H), 7,49 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,19 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 6,99 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 6,92 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 3,84 (m, 3H); ESIMS *m/z* 347 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1,3-dibrom-5-(4-metoxystyryl)benzen (C50)



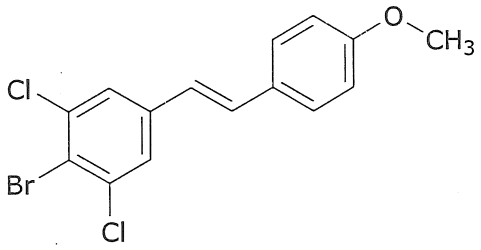
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,2g, 54%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,53 (s, 1H), 7,50 (s, 2H), 7,43 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,05 (d, *J* = 16,2 Hz, 1H), 6,90 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 6,79 (d, *J* = 16,2 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H); ESIMS *m/z* 367 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-clo-3-(4-metoxystyryl)-5-(triflometyl)benzen (C51)



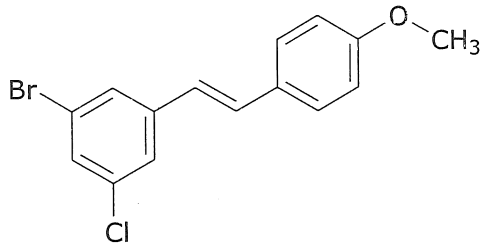
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (4,3g, 58%): ^{1}H NMR (300MHz, $CDCl_3$) δ 7,62 (s, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 3H), 7,12 (d, *J* = 16,2 Hz, 1H), 6,95 - 6,85(m, 3H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 313 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-brom-1,3-diclo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C52)



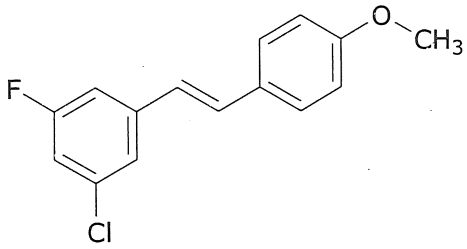
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,8g, 40%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,46 (s, 2H), 7,43 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,07 (d, J = 13,5 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,73 (d, J = 13,5 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 358 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-brom-3-clo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C53)



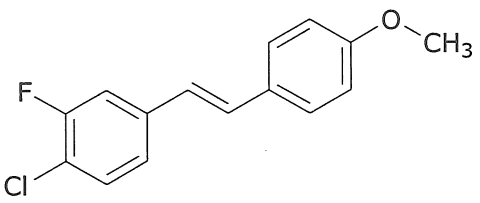
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (4,0g, 63%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,49 (s, 1H), 7,43 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,38 (s, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,05 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 6,91 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,80 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H); ESIMS *m/z* 323 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-clo-3-flo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C54)



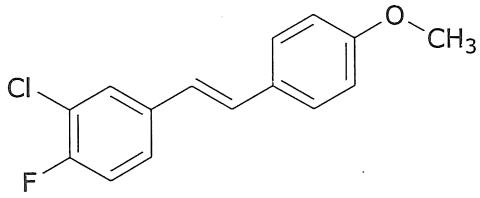
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (5,0g, 60%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,45 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,10 - 7,0 (m, 3H), 6,96 - 6,80 (m, 4H), 3,80 (s, 3H); ESIMS *m/z* 263 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-clo-2-flo-4-(4-metoxystyryl)benzen (C55)



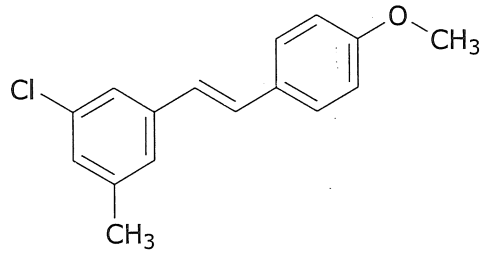
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (7,0g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,44 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,35 - 7,31 (m, 1H), 7,28 - 7,24 (m, 1H), 7,17 (dd, J = 1,6, 8,0 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H); ESIMS *m/z* 263 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-clo-1-flo-4-(4-metoxystyryl)benzen (C56)



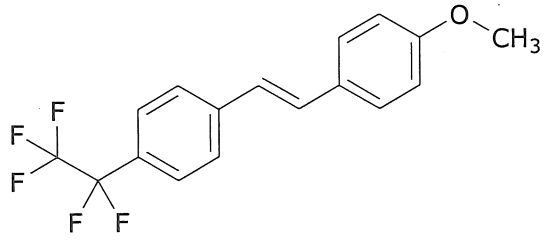
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (6,0g, 72%): ESIMS *m/z* 263 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-clo-3-(4-metoxystyryl)-5-metylbenzen (C57)



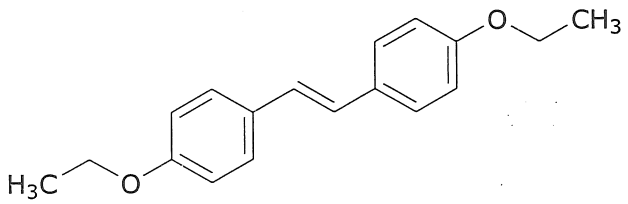
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (5,0g, 60%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,44 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,28 (s, 1H), 7,15 (s, 1H), 7,05 - 7,00 (m, 2H), 6,91 - 6,83 (m, 3H), 3,83 (s, 3H), 2,24 (s, 3H); ESIMS *m/z* 259 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-metoxy-4-(4-(perfloetyl)styryl)benzen (C58)



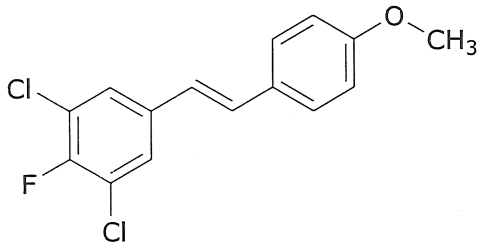
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,5g, 42%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,60 - 7,50 (m, 4H), 7,47 (d, J = 8,8 Hz, 2H),7,15 (d, J = 16,8 Hz, 1H), 6,98 (d, J = 16,8 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H); ESIMS *m/z* 329 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1,2-bis(4-etoxyphenyl)eten (C59)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,7g, 34%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,40 (d, J = 9,0 Hz, 4H), 6,91 (s, 2H), 6,87 (d, J = 9,0 Hz, 4H), 4,05 (q, J = 6,9 Hz, 4H), 1,42 (t, J = 6,9 Hz, 6H); ESIMS *m/z* 269 ($[M+H]^+$).

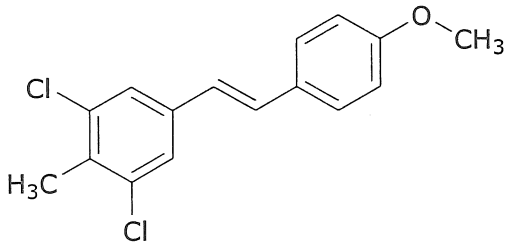
Ví dụ 7: Điều chế hợp chất (*E*)-1,3-diclo-2-flo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C60)



Hỗn hợp được khuấy 5-brom-1,3-diclo-2-flobenzen (2,00g, 8,20mmol), 1-metoxy-4-vinylbenzen (1,32g, 9,80mmol), và trietylamin (20ml) dưới điều kiện khí argon được loại khí trong thời gian 5 phút. Paladi(II) axetat (0,0368g, 0,164mmol) và 1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen (0,181g, 0,328mmol) được bổ sung và phản ứng được làm nóng đến nhiệt độ 90°C trong thời gian 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước và chiết tách với etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô, tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột nhanh để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,60g, 67%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,41 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,31 (s, 1H), 7,37 (s, 1H), 6,96 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,76 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 297 ($[M+H]^+$).

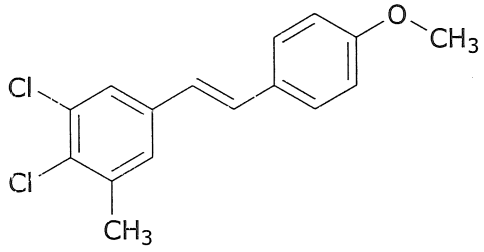
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 7:

(*E*)-1,3-diclo-5-(4-metoxystyryl)-2-metylbenzen (C61)



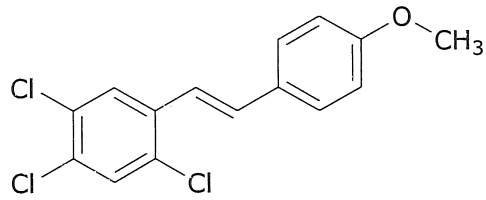
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,5g, 67%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,43 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (s, 2H), 7,02 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 6,90 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 6,79 (d, *J* = 16,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,42 (s, 3H); ESIMS *m/z* 293 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1,2-diclo-5-(4-metoxystyryl)-3-metylbenzen (C62)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,0g, 55%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,50 - 7,40 (m, 3H), 7,24 (s, 1H), 7,02 (d, *J* = 15,9 Hz, 1H), 6,90 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 6,81 (d, *J* = 15,9 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,42 (s, 3H); ESIMS *m/z* 293 ($[M+H]^+$).

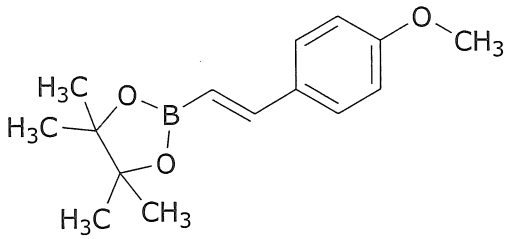
Ví dụ 8: Điều chế hợp chất (*E*)-1,2,4-triclo-5-(4-metoxystyryl)benzen (C63)



Bổ sung 1-brom-2,4,5-triclobenzen (3,0g, 12mmol), 1,2-dimetoxyetan:nước (10:1, 30ml), (*E*)-2-(4-metoxystyryl)-4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan (C64) (3,7g, 14mmol), và kali carbonat (3,2g, 24mmol) vào ống được làm kín. Hỗn hợp phản ứng được loại khí trong thời gian 10 phút có khí argon, sau đó bổ sung tetrakis(triphenylphosphin) paladi(0) (0,55g, 0,48mmol). Hỗn hợp phản ứng được loại khí trong thời gian 10 phút sau đó được làm nóng ở nhiệt độ 90°C trong thời gian 16 giờ.

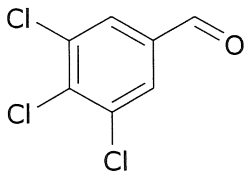
Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước và chiết tách với etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô, tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột nhanh để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,0g, 80%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,73 (s, 1H), 7,50 - 7,45 (m, 3H), 7,20 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 7,02 (d, J = 16 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 3,84 (m, 3H); ESIMS *m/z* 313 ($[M+H]^+$).

Ví dụ 9: Điều chế hợp chất (*E*)-2-(4-metoxystyryl)-4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan (C64)



Bổ sung 1-etylnyl-4-metoxybenzen (4,0g, 30mmol), 4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan (3,3g, 36mmol), zirconoxen hydroclorua (1,2g, 4,0mmol), và trietylamin (2,8ml, 15mmol) bình có cổ tròn 50ml ở nhiệt độ 0°C. Sau đó hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ 65°C trong thời gian 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được đổ in nước và chiết tách với etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô, tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột nhanh để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất bán rắn màu trắng nhạt (3,0g, 38%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,43 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 18,0 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,01 (d, J = 18,0 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H), 1,30 (s, 12H).

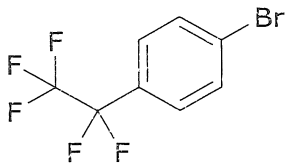
Ví dụ 10: Điều chế hợp chất 3,4,5-triclobenzaldehyt (C65)



Trong lò điều nhiệt được làm khô, nitơ được sục, 500ml bình cổ tròn được lắp với phễu chiết bổ sung cân bằng áp lực, 5-brom-1,2,3-triclobenzen (10,0g, 38,4mmol) được hòa tan trong tetrahydrofuran (100ml), và dung dịch thu được được làm mát trong bể đá dưới điều kiện khí nitơ. Isopropyl magiê clorua (dung dịch tetrahydrofuran 2M, 21,1ml, 42,3mmol) được bổ sung từng giọt với việc khuấy đều trong thời gian 15 phút qua phễu

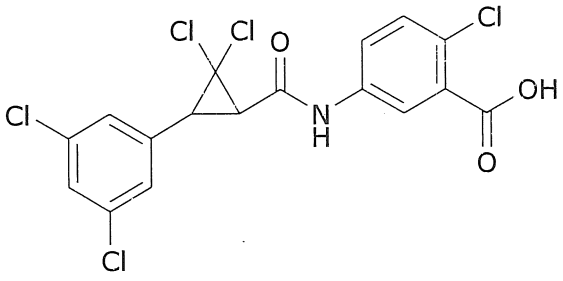
bổ sung. Sau thời gian 0,5 giờ, *N,N*-dimetylformamit (3,72ml, 48,0mmol) được bổ sung vào dung dịch tối màu có khuấy. Sau thời gian 0,5 giờ, axit hydrocloric (1 N, 100ml) được bổ sung có khuấy. Các lớp được phân lập, và lớp hữu cơ được tinh chế bằng nước muối. Các lớp chứa nước được kết hợp được chiết tách với ete, và tổ hợp chất hữu cơ được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (10:1 hỗn hợp hợp chất mong muốn và 1,2,3-triclobenzen, 7,96g, 99%): ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 9,91 (s, 1H), 7,88 (s, 2H); EIMS *m/z* 209 ($[M]^+$).

Ví dụ 11: Điều chế hợp chất 1-brom-4-(perfloetyl)benzen (C66)



Bổ sung 4-*tert*-butyl-2,6-dimetylphenylsulfur triflorua (2,90g, 11,8mmol) và phức hydrogen florua pyridin (0,190g, 9,80mmol) ở nhiệt độ 0 °C vào dung dịch được khuấy 1-(4-bromphenyl)-2,2,2-trifloetanon (5,00g, 19,7mmol) trong diclometan dưới điều kiện khí argon. Hỗn hợp phản ứng được cho phép làm ấm đến nhiệt độ trong phòng và khuấy trong thời gian 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước và chiết tách với etyl axetat. Phần chiết của tổ hợp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dung dịch không màu (1,00g, 20%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,65 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 9,0 Hz, 2H); EIMS *m/z* 274 ($[M]^+$).

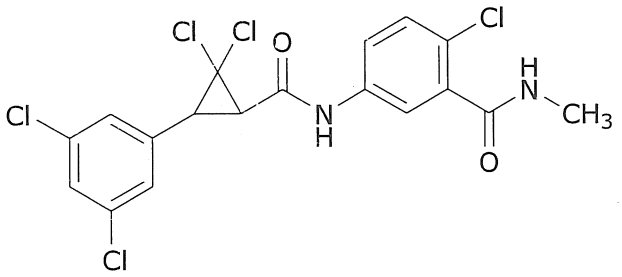
Ví dụ 12: Điều chế hợp chất *axit trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxamido)benzoic (C67)



Bổ sung *N,N*-dimetylformamit (1 giọt) tiếp theo là oxalyl clorua (0,131ml, 1,50mmol) vào dung dịch axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxylic (C1) (0,300g, 1,00mmol) trong diclometan (5,00ml) được khuấy ở nhiệt độ 0°C, trong

thời gian hơn 2 phút. Hỗn hợp nước đá được loại bỏ và phản ứng được cho phép làm ấm đến nhiệt độ trong phòng trong thời gian hơn 90 phút. Phản ứng sau đó được cô đặc để tạo ra chất bán rắn màu vàng cam. Chất bán rắn được hòa tan trong diclometan (3,5ml), và dung dịch được bổ sung chậm vào dung dịch được làm mát axit 5-amino-2-clobenzoic (0,206g, 1,20mmol) và trietylamin (0,209ml, 1,50mmol) trong diclometan (7ml). Bể nước đá được loại bỏ và phản ứng được cho phép làm ấm đến nhiệt độ trong phòng trong thời gian hơn 90 phút. Phản ứng được pha loãng với diclometan (10ml) và tinh chế bằng axit hydrocloric (0,1N). Hỗn dịch thu được được lọc và chất rắn được tinh chế bằng nước. Chất rắn kết tủa được làm khô trong lò chân không ở nhiệt độ 40°C để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu nâu nhạt (0,421g, 93%): mp 234 - 236 °C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,47 (s, 1H), 10,90 (s, 1H), 8,16 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 7,59 (m, 4H), 3,56 (dd, J = 49,8, 8,5 Hz, 2H), 1,09 (m, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 166,26, 165,77, 162,61, 137,57, 137,27, 134,04, 132,18, 131,44, 131,22, 127,88, 127,66, 126,40, 125,92, 122,88, 121,17, 102,37, 62,11, 38,41, 36,83; ESIMS *m/z* 454 ([M+H]$^+$).

Ví dụ 13: Điều chế hợp chất *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metylbenzamit (F1)

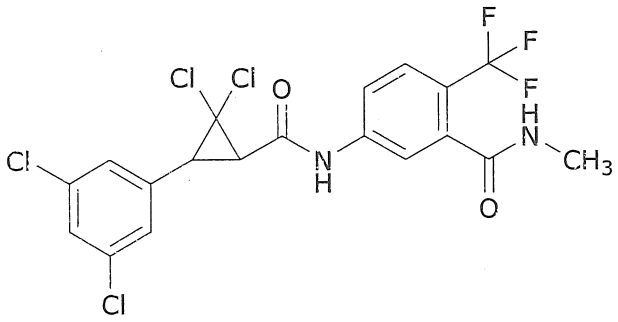


Bổ sung lần lượt 5-amino-2-clo-*N*-metylbenzamit (C68) (0,072g, 0,39mmol) và 4-dimetylaminopyridin (0,052g, 0,42mmol) vào hỗn hợp *axit trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxylic được khuấy(C1) (0,097g, 0,33mmol) và 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)carbodiimit (0,093g, 0,49mmol) trong 1,2-dicloetan (3,3ml) ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng. Phản ứng được khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian 20 giờ. Bổ sung diclometan và hỗn hợp được tinh chế bằng natri bicarbonat chứa nước bão hòa và axit hydrocloric (1N). Pha hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng 0-100% etyl axetat/hexans là

dung dịch rửa giải được tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu vàng (0,047g, 30%).

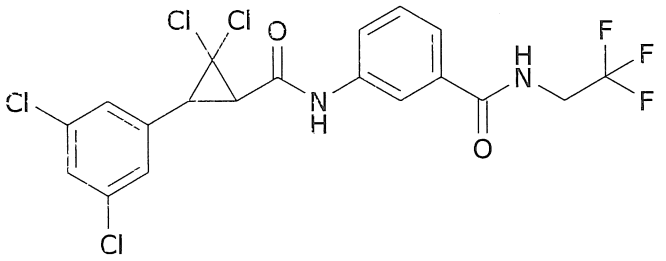
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 13:

trans-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-N-metyl-2-(triflometyl)benzamit (F2)



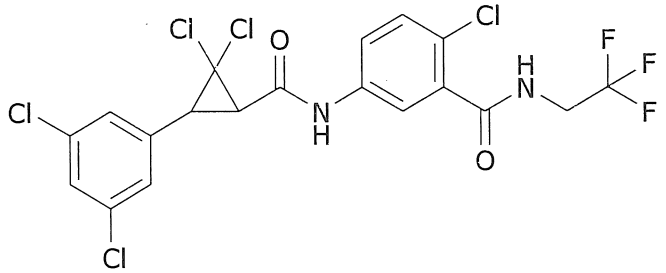
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng (0,051g, 32%).

trans-3-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F3)



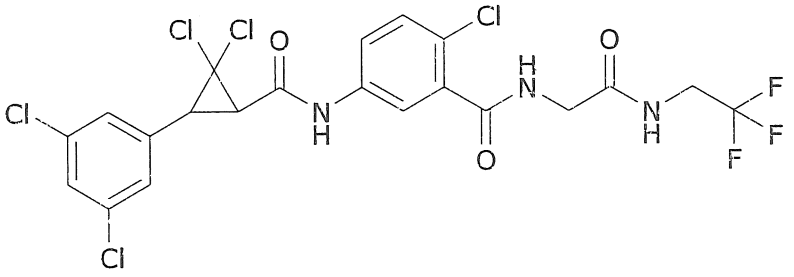
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,155g, 62%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F4)



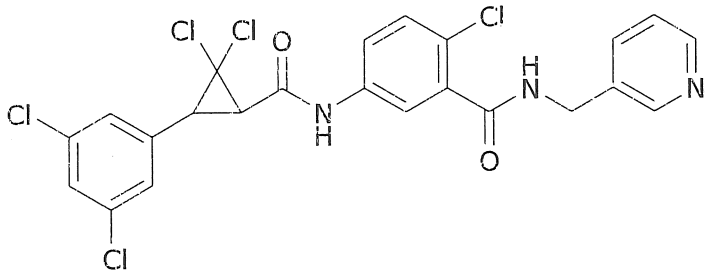
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng (0,081g, 44%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-oxo-2-((2,2,2-trifloetyl)amino)etyl)benzamit (F5)



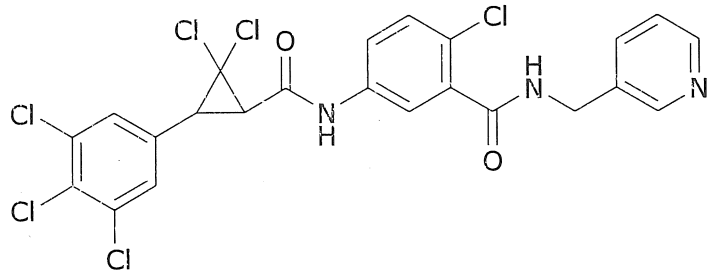
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng (0,065g, 39%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-3-ylmetyl)benzamit (F6)



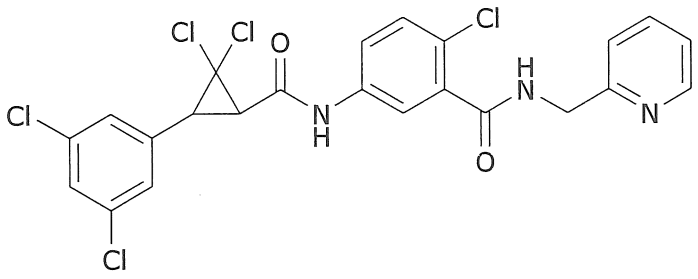
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,091g, 67%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-3-ylmetyl)benzamit (F7)



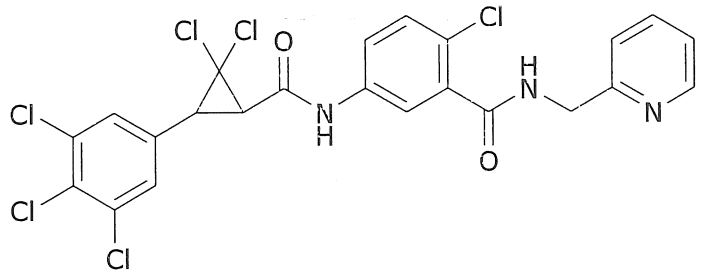
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,051g, 59%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-2-ylmetyl)benzamit (F8)



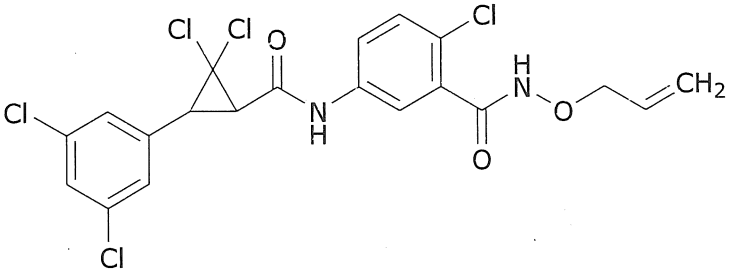
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng nhạt (0,036g, 26%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-2-ylmetyl)benzamit (F9)



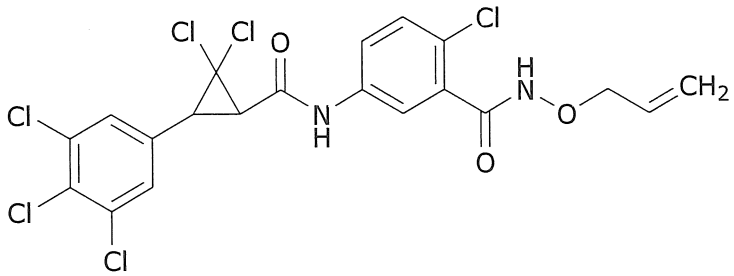
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng nhạt (0,017g, 20%).

trans-*N*-(allyloxy)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F10)



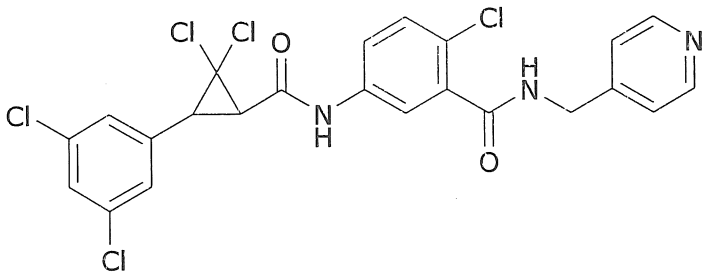
Được phân lập dưới dạng chất bán rắn màu trắng nhạt (0,034g, 27%).

trans-*N*-(allyloxy)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F11)



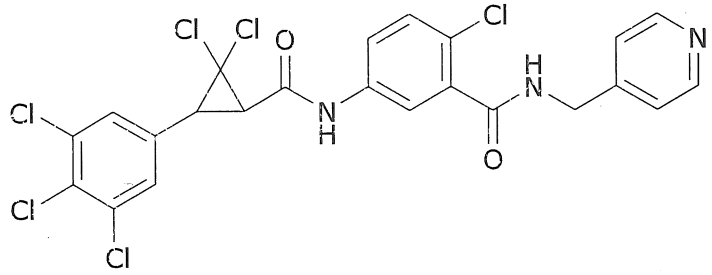
Được phân lập dưới dạng chất bán rắn màu nâu vàng (0,021g, 26%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-4-ylmetyl)benzamit (F12)



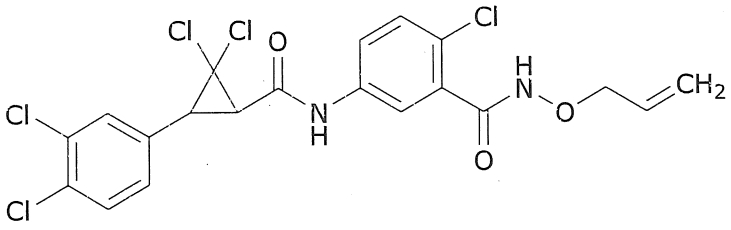
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,100g, 74%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(pyridin-4-ylmetyl)benzamit (F13)



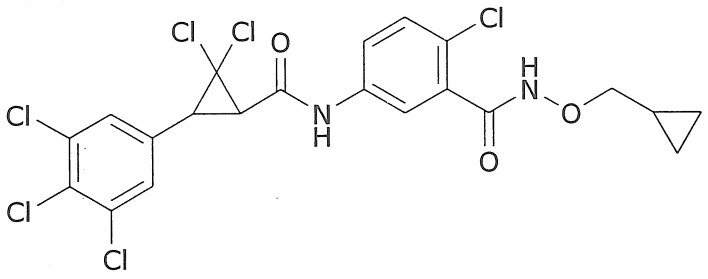
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng nhạt (0,062g, 72%).

trans-*N*-(allyloxy)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F14)



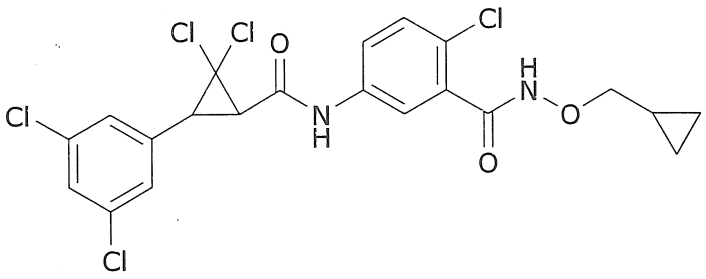
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,062g, 49%).

trans-*N*-2-clo-*N*-(xyclopropylmetoxy)-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F15)



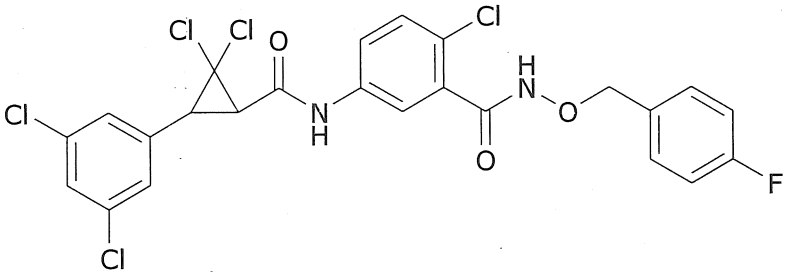
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,056g, 56%).

trans-*N*-2-clo-*N*-(xyclopropylmetoxy)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F16)



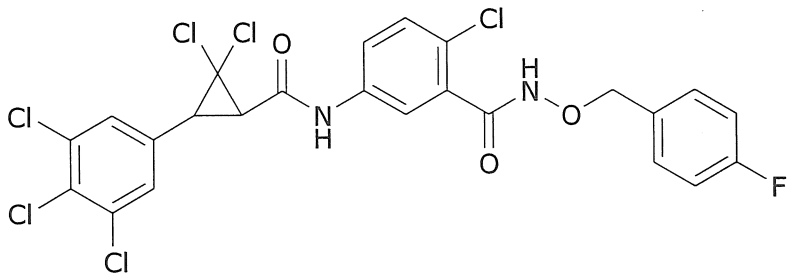
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,066g, 50%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((4-flobenzyl)oxy)benzamit (F17)



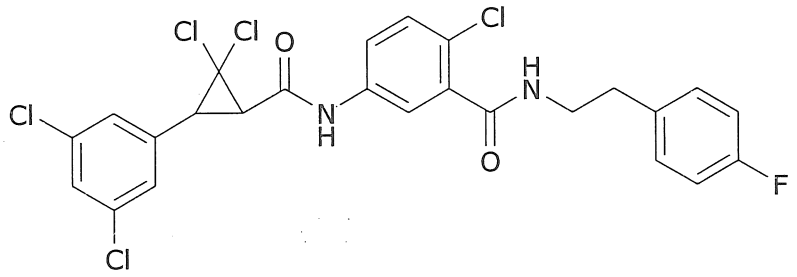
Được phân lập dưới dạng bọt màu vàng nâu (0,063g, 44%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((4-flobenzyl)oxy)benzamit (F18)



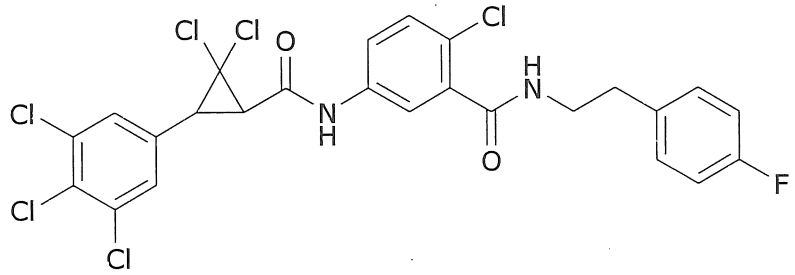
Được phân lập dưới dạng bọt màu vàng nâu (0,048g, 35%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4-flophenetyl)benzamit (F19)



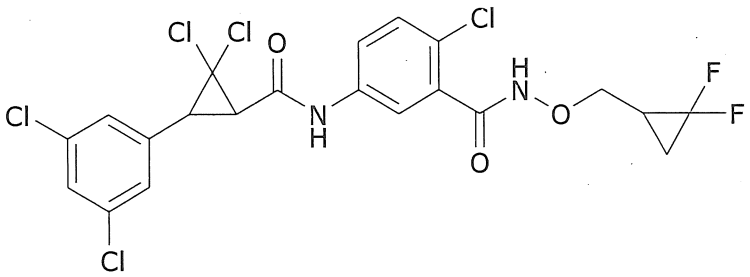
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng nhạt (0,119g, 83%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4-flophenetyl)benzamit (F20)



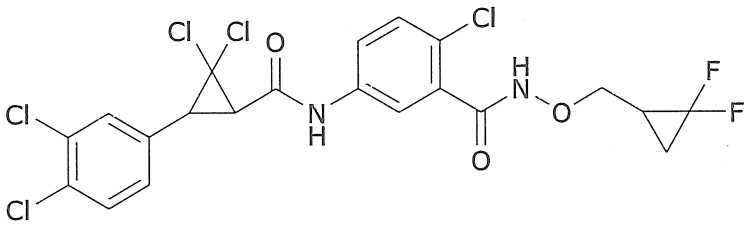
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,097g, 71%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((2,2-difloxyclopropyl)metoxy)benzamit (F21)



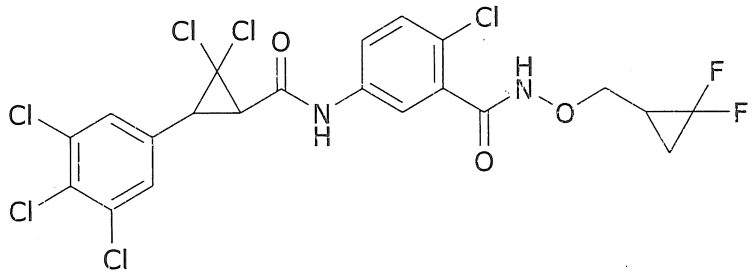
Được phân lập dưới dạng thủy tinh màu nâu (0,130g, 70%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((2,2-difloxyclopropyl)metoxy)benzamit (F22)



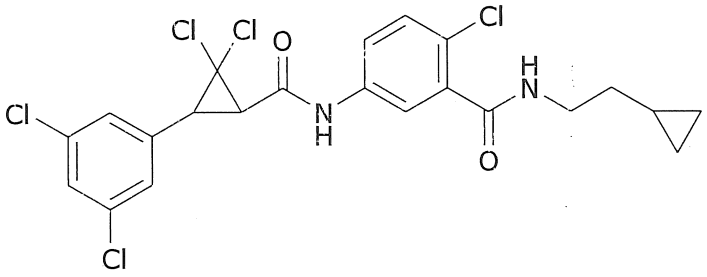
Được phân lập dưới dạng thủy tinh màu nâu (0,150g, 81%).

trans-*N*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((2,2-difloxyclopropyl)metoxy)benzamit (F23)



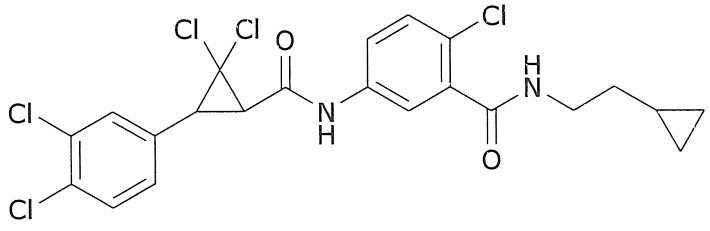
Được phân lập dưới dạng bọt màu vàng nâu (0,130g, 73%).

trans-*N*-2-clo-*N*-(2-xyclopropyletyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F24)



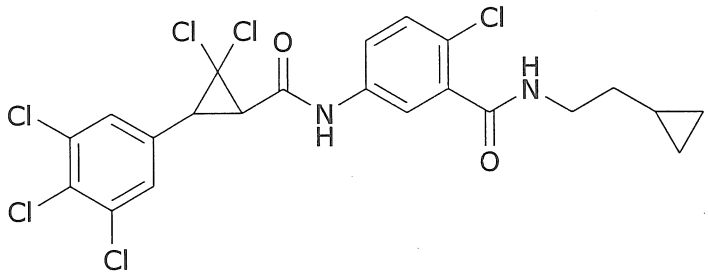
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,136g, 78%).

trans-*N*-2-clo-*N*-(2-xyclopropyletyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F25)



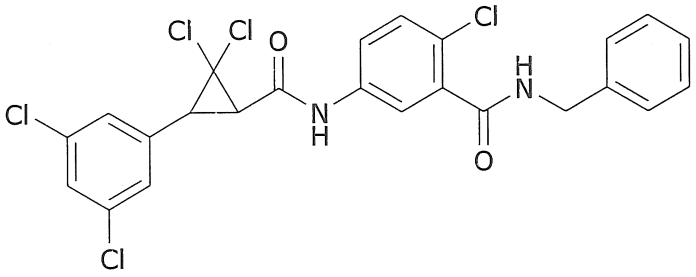
Được phân lập dưới dạng bột màu nâu vàng (0,134g, 77%).

trans-*N*-2-clo-*N*-(2-xyclopropyletyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F26)



Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,128g, 77%).

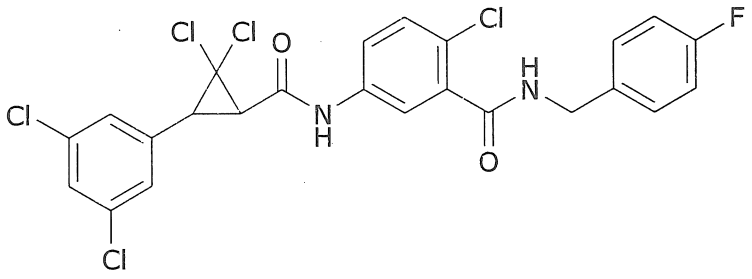
Ví dụ 14: Điều chế hợp chất *trans*-*N*-benzyl-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F27)



Bổ sung liên tục 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)carbodiimit (0,054g, 0,28mmol), 4-dimetylaminopyridin (0,027g, 0,23mmol), và axit*trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxamido)benzoic (C67)(0,085g, 0,19mmol) vào dung dịch phenylmetanamin (0,024g, 0,23mmol) trong diclometan (2ml). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian 16 giờ. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng etyl axetat/hexan 0-20% là dung dịch rửa giải đã tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (0,075g, 74%).

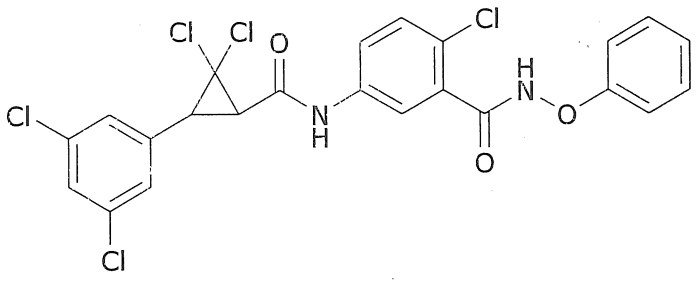
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 14:

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4-flobenzyl)benzamit (F28)



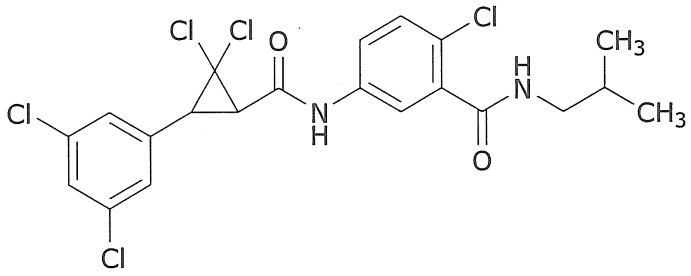
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,072g, 68%).

Ví dụ 15: Điều chế hợp chất *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-phenoxybenzamit (F29)



Bổ sung *N*,*N*-dimetylformamit (1 giọt) tiếp theo là oxalyl clorua (0,0870ml, 0,992mmol) vào dung dịch*axit* *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxamido)benzoic(C67)(0,300g, 0,661mmol) trong diclometan (5ml) được khuấy ở nhiệt độ 0°C. Hỗn hợp nước đá được loại bỏ và phản ứng được cho phép làm ấm đến nhiệt độ trong phòng trong thời gian hơn 90 phút. Phản ứng được cô đặc và axit clorua thu được được hòa tan trong diclometan (5ml) và làm mát trong bể nước đá. Dung dịch *O*-phenylhydroxylamin (0,108g, 0,992mmol) và trietylamin (0,230ml, 1,65mmol) trong diclometan (3ml) được bổ sung từng giọt. Hỗn hợp được loại bỏ khỏi bể nước đá và làm ấm đến nhiệt độ trong phòng trong thời gian hơn 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cho phép khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian 16 giờ. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng 0-35% etyl axetat/hexans là dung dịch rửa giải tiếp theo là việc nghiền với diclometan, việc lọc, và làm khô trong lò chân không ở nhiệt độ 40°C qua đêm đã tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (0,0981g, 27%).

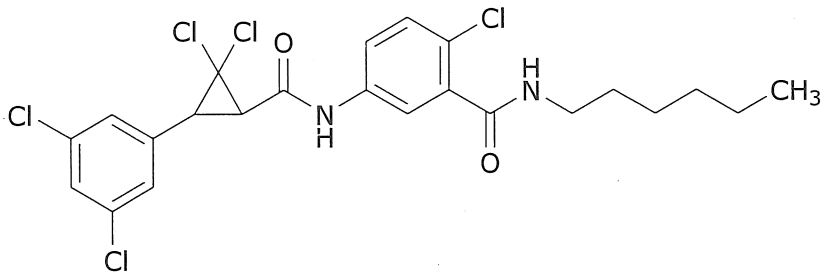
Ví dụ 16: Điều chế hợp chất *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-isobutylbenzamit (F30)



Bổ sung 1-[bis(dimetylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridin 3-oxid hexaflophosphat (0,0690g, 0,182mmol) tiếp theo là diisopropyletylamin (0,0280g, 0,215mmol) vào dung dịch *axit trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropancarboxamido)benzoic (C67) (0,0750g, 0,165mmol) trong diclometan (1ml) được, và dung dịch màu vàng nhạt thu được được khuấy trong thời gian 15 phút, được xử lý với 2-metylpropan-1-amin (0,0150g, 0,198mmol), và khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian xấp xỉ 18 giờ. Dung dịch was được tinh chế bằng axit hydrocloric (1N), và pha được phân lập và làm khô bằng cách đưa chúng qua hộp máy ly tâm tách pha. Pha hữu cơ được cô đặc, được tinh chế bằng sắc ký cột nhanh, và làm khô dưới chân không để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dầu dính, nhớt mà đóng rắn chậm trong khi cạo (0,0810g, 100%).

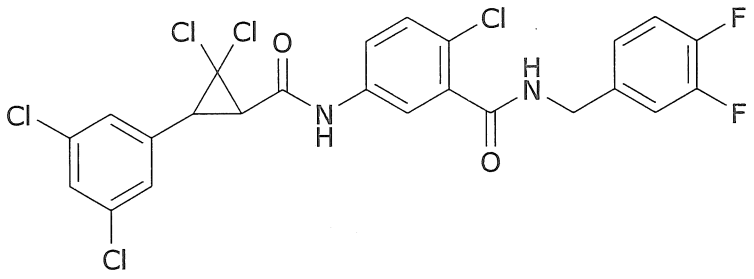
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 16:

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-hexylbenzamit (F31)



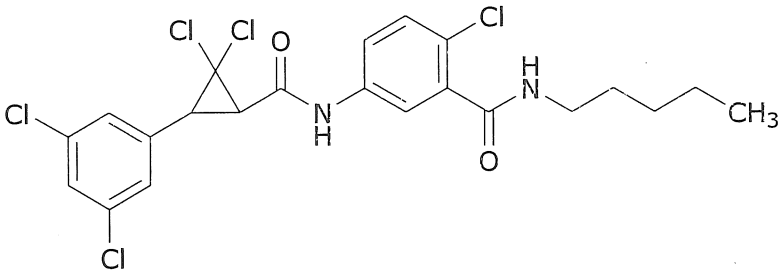
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,4-diflobenzyl)benzamit (F32)



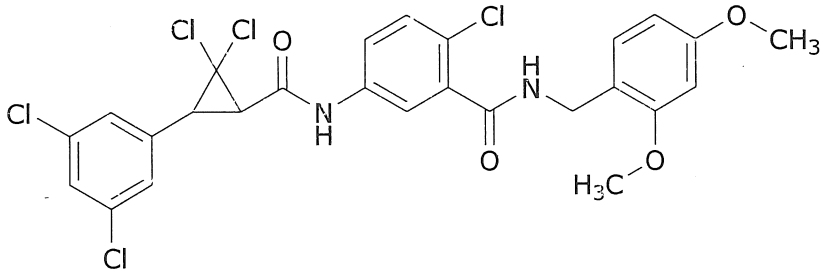
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,085g, 85%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-pentylbenzamit (F33)



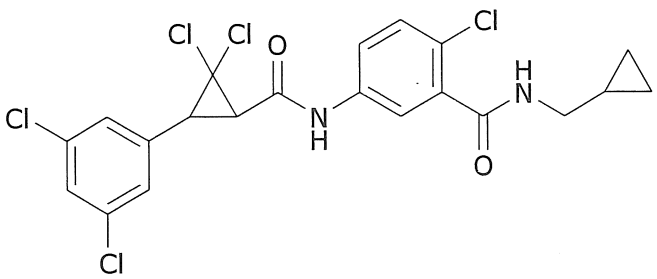
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,072g, 79%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,4-dimetoxybenzyl)benzamit (F34)



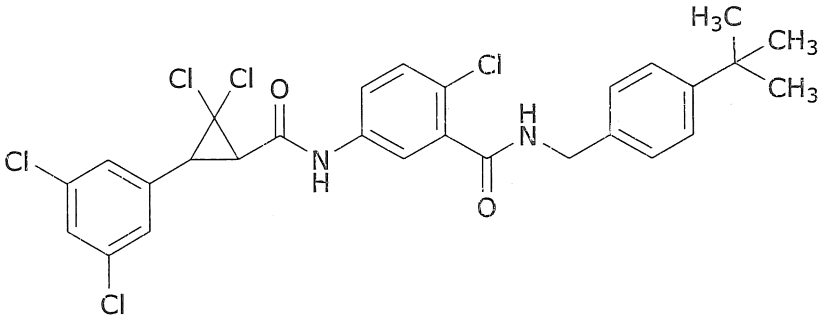
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (0,084g, 84%).

trans-2-clo-*N*-(xyclopropylmetyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F35)



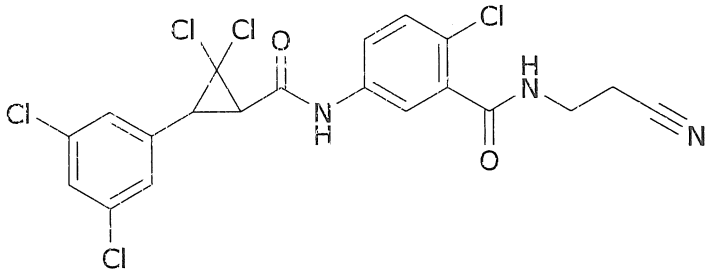
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,074g, 84%).

trans-*N*-(4-(*tert*-Butyl)benzyl)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F36)



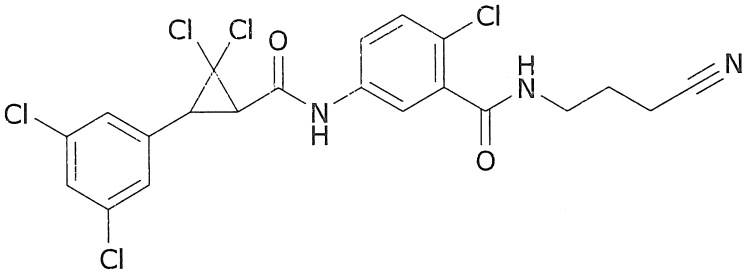
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,061g, 51%).

trans-2-clo-*N*-(2-xyanoetyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F37)



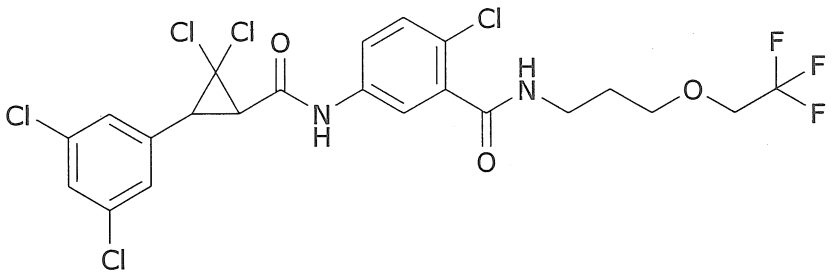
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,072g, 82%).

trans-2-clo-*N*-(3-xyanopropyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F38)



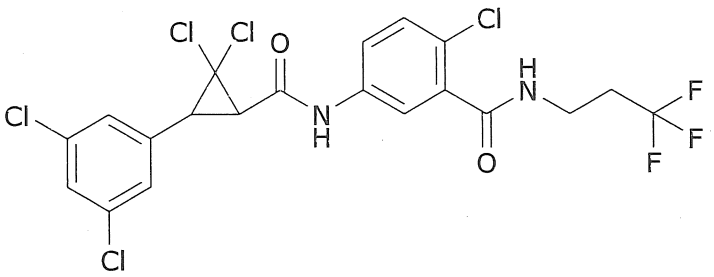
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,081g, 90%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3-(2,2,2-trifloetoxy) propyl)benzamit (F39)



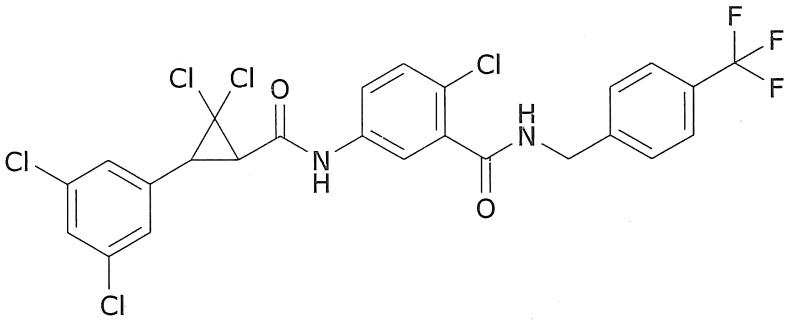
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,082g, 79%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F40)



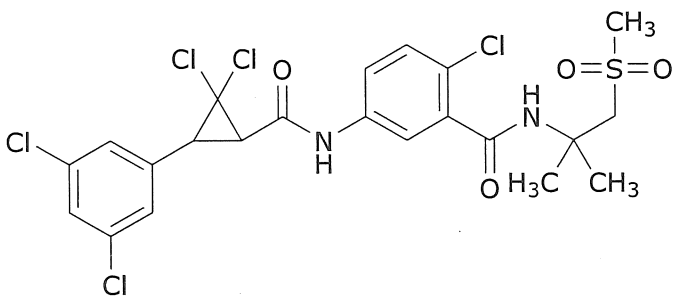
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,077g, 81%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4-(triflometyl)benzyl)benzamit (F41)



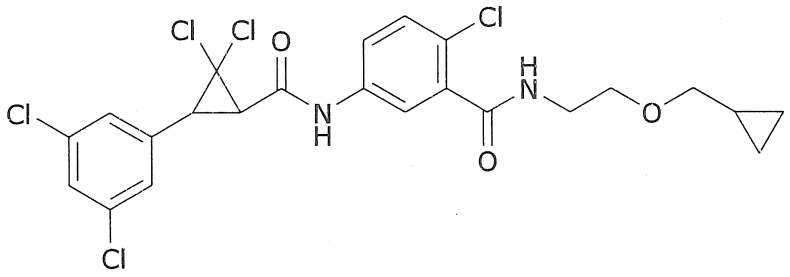
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,087g, 82%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-metyl-1-(metylsulfonyl) propan-2-yl)benzamit (F42)



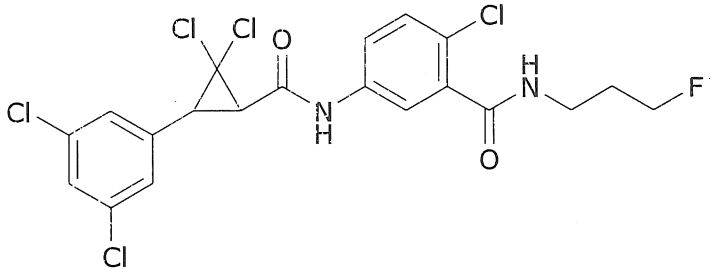
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,090g, 88%).

trans-2-clo-*N*-(2-(xyclopropylmetoxy)etyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F43)



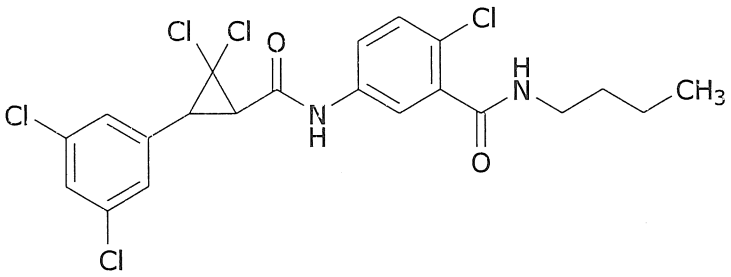
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,042g, 44%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3-flopropyl)benzamit (F44)



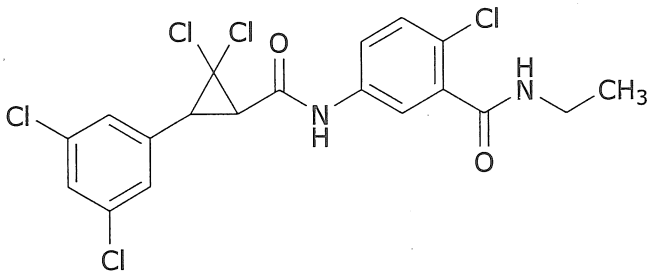
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,053g, 59%).

trans-*N*-Butyl-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F45)



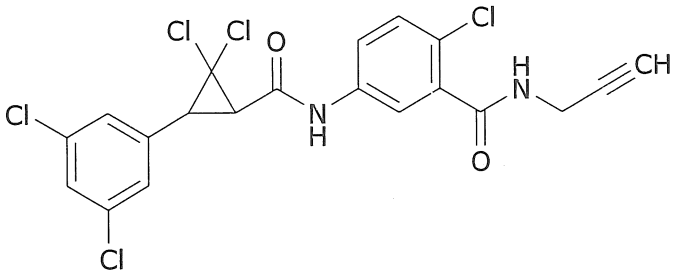
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 76%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etylbenzamit (F46)



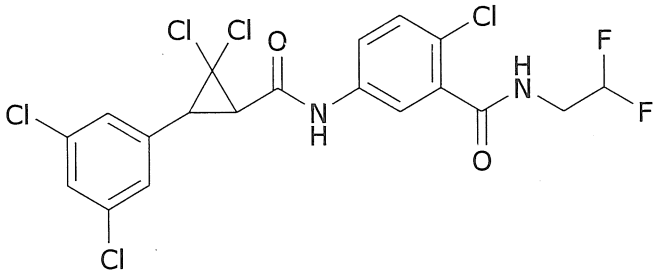
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,065g, 82%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(prop-2-yn-1-yl)benzamit (F47)



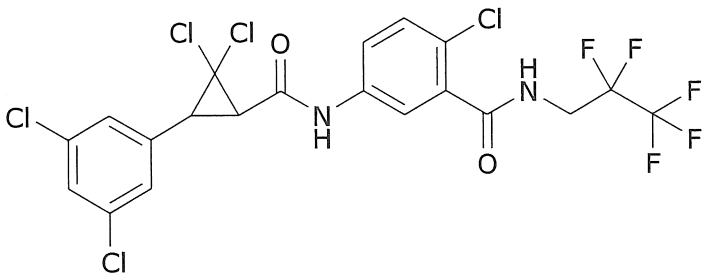
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,043g, 53%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2-difloetyl)benzamit (F48)



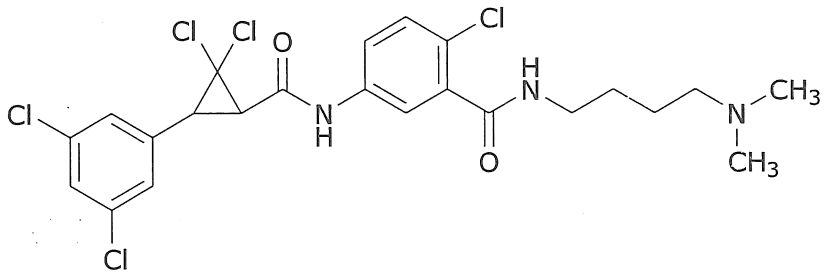
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,065g, 76%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,3,3,3-pentaflopropyl)benzamit (F49)



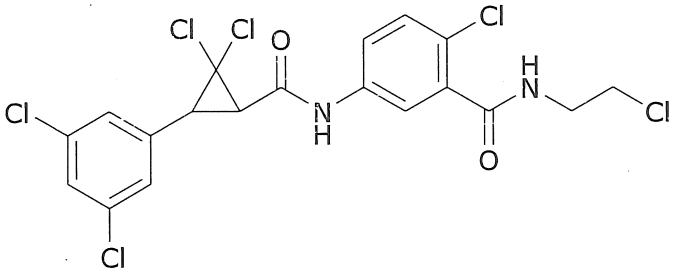
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,070g, 72%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4-(dimetylamino)butyl)benzamit (F50)



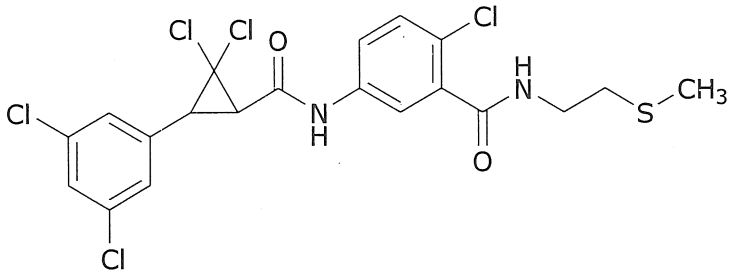
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,031g, 34%).

trans-2-clo-*N*-(2-cloetyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F51)



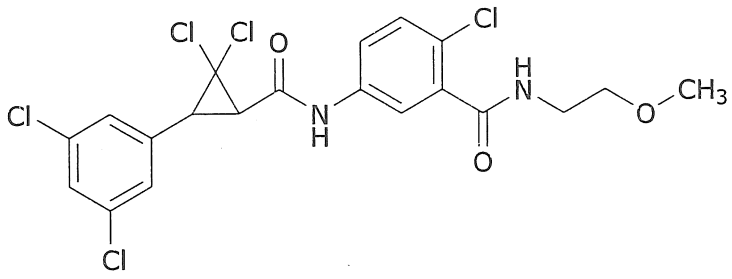
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,073g, 86%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(metylthio)etyl)benzamit (F52)



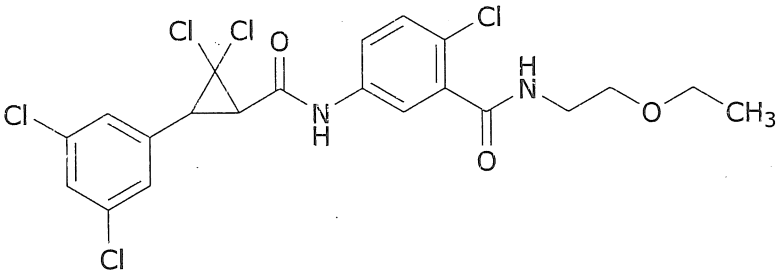
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,255g, 88%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-metoxyetyl)benzamit (F53)



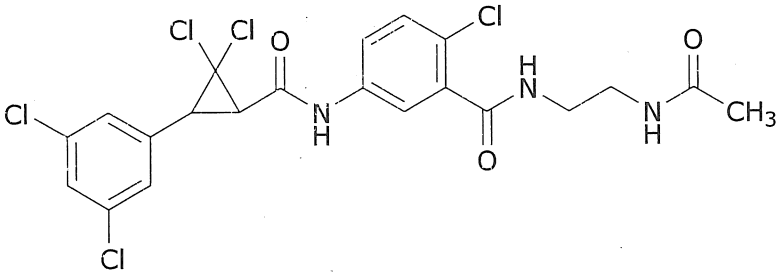
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,064g, 76%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-etoxyetyl)benzamit (F54)



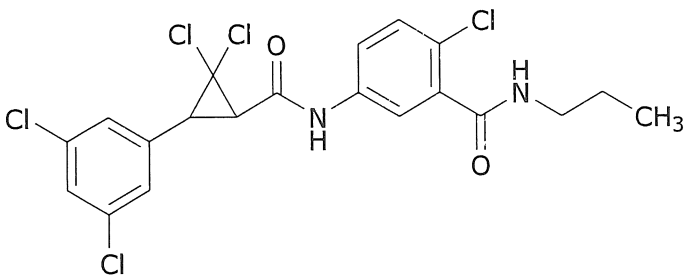
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,066g, 76%).

trans-*N*-(2-axetamidoetyl)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F55)



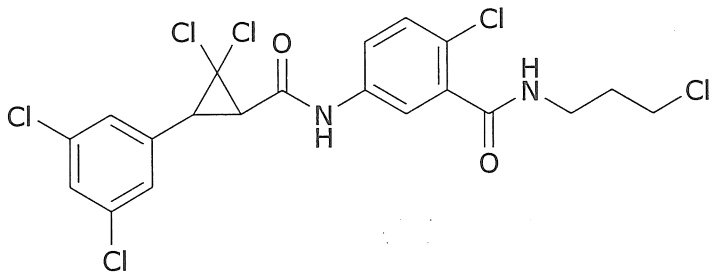
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,063g, 71%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-propylbenzamit (F56)



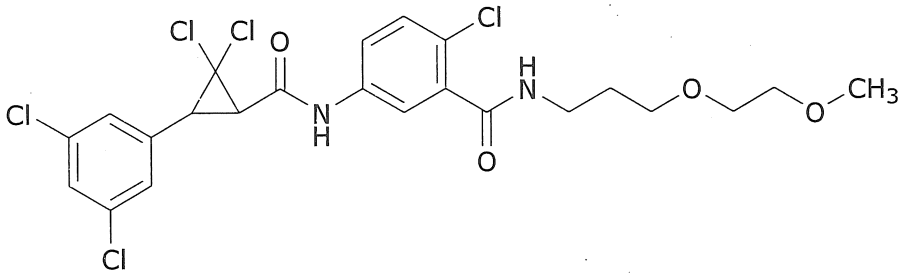
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,074g, 90%).

trans-2-clo-*N*-(3-clopropyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (F57)



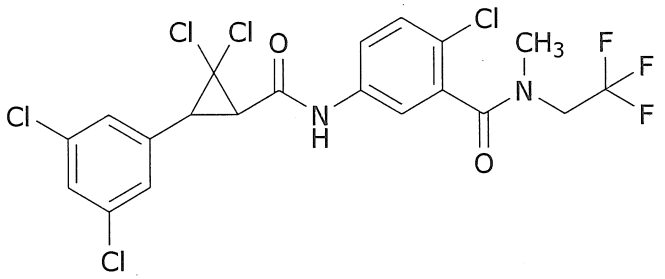
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,084g, 96%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3-(2-metoxyetoxy) propyl)benzamit (F58)



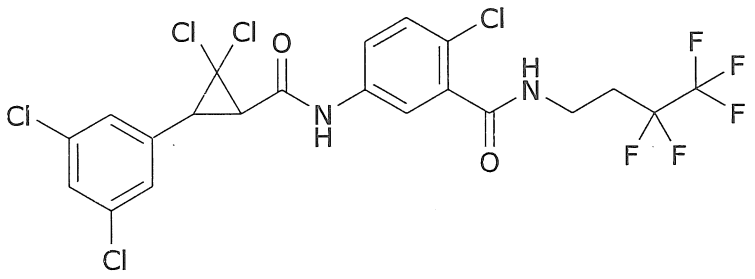
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,071g, 75%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metyl-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F59)



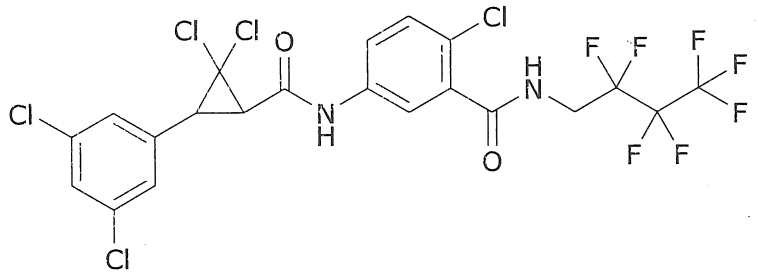
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,056g, 62%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,4,4,4-pentaflobutyl)benzamit (F60)



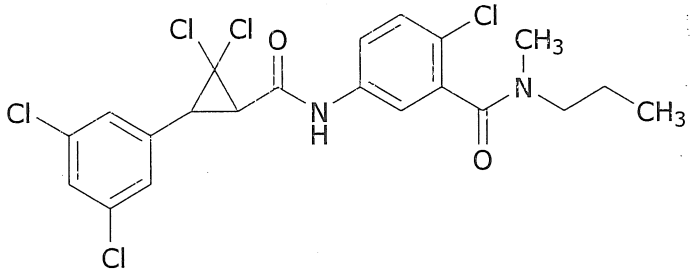
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,093g, 94%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,3,3,4,4,4-heptaflobutyl)benzamit (F61)



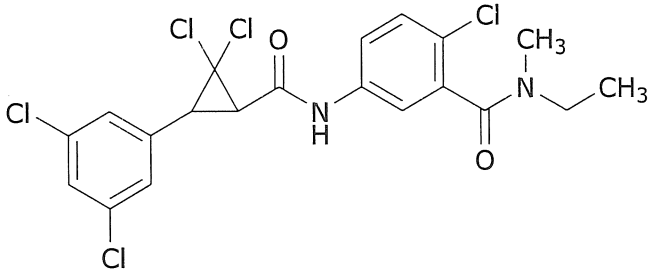
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,054g, 52%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metyl-*N*-propylbenzamit (F62)



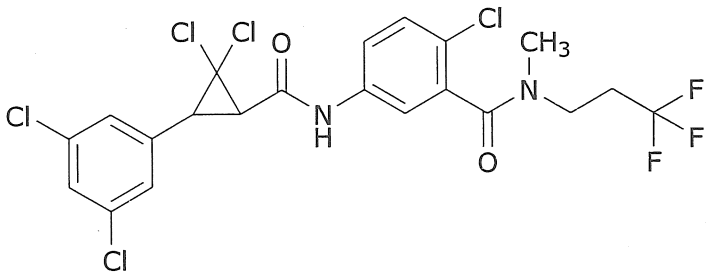
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,071g, 84%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etyl-*N*-metylbenzamit (F63)



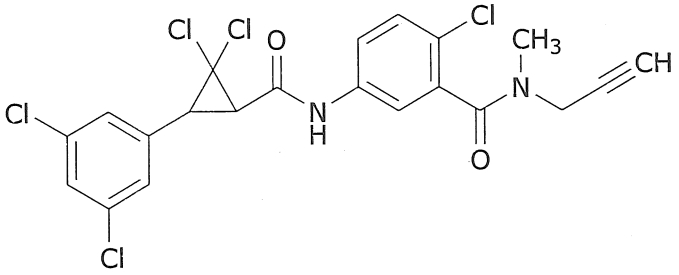
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,077g, 94%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metyl-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F64)



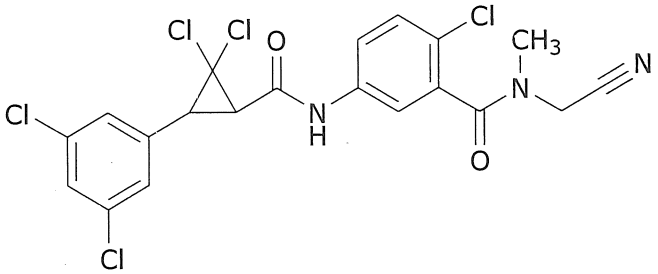
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,083g, 89%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metyl-*N*-(prop-2-yn-1-yl)benzamit (F65)



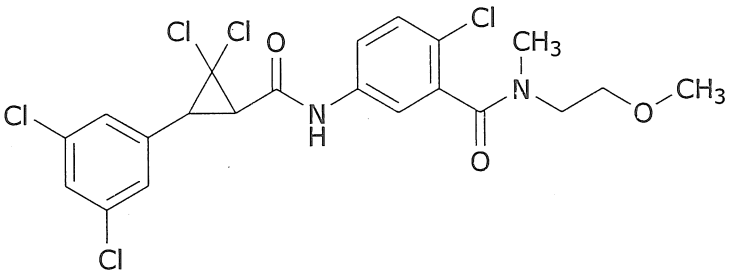
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,035g, 42%).

trans-2-clo-*N*-(xyanometyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metylbenzamit (F66)



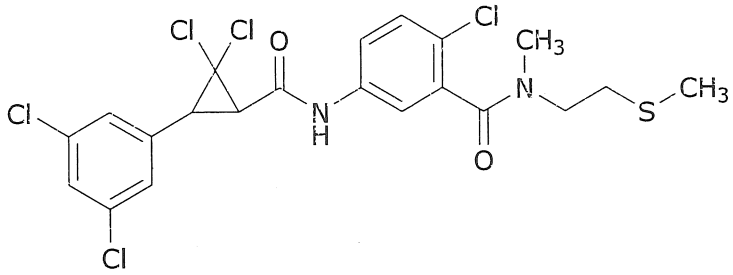
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (0,023g, 28%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-metoxyetyl)-*N*-metylbenzamit (F67)



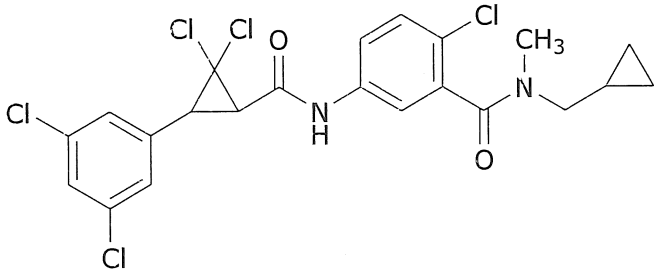
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (0,064g, 74%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metyl-*N*-(2-(metylthio)etyl)benzamit (F68)



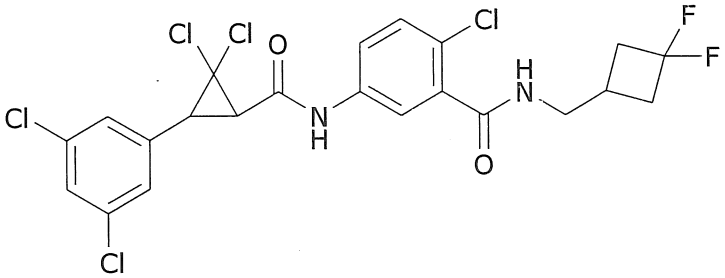
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,069g, 77%).

trans-2-clo-*N*-(xyclopropylmetyl)-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-metylbenzamit (F69)



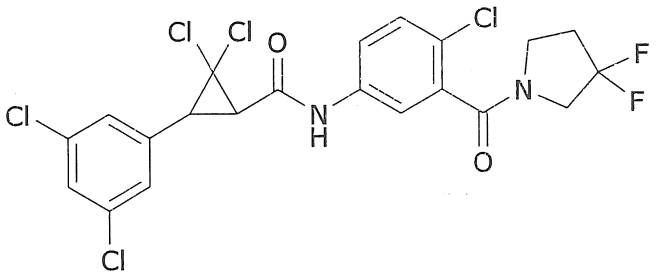
Được phân lập dưới dạng dầu không màu (0,066g, 77%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((3,3-difloxyclobutyl)metyl)benzamit (F70)



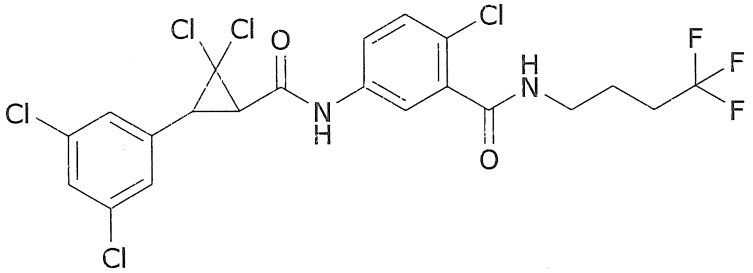
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,074g, 80%).

trans-2,2-diclo-*N*-(4-clo-3-(3,3-diflopyrolidin-1-carbonyl) phenyl)-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamit (F71)



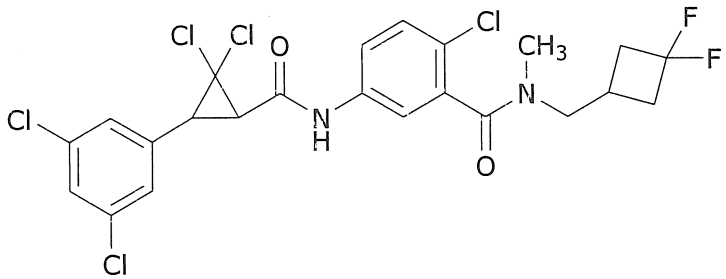
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,079g, 88%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(4,4,4-triflobutyl)benzamit (F72)



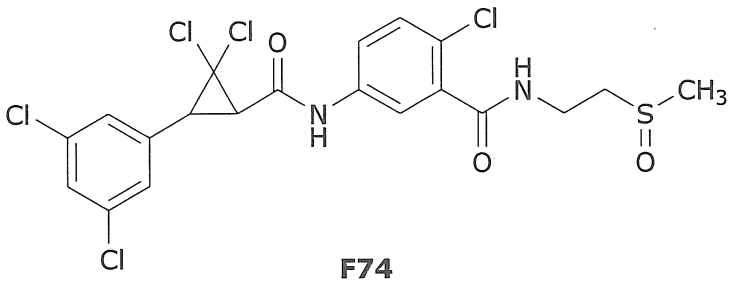
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,090g, 97%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((3,3-difloxyclobutyl)metyl)-*N*-metylbenzamit (F73)

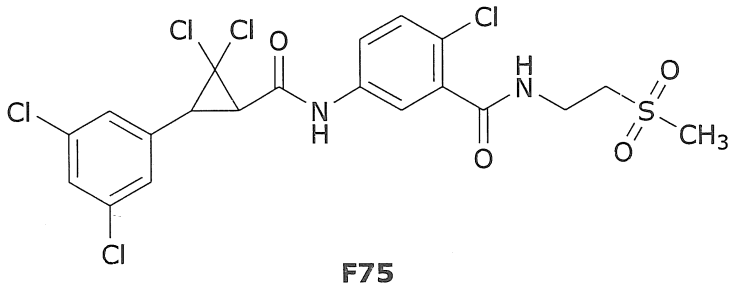


Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,087g, 92%).

Ví dụ 17a: Điều chế hợp chất *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(metylsulfinyl)etyl)benzamit (F74) và *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(metylsulfonyl)etyl)benzamit (F75)



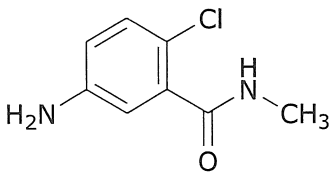
F74



F75

Bổ sung natri perborat tetrahydrat (0,0840g, 0,540mmol) vào dung dịch *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(metylthio)etyl)benzamit (F52) (0,179g, 0,340mmol) trong axit axetic (4ml), và hỗn hợp không màu được làm ấm đến nhiệt độ 55°C và khuấy trong thời gian khoảng 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan (50ml) và trung hòa bằng việc bổ sung chậm natri bicarbonat chứa nước bão hòa. Pha được phân lập và pha chứa nước được chiết tách với diclometan, và các lớp hữu cơ kết hợp được tinh chế bằng nước muối, được làm khô bằng cách cho đi qua hộp chứa máy ly tâm tách pha, và cô. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng 0-100% etyl axetat/hexans tiếp theo là 1:1 diclometan/metanol là dung dịch rửa giải và làm khô trong lò chân không (house vacuum) ở nhiệt độ 47°C qua đêm đã tạo ra (F74) là chất rắn màu trắng (0,048g, 26%) và (F75) là chất rắn màu trắng (0,135g, 71%).

Ví dụ 17b: Điều chế hợp chất 5-amino-2-clo-*N*-metylbenzamit (C68)

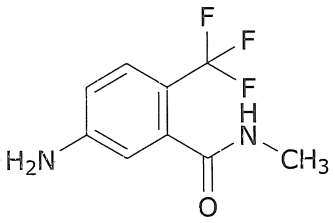


Bổ sung bột sắt (0,364g, 6,52mmol) và amoni clorua (0,209g, 3,91mmol) vào dung dịch 2-clo-*N*-metyl-5-nitrobenzamit (C81) (0,280g, 1,31mmol) trong metanol (8,70ml) và nước (4,35ml). Phản ứng được làm nóng ở nhiệt độ 60 °C trong thời gian 2 giờ. Phản ứng được lọc qua Celite®. Phần lọc được pha loãng với diclometan và chiết

tách với axit hydrocloric (1N). Tổ hợp các pha chứa nước được trung hòa với natri bicarbonat chứa nước bão hòa và chiết tách với diclometan. Tổ hợp các pha hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô thành hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu vàng (0,0720g, 22%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,09 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,9 Hz, 1H), 6,61 (dd, J = 8,6, 2,9 Hz, 1H), 6,53 (s, 1H), 3,92 (s, 2H), 2,96 (d, J = 4,9 Hz, 3H); EIMS *m/z* 185 ($[M]^+$).

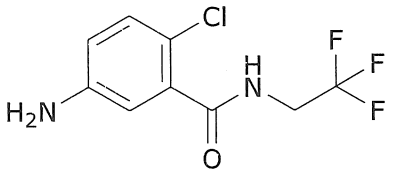
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 17b:

5-amino-*N*-metyl-2-(triflometyl)benzamit (C69)



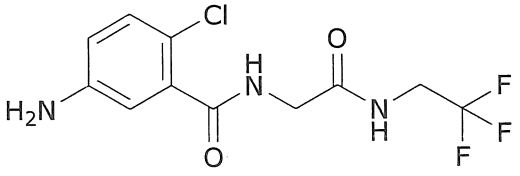
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,43 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,71 6,66 (m, 1H), 5,76 (s, 1H), 4,07 (s, 2H), 2,98 (d, J = 4,9 Hz, 3H); IR (màng mỏng) 3465, 3350, 1612 cm^{-1}; EIMS *m/z* 218 ($[M]^+$).

5-amino-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (C70)



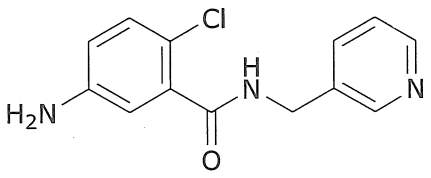
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8,98 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,64 6,52 (m, 2H), 5,46 (s, 2H), 4,01 (qd, J = 9,7, 6,5 Hz, 2H); IR (màng mỏng) 3428, 3281, 1656 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 254 ($[M+H]^+$).

5-amino-2-clo-*N*-(2-oxo-2-((2,2,2-trifloetyl)amino)etyl)benzamit (C71)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,03 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,69 (t, J = 5,2 Hz, 1H), 6,68 6,58 (m, 2H), 6,51 (d, J = 6,4 Hz, 1H), 4,27 (s, 2H), 3,96 3,70 (m, 4H); IR (màng mỏng) 3307, 2941, 1693, 1647 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 311 ([M+H]$^+$).

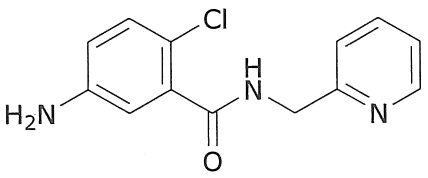
Ví dụ 18: Điều chế hợp chất 5-amino-2-clo-*N*-(pyridin-3-ylmetyl)benzamit (C72)



Bổ sung lần lượt hợp chất 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimit hydroclorua (0,840g, 4,40mmol) và 4-dimetylaminopyridin (0,460g, 3,80mmol) vào hỗn hợp được khuấy 5-amino-2-clobenzoic (0,500g, 2,90mmol) và pyridin-3-ylmetanamin (0,360ml, 3,50mmol) trong diclometan (12ml) ở nhiệt độ 23°C. Hỗn hợp phản ứng màu hồng không đồng nhất thu được được khuấy ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 2 giờ. *Bổ sung N,N*-dimetylformamit (6ml) để cải thiện độ tan và dung dịch màu cam không đồng nhất thu được được khuấy ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 70 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột pha đảo sử dụng 5-100% axetonitril/nước là dung dịch rửa giải để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng bột màu nâu nhạt (0,650g, 86%): mp 133-136°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8,89 (br t, J = 6 Hz, 1H), 8,55 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,47 (dd, J = 5, 1,5 Hz, 1H), 7,73 (dt, J = 8, 1,5 Hz, 1H), 7,37 (ddd, J = 8, 5, 0,8 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 8 Hz, 1H), 6,55-6,62 (m, 2H), 5,41 (br s, 2H), 4,42 (d, J = 6 Hz, 2H); IR (màng mỏng) 3432 (m), 3340 (m), 3195 (m), 3025 (m), 1654 (s), 1626 (s), 1602 (s), 1559 (s), 1474 (s), 1439 (s), 1428 (s) cm^{-1}; ESIMS m/z 262 ([M+H]$^+$).

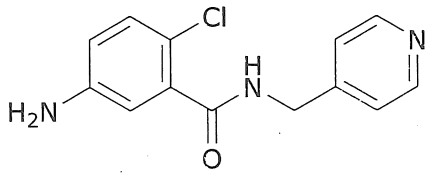
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 18:

5-amino-2-clo-*N*-(pyridin-2-ylmetyl)benzamit (C73)



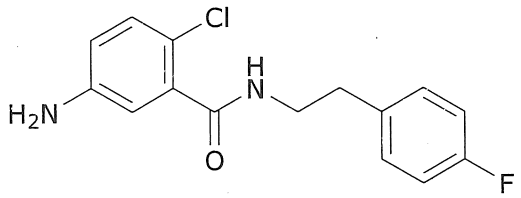
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,55 (br d, J = 5 Hz, 1H), 7,69 (td, J = 7,5, 2 Hz, 1H), 7,52 (br s, 1H), 7,35 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,21 (dd, J = 7,5, 5 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 3 Hz, 1H), 6,67 (dd, J = 8,5, 3 Hz, 1H), 4,78 (d, J = 5 Hz, 2H), 3,77 (br s, 2H); IR (màng mỏng) 3340 (m), 3223 (m), 3055 (w), 1640 (s), 1594 (s), 1571 (s), 1520 (s), 1474 (s), 1435 (s) cm^{-1}; ESIMS *m/z* 262 ([M+H]$^+$).

5-amino-2-clo-*N*-(pyridin-4-ylmetyl)benzamit (C74)



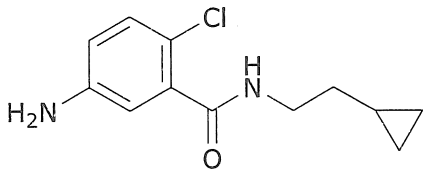
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): mp 122-125°C; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,56-8,60 (m, 2H), 7,28-7,31 (m, 2H), 7,17 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 3 Hz, 1H), 6,79 (br s, 1H), 6,69 (dd, J = 8,5, 3 Hz, 1H), 4,67 (d, J = 6 Hz, 2H), 3,81 (br s, 2H); IR (màng mỏng) 3428 (w), 3240 (m), 3056 (w), 1651 (s), 1596 (s), 1543 (s), 1478 (s), 1416 (s) cm^{-1}; ESIMS *m/z* 262 ([M+H]$^+$).

5-amino-2-clo-*N*-(4-flophenetyl)benzamit (C75)



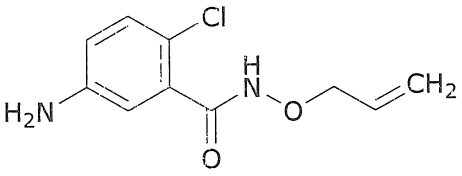
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,32 (br t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,28 (m, 2H), 7,12 (m, 2H), 7,03 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,56 (dd, J = 8,5, 3 Hz, 1H), 6,51 (d, J = 3 Hz, 1H), 5,37 (br s, 2H), 3,39 (m, 2H), 2,79 (t, J = 7,2 Hz, 2H); IR (màng mỏng) 3482 (w), 3366 (w), 3302 (m), 3070 (w), 2946 (w), 1637 (s), 1596 (m), 1544 (m), 1508 (m), 1474 (m), 1436 (m) cm^{-1}; ESIMS *m/z* 293 ([M+H]$^+$).

5-amino-2-clo-*N*-(2-xyclopropyletyl)benzamit (C76)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8,23 (br t, J = 6 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 9 Hz, 1H), 6,53-6,59 (m, 2H), 5,36 (br s, 2H), 3,23 (td, J = 7, 6 Hz, 2H), 1,38 (q, J = 7 Hz, 2H), 0,74 (m, 1H), 0,38-0,44 (m, 2H), 0,03-0,08 (m, 2H); IR (màng mỏng) 3281 (m), 3076 (w), 3000 (w), 2914 (w), 1634 (s), 1595 (m), 1579 (m), 1552 (m), 1476 (m), 1433 (m) cm^{-1}; ESIMS m/z 239 ([M+H]$^+$).

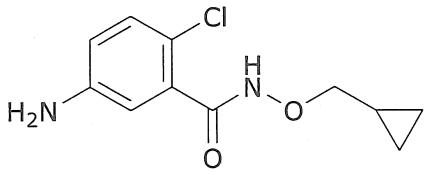
Ví dụ 19: Điều chế hợp chất *N*-(allyloxy)-5-amino-2-clobenzamit (C77)



Bổ sung lần lượt 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimit hydroclorua (0,840g, 4,40mmol) và 4-dimetylaminopyridin (0,460g, 3,80mmol) vào hỗn hợp được khuấy axit 5-amino-2-clobenzoic (0,500g, 2,90mmol), *O*-allylhydroxylamin hydroclorua (0,380g, 3,50mmol), và trietylamin (0,490ml, 3,50mmol) trong diclometan (15ml) ở nhiệt độ 23°C. Dung dịch màu xám không đồng nhất thu được được khuấy ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 48 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột nhanh pha đảo sử dụng hệ axetonitril/nước 5-100% là dung dịch rửa giải để tạo ra hợp chất theo sáng chế thành dầu màu nâu nhạt (0,440g, 67%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,13 (d, J = 9 Hz, 1H), 6,95 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,66 (dd, J = 9, 2,5 Hz, 1H), 6,05 (m, 1H), 5,32-5,45 (m, 2H), 4,53 (d, J = 6 Hz, 2H), 3,79 (br s, 2H); IR (màng mỏng) 3346 (w), 3214 (w), 2935 (w), 1629 (s), 1598 (s), 1575 (s), 1474 (s), 1433 (m), 1330 (m), 1271 (m) cm^{-1}; ESIMS m/z 227 ([M+H]$^+$).

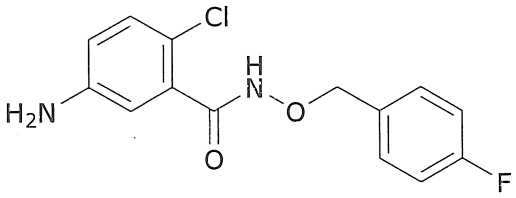
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 19:

5-amino-2-clo-*N*-(xyclopropylmetoxy)benzamit (C78)



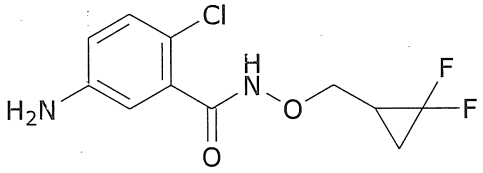
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,13 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,95 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,67 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 3,88 (br d, J = 7 Hz, 2H), 3,81 (br s, 2H), 1,21 (m, 1H), 0,57-0,66 (m, 2H), 0,32-0,39 (m, 2H); IR (màng mỏng) 3344 (w), 3215 (w), 2936 (w), 1644 (s), 1599 (s), 1526 (m), 1474 (s), 1431 (m) cm^{-1}; ESIMS m/z 241 ([M+H]$^+$).

5-amino-2-clo-*N*-((4-flobenzyl)oxy)benzamit (C79)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%).

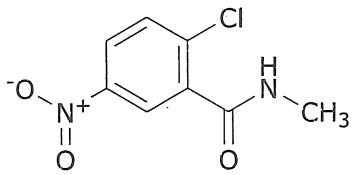
Ví dụ 20: Điều chế hợp chất 5-amino-2-clo-*N*-((2,2-difloxyclopropyl)metoxy)benzamit (C80)



Bổ sung lần lượt 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimit hydroclorua (0,900g, 4,70mmol) và 4-dimetylaminopyridin (0,500g, 4,10mmol) vào hỗn hợp được khuấy axit 5-amino-2-clobenzoic (0,535g, 3,10mmol), *O*-((2,2-difloxyclopropyl)metyl)hydroxylamin hydroclorua (0,500g, 3,10mmol), và trietylamin (0,520ml, 3,70mmol) trong diclometan (16ml) ở nhiệt độ 23°C. Dung dịch màu hồng nhạt không đồng nhất thu được được khuấy ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 24 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc, và phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột nhanh pha đảo sử dụng hệ axetonitril/nước 5 - 100% là dung dịch rửa giải để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất bán rắn mà nâu (0,560g, 65%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,51 (br s, 1H), 7,06 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,55-6,61 (m, 2H), 5,41 (br s, 2H), 3,96 (m, 1H), 3,85 (m, 1H), 2,08 (m, 1H), 1,67 (m, 1H), 1,39 (m, 1H); IR (màng mỏng) 3343 (w), 3211 (w),

2937 (w), 1645 (m), 1600 (s), 1527 (m), 1472 (s), 1437 (m) cm^{-1}; ESIMS *m/z* 277 ($[M+H]^+$).

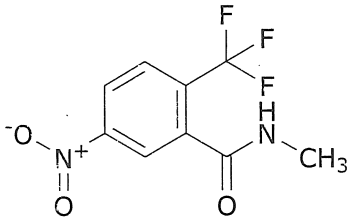
Ví dụ 21: Điều chế hợp chất 2-clo-*N*-metyl-5-nitrobenzamit (C81)



Bổ sung lần lượt axit 2-clo-5-nitrobenzoic (0,500g, 2,48mmol), diisopropyletylamin (0,650ml, 3,72mmol), và 4-dimetylaminopyridin (0,545g, 4,47mmol) vào hỗn hợp được khuấy metanamin hydroclorua (0,251g, 3,72mmol) và 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimit hydroclorua (0,951g, 4,96mmol) trong 1,2-dicloetan (25ml) ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan và tinh chế bằng natri bicarbonat chứa nước bão hòa và axit hydrocloric (1N). Pha hữu cơ được làm khô qua magiê sulfat, được lọc, và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (0,283g, 50%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,53 (d, *J* = 2,7 Hz, 1H), 8,22 (dd, *J* = 8,8, 2,8 Hz, 1H), 7,60 (d, *J* = 8,8 Hz, 1H), 6,21 (s, 1H), 3,08 (d, *J* = 4,9 Hz, 3H); EIMS *m/z* 215 ($[M]^+$).

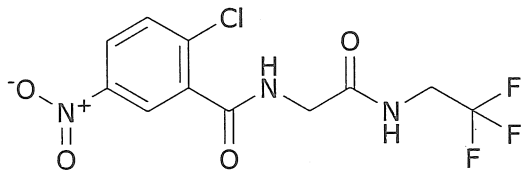
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 21:

N-metyl-5-nitro-2-(triflometyl)benzamit (C82)



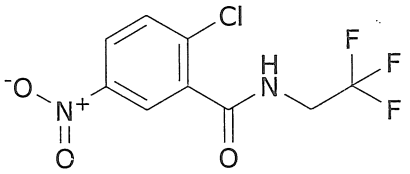
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,41 - 8,34 (m, 2H), 7,92 (d, *J* = 8,4 Hz, 1H), 5,87 (s, 1H), 3,06 (d, *J* = 4,9 Hz, 3H); EIMS *m/z* 248 ($[M]^+$).

2-clo-5-nitro-*N*-(2-oxo-2-((2,2,2-trifloetyl)amino)etyl)benzamit (C83)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,067g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9,04 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 8,70 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 8,34 8,28 (m, 2H), 7,83 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 4,03 3,92 (m, 4H); IR (màng mỏng) 3293, 3089, 1694, 1654 cm^{-1}; ESIMS m/z 341 ([M+H]$^+$).

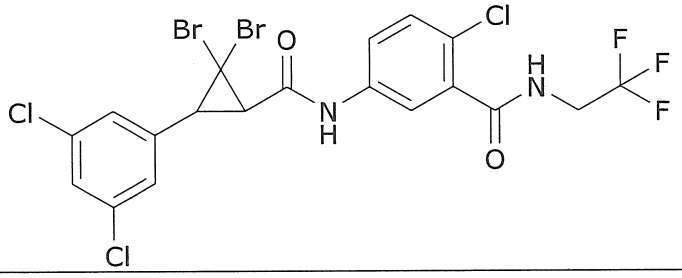
Ví dụ 22: Điều chế hợp chất 2-clo-5-nitro-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (C84)

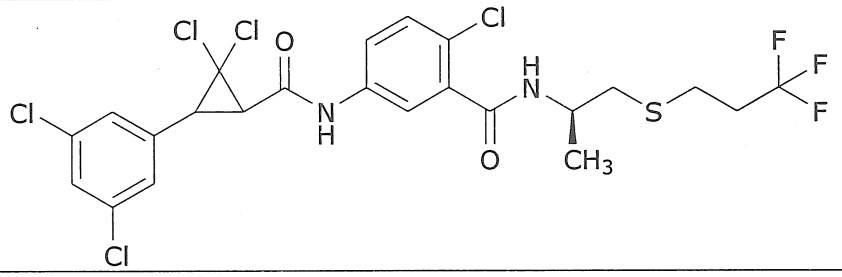
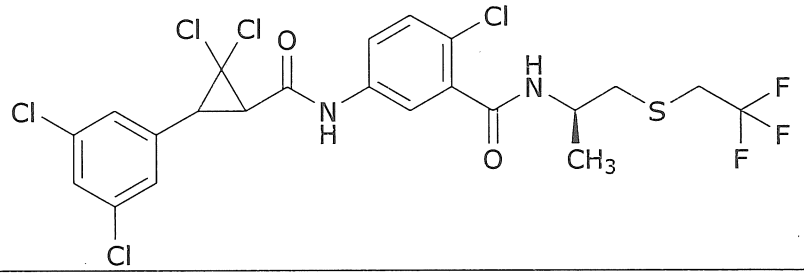
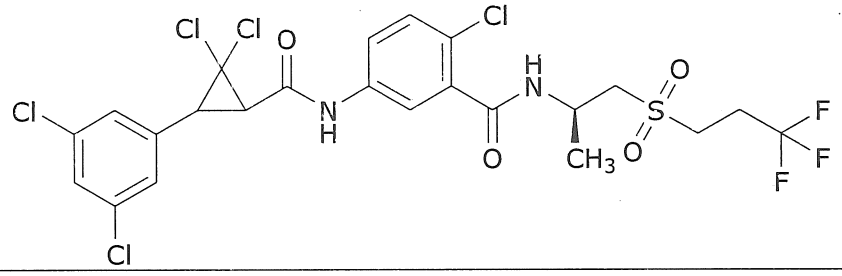
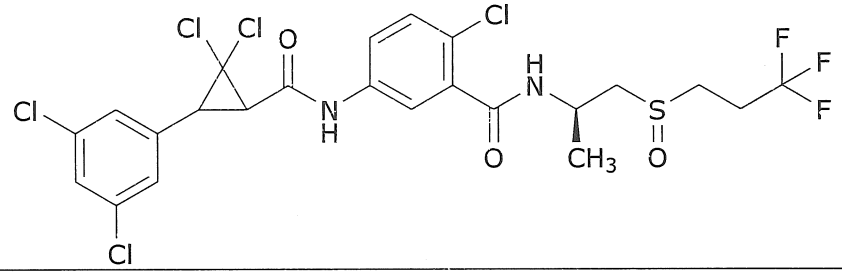
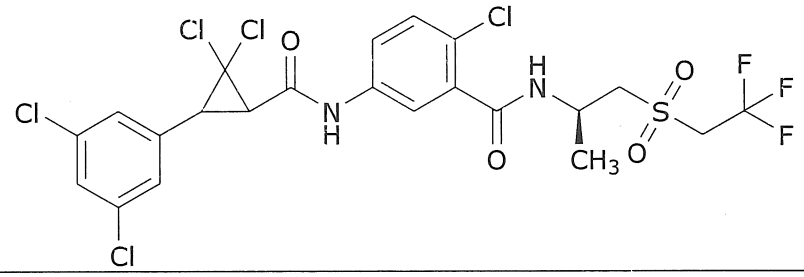
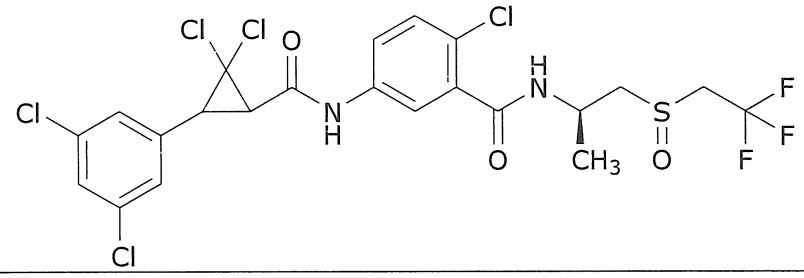


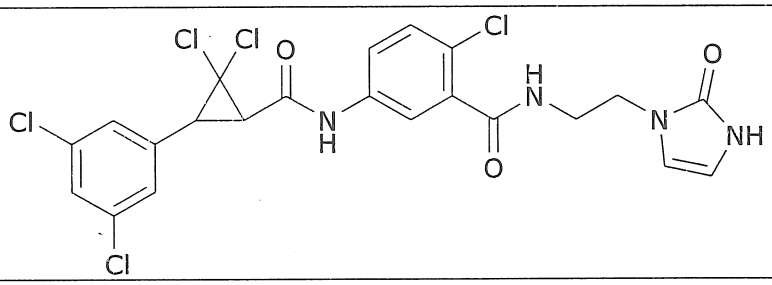
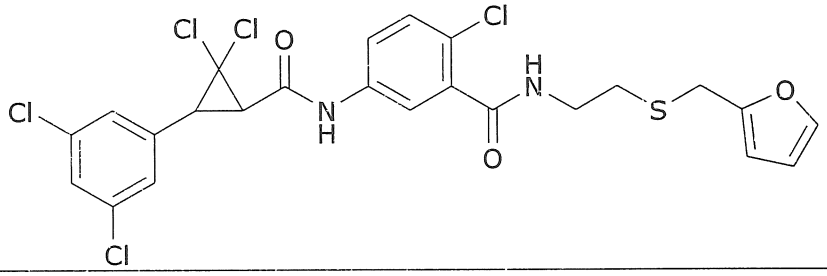
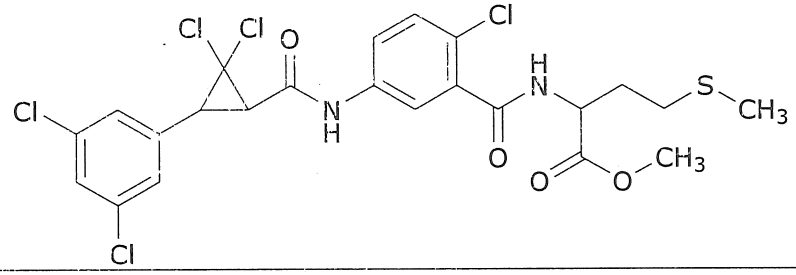
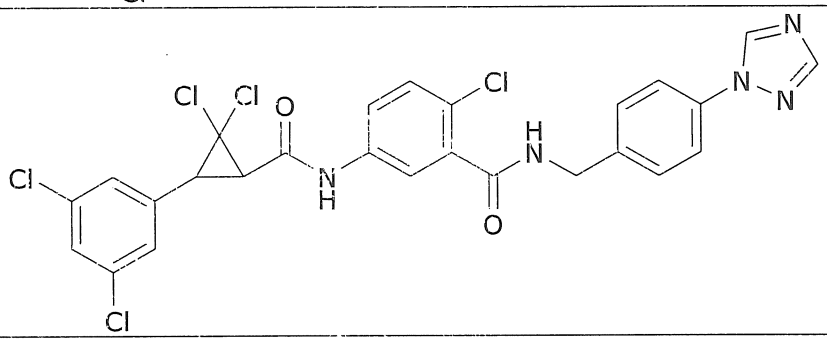
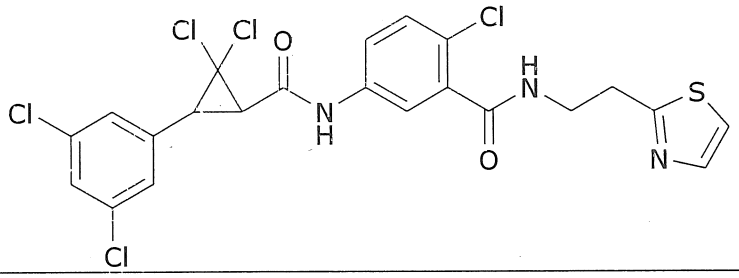
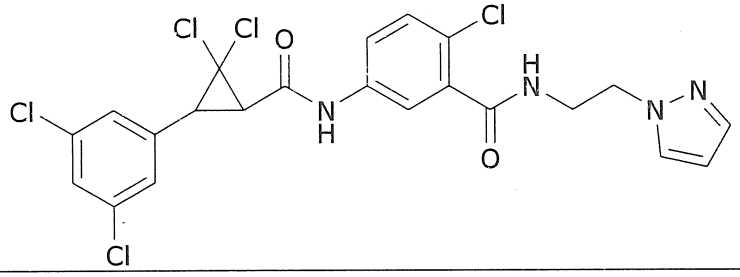
Bổ sung lần lượt axit 2-clo-5-nitrobenzoic (0,500g, 2,48mmol) và 4-dimetylaminopyridin (0,394g, 3,22mmol) vào hỗn hợp được khuấy 2,2,2-trifloetanamin (0,295g, 2,98mmol) và 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)-carbodiimit hydroclorua (0,713g, 3,72mmol) trong 1,2-dicloetan (12ml) ở nhiệt độ trong phòng, và hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 1 ngày. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan và tinh chế bằng natri bicarbonat chứa nước bão hòa tiếp theo là axit hydrocloric (1N) để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (0,379g, 51%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9,42 (t, J = 6,2 Hz, 1H), 8,32 (dd, J = 8,8, 2,8 Hz, 1H), 8,25 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,13 (qd, J = 9,7, 6,4 Hz, 2H); IR (màng mỏng) 3378, 2964, 1739, 1675 cm^{-1}; ESIMS m/z 284 ([M+H]$^+$).

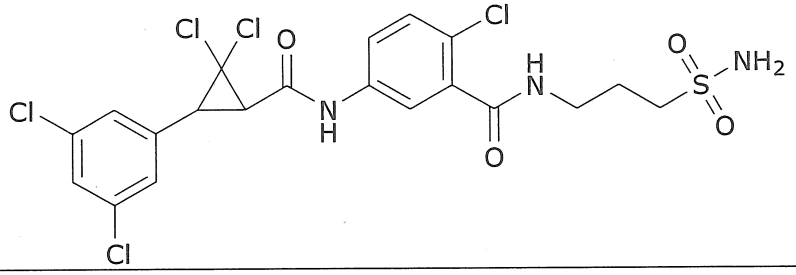
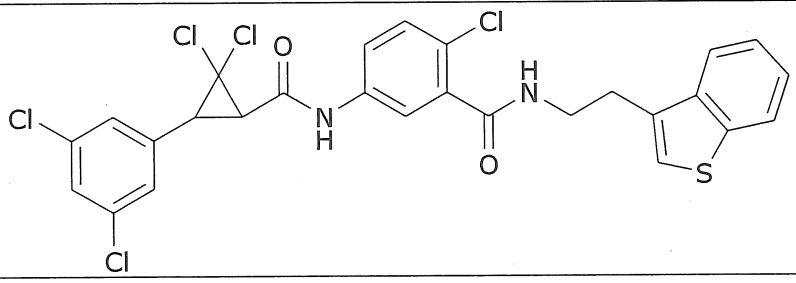
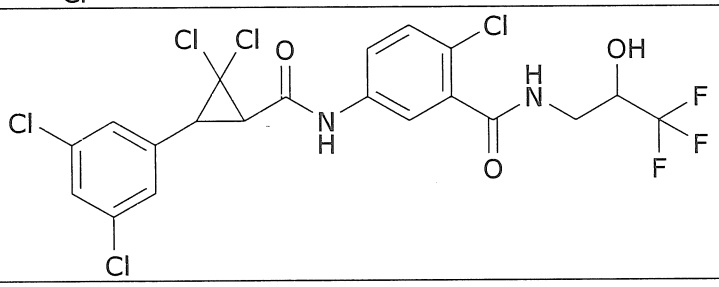
Các hợp chất sau trên Bảng 1 có thể được điều chế theo các cách tiến hành nêu trên.

Bảng P1: Cấu tạo và phương pháp điều chế dùng cho các hợp chất prophetic

Số	Cấu trúc	Điều chế
P1		13, 16

P2		13, 16
P3		13, 16
P4		13, 16, 17a
P5		13, 16, 17a
P6		13, 16, 17a
P7		13, 16, 17a

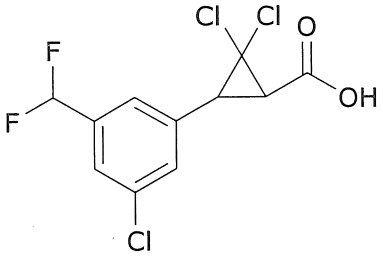
P8		13, 16
P9		13, 16
P10		13, 16
P11		13, 16
P12		13, 16
P13		13, 16

P14		13, 16
P15		13, 16
P16		13, 16

Các phương pháp điều chế điều chế theo Ví dụ hoặc Sơ đồ

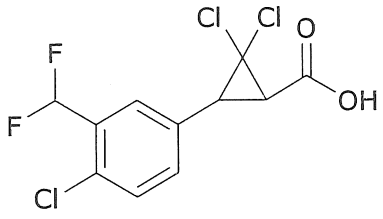
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 2:

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-5-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C85)



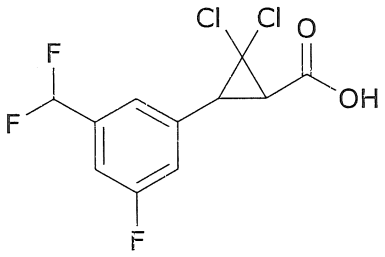
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (2,6g, 63%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) không có tín hiệu COOH δ 7,49 (s, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,30 (s, 1H), 6,63 (t, J = 56,0 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (282 MHz, $CDCl_3$) δ -112,04; ESIMS *m/z* 313 ($[M-H]^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C86)



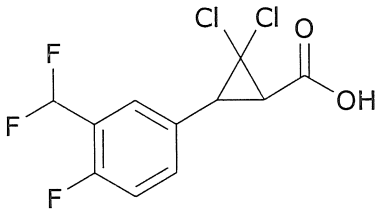
Được phân lập dưới dạng an off-white solid (6,2g, 69%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,5 (br s, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,46 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,95 (t, J = 54,8 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -115,52; ESIMS *m/z* 313 ($[M-H]^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl)-5-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C87)



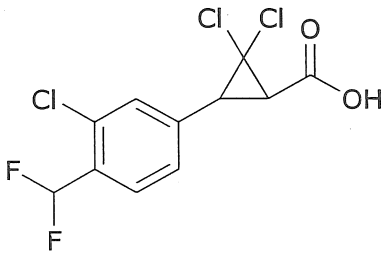
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (5g, 38%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) *không có tín hiệu COOH* δ 7,23 - 7,21 (m, 2H), 7,11 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 6,64 (t, J = 55,6 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -110,37; ESIMS *m/z* 297,19 ($[M-H]^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl)-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C88)



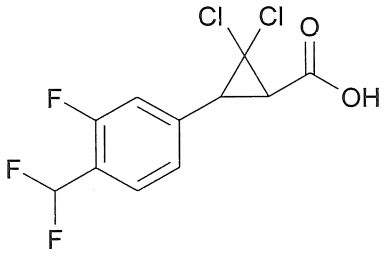
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (6,0g, 77%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) không có tín hiệu COOH δ 7,49 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 7,40 (br s, 1H), 7,17 (t, J = 9,2 Hz, 1H), 6,90 (t, J = 54,8 Hz, 1H), 3,49 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 2,89 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -114,47, -119,69; ESIMS *m/z* 297 ($[M-H]^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C89)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (3,5g, 42%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) *không có tín hiệu COOH* δ 7,68 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,94 (t, J = 54,8 Hz, 1H), 3,48 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -115,46; ESIMS *m/z* 313 ($[M-H]^-$).

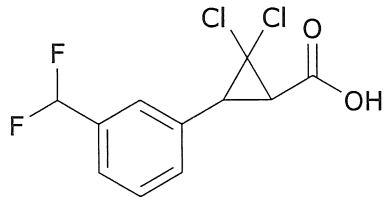
Axit *rans*-2,2-diclo-3-(4-(diflometyl)-3-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C90)



Được phân lập dưới dạng an chất rắn màu trắng nhạt (4,4g, 77%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,62 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,18 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 6,89 (t, J = 54,8 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,90 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ

-114,42, -118,63; ESIMS *m/z* 297,15 ($[M-H]^-$).

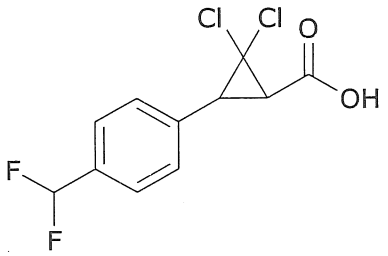
Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C91)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (6,2g, 53%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,49 (br s, 2H), 7,41 (br s, 2H), 6,66 (t, J = 56,0 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,4

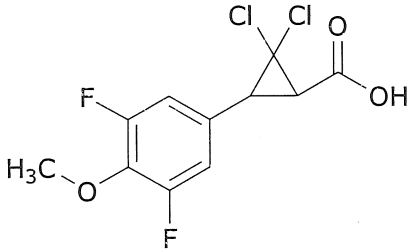
Hz, 1H), 2,92 (d, J = 8,0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (282 MHz, $CDCl_3$) δ -111,20; ESIMS *m/z* 279,20 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C92)



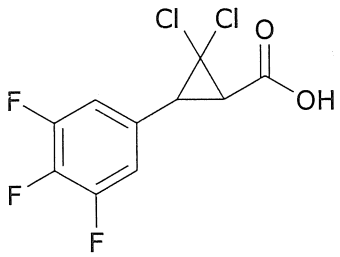
Được phân lập dưới dạng an chất rắn màu trắng nhạt (7g, 61%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,53 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,66 (t, J = 56,4 Hz, 1H), 3,52 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 2,92 (d, J = 8,0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (282 MHz, $CDCl_3$) δ -112,20; ESIMS *m/z* 279,30 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diflo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C93)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,440g, 53%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,72 (s, 1H), 6,89 - 6,77 (m, 2H), 4,02 (t, J = 1,2 Hz, 3H), 3,39 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,80 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -127,43, -127,43, -127,44; ESIMS *m/z* 296 ([M-H]$^-$).

Axit *cis/trans* - 2,2-diclo-3-(3,4,5-triflophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C94)

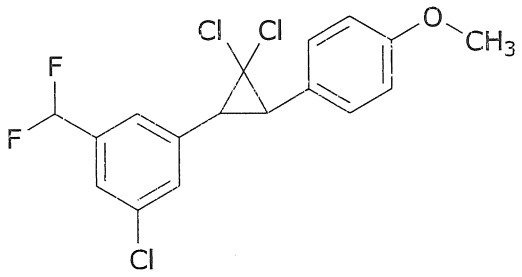


Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,411g, 53%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,72 (s, 1H), 7,06 - 6,74 (m, 2H), 3,46 - 3,23 (m, 1H), 3,01 - 2,74 (m, 1H); ^{19}F

NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -132,88, -132,94, -133,81, -133,87, -159,60, -159,65, -159,71, -160,34, -160,39, -160,45; ESIMS *m/z* 284 ($[M-H]^-$).

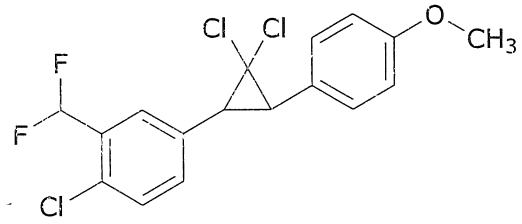
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 4:

trans-1-clo-3-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-5-(diflometyl)benzen (C95)



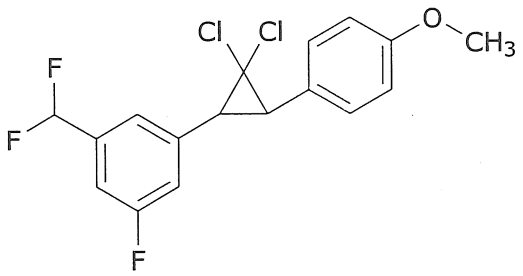
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu vàng (11,5g, 69%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$): δ 7,47 (s, 2H), 7,39 (s, 1H), 7,28 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 6,93 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 6,64 (t, *J* = 56,1 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,16 (q, *J* = 8,7 Hz, 2H).

trans-1-clo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-2-(diflometyl)benzen (C96)



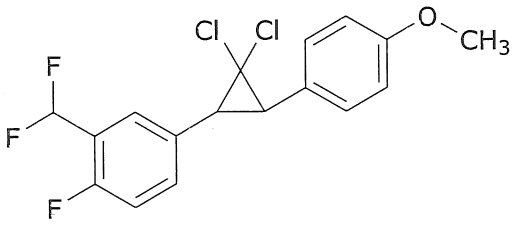
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (10,7g, 83%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,65 (s, 1H), 7,46 - 7,41 (m, 2H), 7,28 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,10 - 6,83 (m, 3H), 3,83 (s, 3H), 3,18 - 3,13 (m, 2H).

trans-1-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-3-(diflometyl)-5-flobenzen (C97)



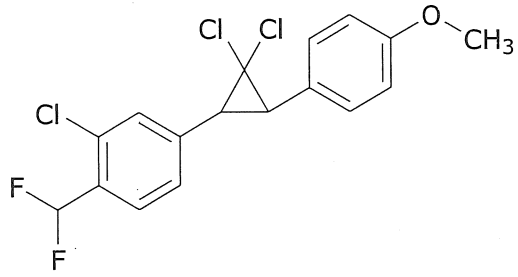
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (16,5g, 64%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,29 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,20 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,93 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,65 (t, J = 56,0 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,16 (s, 2H).

trans-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-2-(diflometyl)-1-flobenzen (C98)



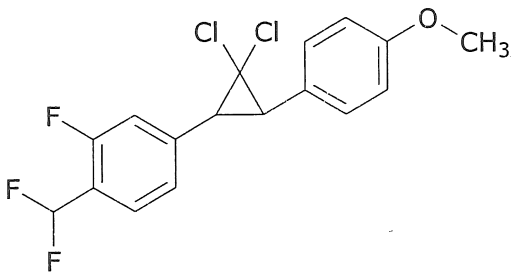
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (10,0g, 55%): ESIMS *m/z* 374 ([M+H]$^+$).

trans-2-clo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-1-(diflometyl)benzen (C99)



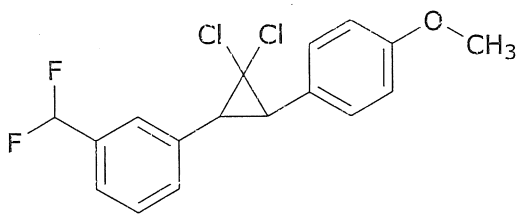
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (10,0g, 34%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,68 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,28 - 7,25 (m, 2H), 7,09 - 6,92 (m, 3H), 3,83 (s, 3H), 3,15 (q, J = 12,0 Hz, 2H); ESIMS *m/z* 376 ([M+H]$^+$).

trans-2-flo-4-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-1-(diflo-metyl) benzen (C100)



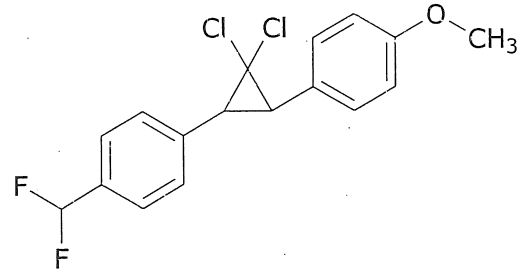
Được phân lập dưới dạng chất lỏng màu nâu nhạt (6,9g, 58%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,31 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,27 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,14 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 7,04 - 6,76 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 3,16 (t, J = 8,8 Hz, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -114,14, -114,32, -119,30.

trans-1-(2,2-diclo-3-(4-metoxyphenyl)xyclopropyl)-3-(diflometyl) benzen (C101)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (6,3g, 95%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,50 (br s, 4H), 7,29 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,93 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,67 (t, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,19 (s, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -110,87, -111,02.

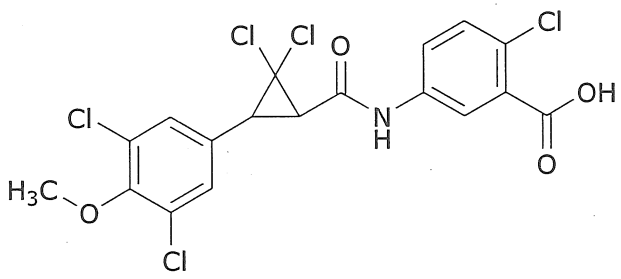
trans-1-(2,2-diclo-3-(4-(diflometyl) phenyl)xyclopropyl)-4-metoxy-benzen (C102)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (14g, 69%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,54 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,46 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,28 (t, J = 8,4 Hz, 2H), 6,93 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,67 (t, J = 56,8 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,18 (s, 2H).

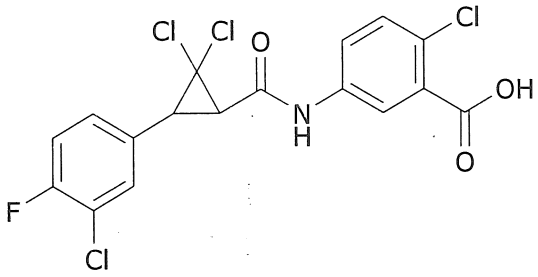
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 12:

Axit *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzoic (C103)



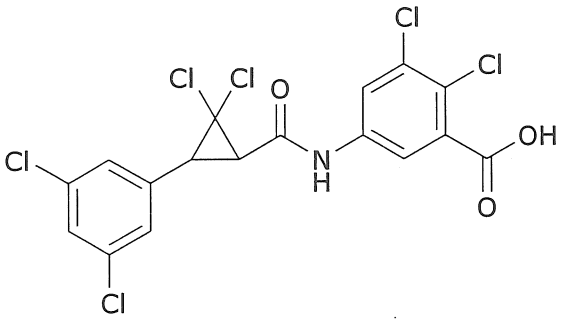
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu kem (1,565g, 90%): mp 227-231°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,48 (s, 1H), 10,89 (s, 1H), 8,16 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 7,61 (s, 2H), 7,53 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,57 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 166,27, 162,66, 151,18, 137,58, 131,44, 131,42, 131,22, 129,72, 128,18, 125,90, 122,87, 121,16, 62,19, 60,64, 38,51, 36,44; HRMS-ESI (*m/z*) [M+]$^+$ calcd trong thời gian $C_{18}H_{12}Cl_5NO_4$, 480,9209; found, 480,9216.

Axit *trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzoic (C104)



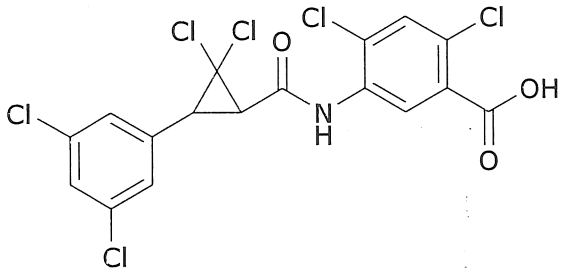
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (6,589g, 93%): mp 207-210°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,50 (s, 1H), 10,95 (s, 1H), 8,18 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,80 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,51 (dd, J = 28,2, 8,8 Hz, 3H), 3,59 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,43 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 166,22, 162,68, 158,01, 155,55, 137,53, 131,37, 131,17, 131,00, 130,95, 130,91, 129,74, 129,67, 125,86, 122,82, 121,12, 119,49, 119,32, 116,91, 116,70, 62,21, 38,49, 36,58; ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -117,26; ESIMS *m/z* 438 ([M+H]$^+$).

Axit *trans*-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzoic (C105)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (1,685g, 79%): mp 231-235°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) 13,82 (s, 1H), 11,05 (s, 1H), 8,13 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,56 (s, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 165,84, 162,96, 138,00, 137,09, 134,14, 133,98, 133,01, 127,83, 127,64, 123,41, 122,15, 119,27, 61,94, 38,37, 36,78; HRMS-ESI (*m/z*) [M+]$^+$ được tính toán đối với $C_{17}H_9Cl_6NO_3$, 484,8714; được phát hiện là, 484,8711.

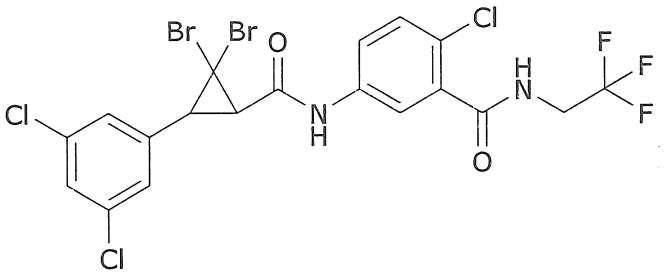
Axit *trans*-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzoic (C106)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (0,855g, 42%): mp 263-266°C; ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 13,67 (s, 1H), 10,37 (s, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,53 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 3,82 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,41, 163,35, 137,17, 133,95, 133,66, 131,17, 129,96, 128,80, 128,24, 127,74, 127,60, 126,63, 62,37, 37,24, 37,09; HRMS-ESI (*m/z*) [M+]$^+$ được tính toán đối với $C_{17}H_9Cl_6NO_3$, 484,8714; được phát hiện là, 484,8715.

Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 13:

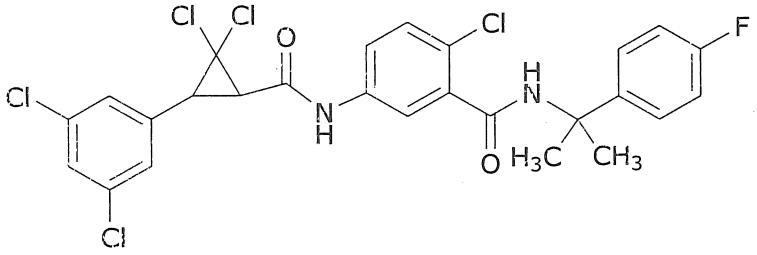
trans-2-clo-5-(2,2-dibrom-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (PF1)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,100g, 32%)

Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 15:

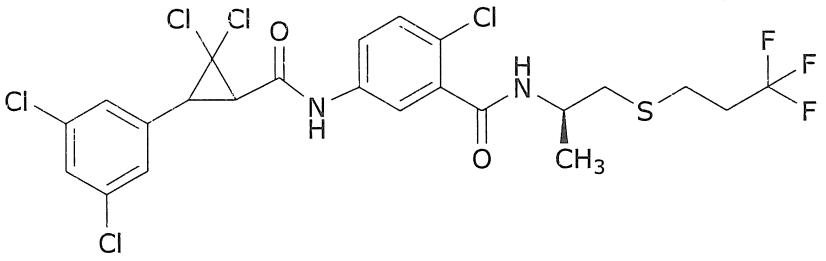
2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(4-flophenyl) propan-2-yl)benzamit (F97)



Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,086g, 63%).

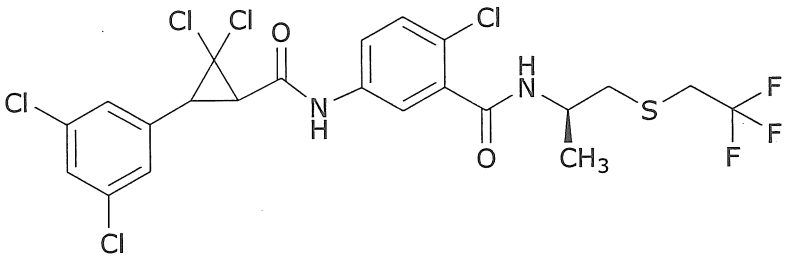
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 16:

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-((*R*)-1-((3,3,3-triflopropyl)thio) propan-2-yl)benzamit (PF2)



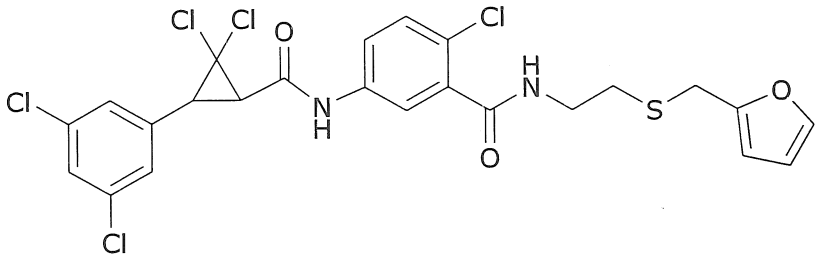
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,311 mg, 91%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifloetyl)thio) propan-2-yl)benzamit (PF3)



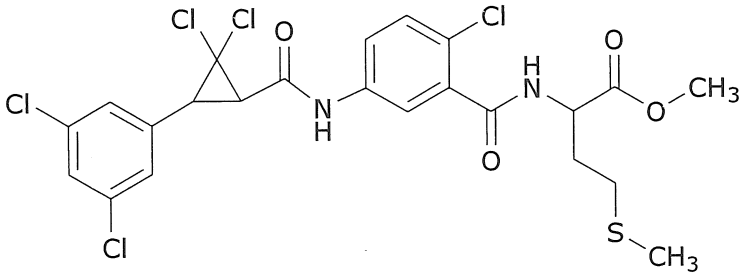
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,306g, 91%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-((furan-2-ylmetyl)thio)etyl)benzamit (PF9)



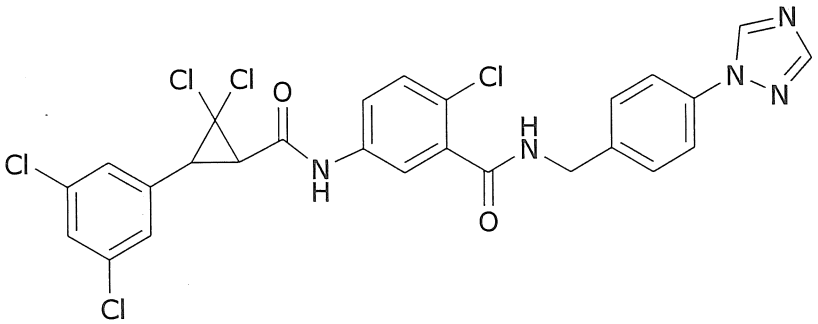
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,064g, 65%).

trans-metyl-2-(2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamido)-4-(metylthio)butanoat (PF10)



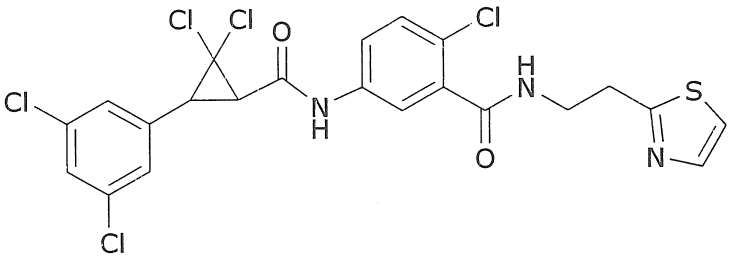
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu xanh lá nhạt (0,052g, 52%).

trans-N-(4-(1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)benzyl)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (PF11)



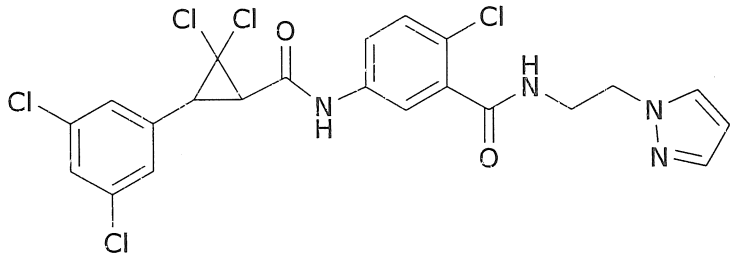
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,077g, 76%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-(2-(thiazol-2-yl)etyl)benzamit (PF12)



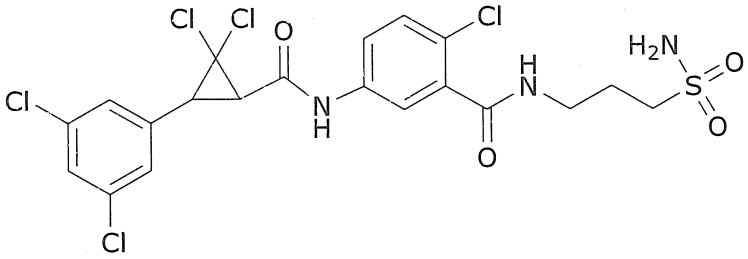
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,032g, 34%).

trans-*N*-(2-(1*H*-Pyrazol-1-yl)etyl)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (PF13)



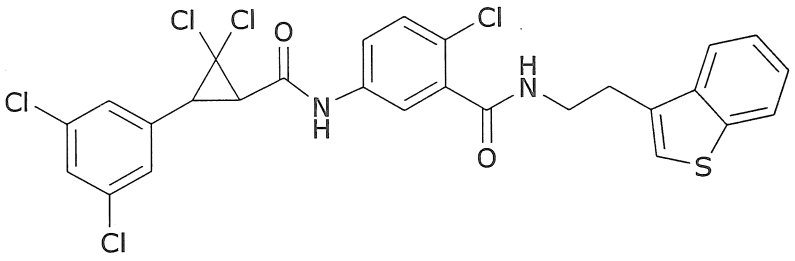
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,061g, 68%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-(3-sulfamoylpropyl)benzamit (PF14)



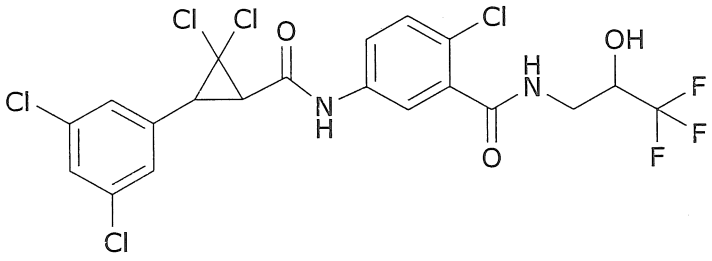
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,023g, 24%).

trans-*N*-(2-(Benzo[*b*]thiophen-3-yl)etyl)-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)benzamit (PF15)



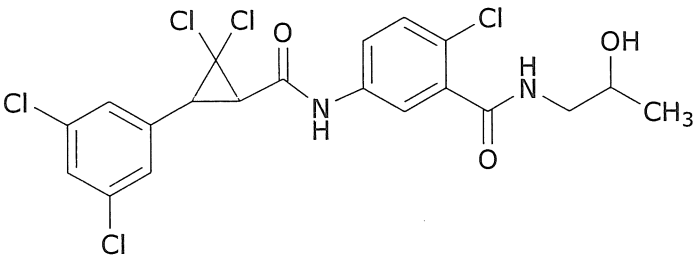
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,064g, 63%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-(3,3,3-triflo-2-hydroxypropyl)benzamit (PF16)



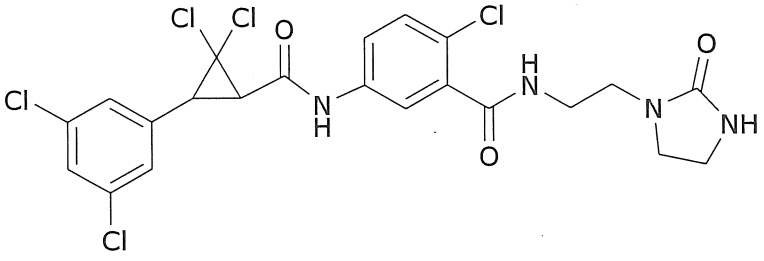
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,055g, 59%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-hydroxypropyl)benzamit (F78)



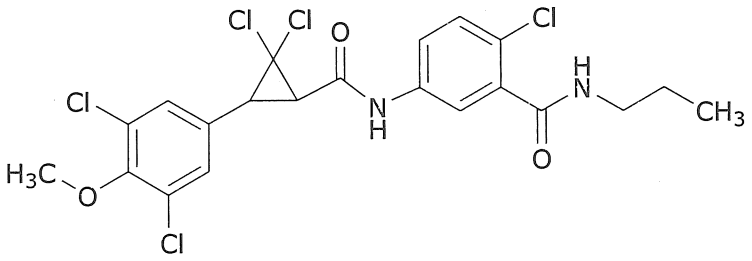
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,036g, 43%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-(2-oxoimidazolidin-1-yl)etyl)benzamit (F79)



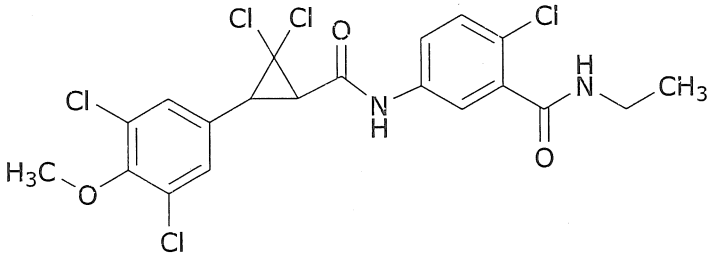
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,038g, 41%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-propylbenzamit (F84)



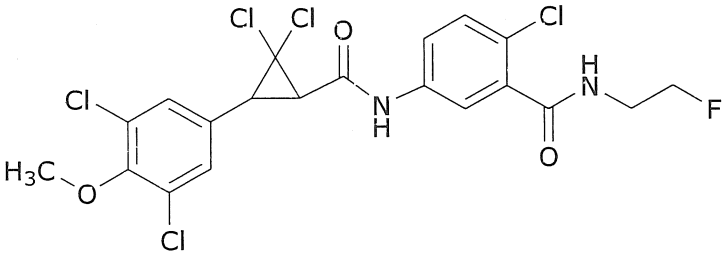
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,125g, 92%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etylbenzamit (F85)



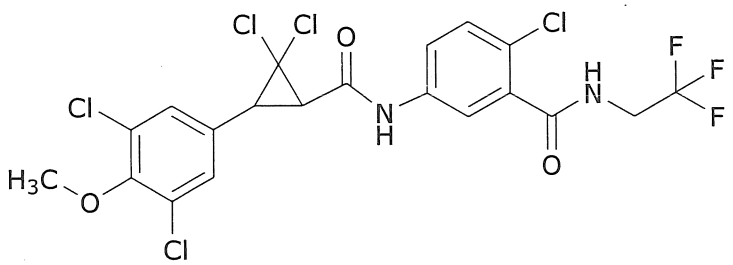
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,126g, 95%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-floetyl)benzamit (F86)



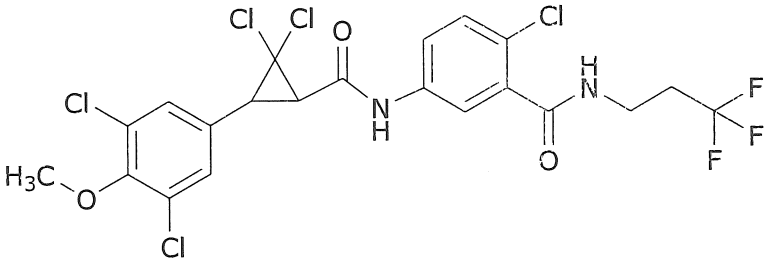
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,119g, 87%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F87)



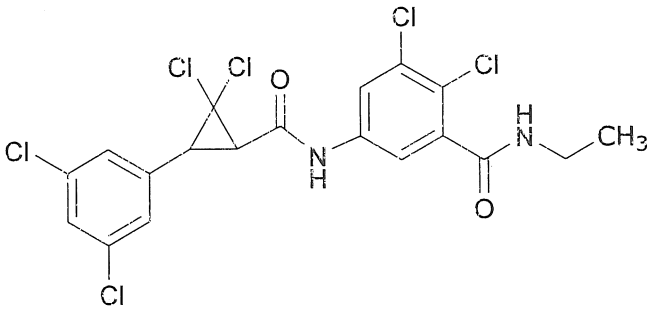
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,128g, 88%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F88)



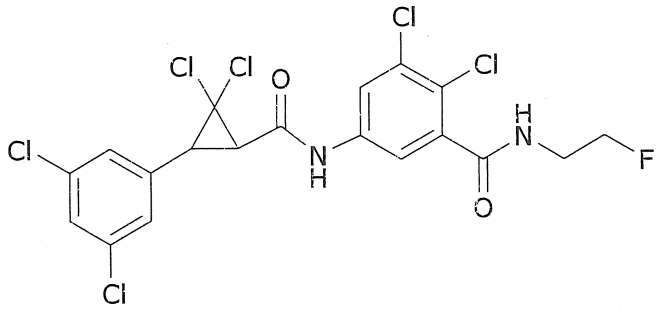
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,138g, 92%).

trans-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etylbenzamit (F91)



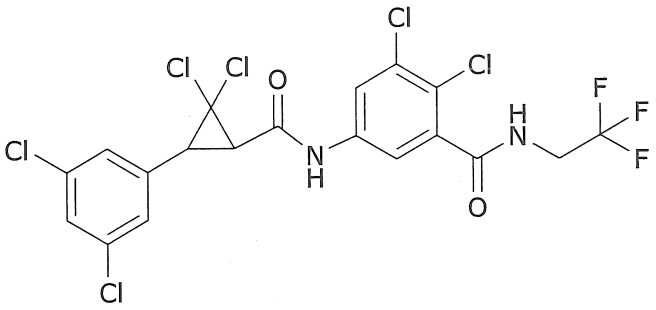
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,038g, 43%).

trans-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-floetyl)benzamit (F92)



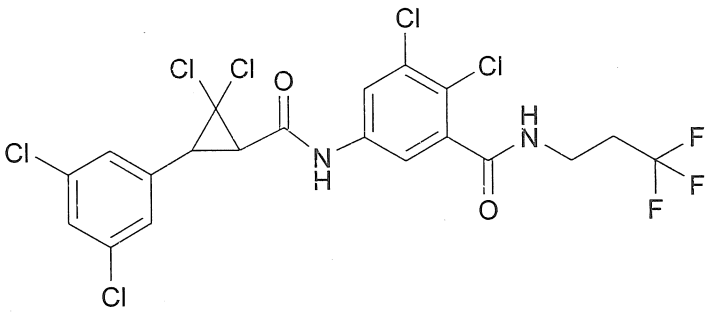
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,037g, 40%).

trans-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F93)



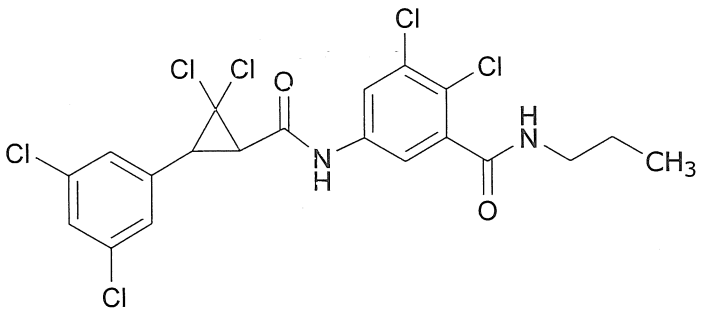
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,013g, 13%).

trans-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F94)



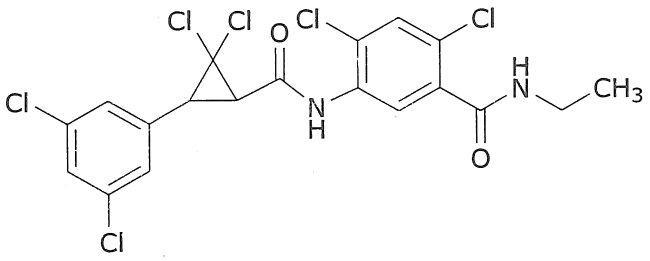
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,046g, 46%).

trans-2,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-propylbenzamit (F95)



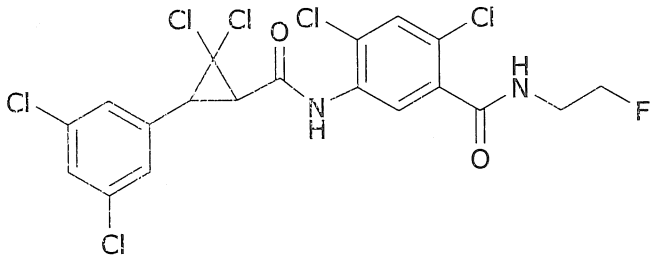
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,061g, 68%).

trans-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etylbenzamit (F98)



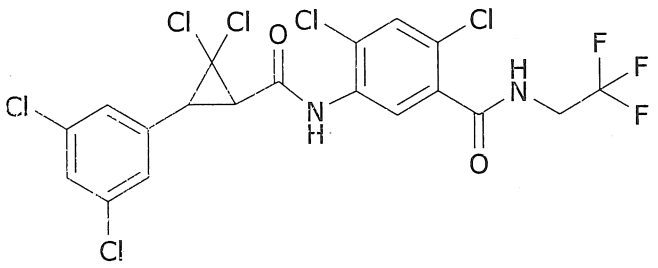
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,052g, 57%).

trans-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-floetyl)benzamit (F99)



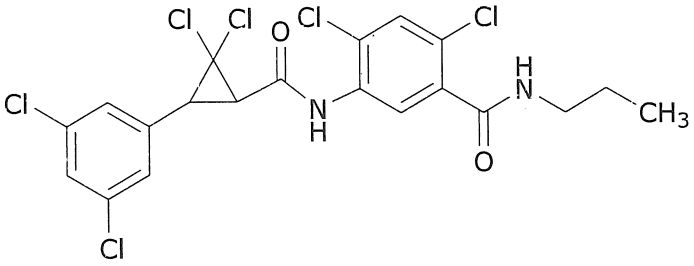
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,047g, 51%).

trans-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F100)



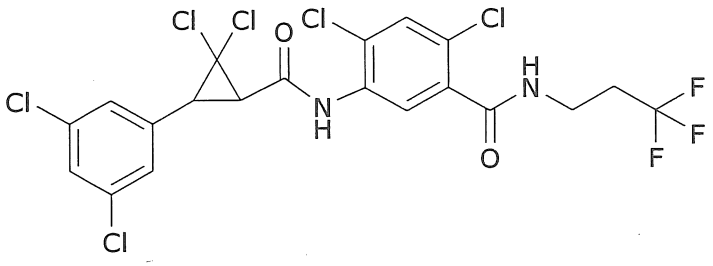
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,041g, 43%).

trans-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-propylbenzamit (F101)



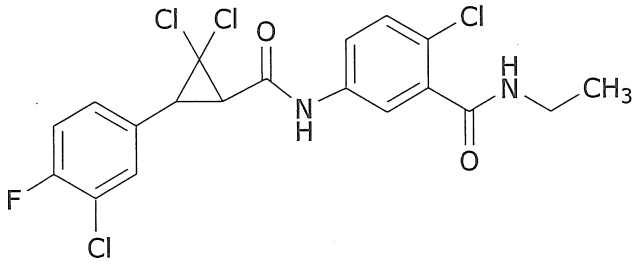
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,037g, 40%).

trans-2,4-diclo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F102)



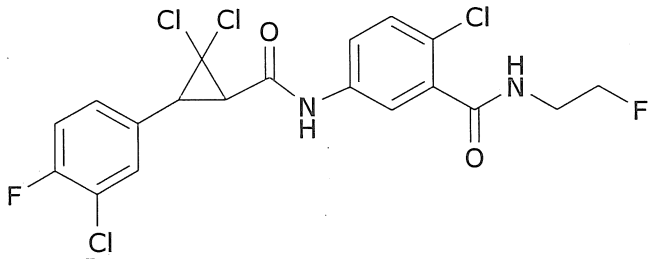
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,046g, 48%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-etylbenzamit (F103)



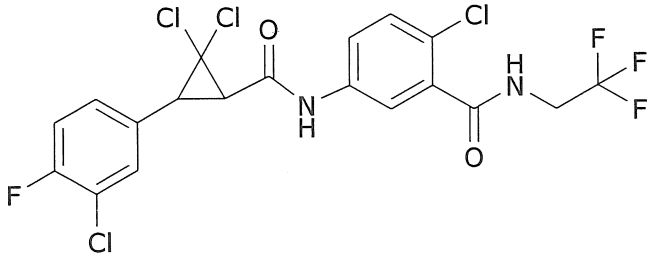
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,061g, 68%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2-floetyl)benzamit (F104)



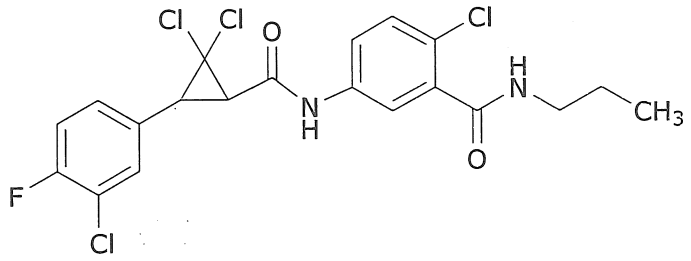
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,063g, 69%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F105)



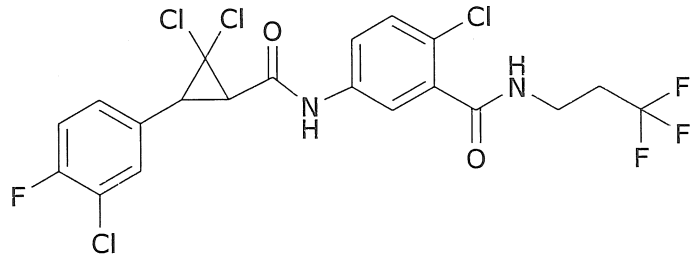
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,069g, 71%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-propylbenzamit (F106)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,077g, 85%).

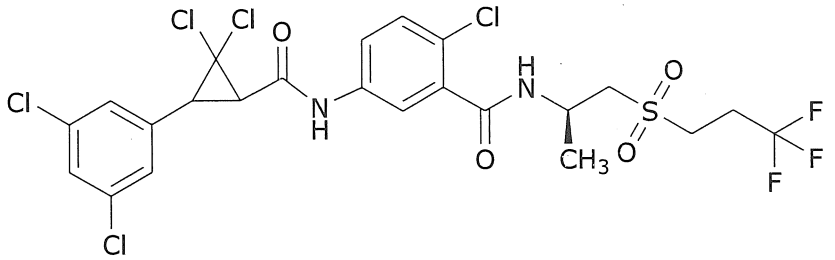
trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(3,3,3-triflopropyl)benzamit (F107)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,068 mg, 65%).

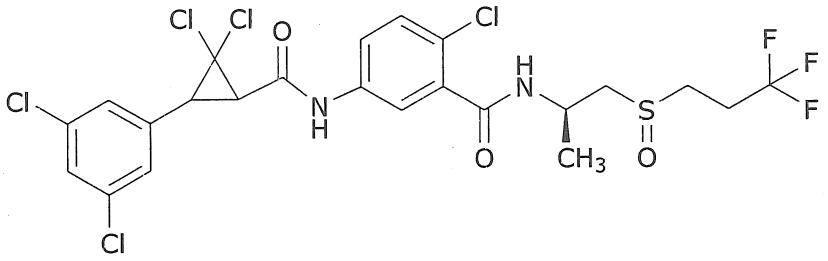
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 17a:

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((*R*)-1-((3,3,3-triflopropyl)sulfonyl) propan-2-yl)benzamit (PF4)



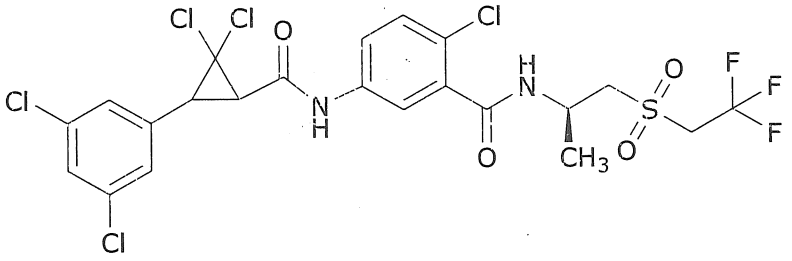
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,0137g, 54%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((2*R*)-1-((3,3,3-triflopropyl)sulfinyl) propan-2-yl)benzamit (PF5)



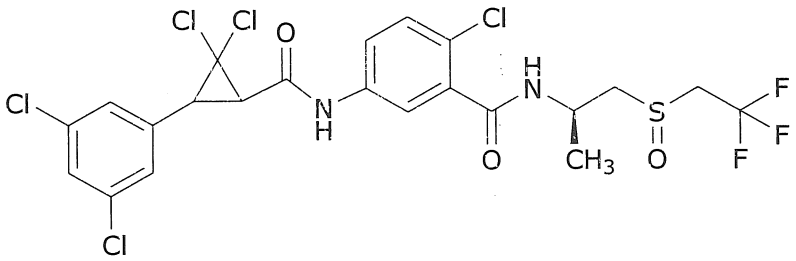
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,109g, 44%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbox-amido)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifloetyl)sulfonyl) propan-2-yl)benzamit (PF6)



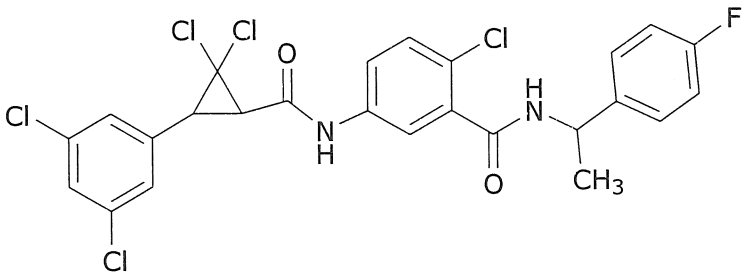
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,107g, 45%).

trans-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifloetyl)sulfinyl) propan-2-yl)benzamit (PF7)



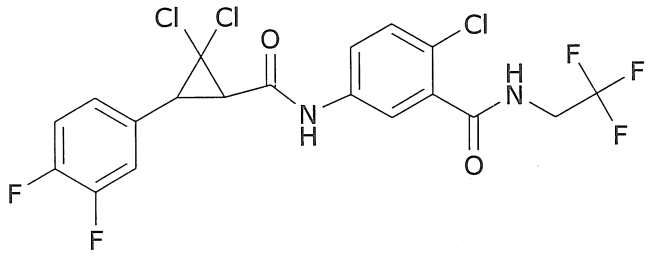
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,120g, 52%).

Ví dụ 23: Điều chế hợp chất 2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(1-(4-flophenyl)etyl)benzamit (F96)



Bổ sung lần lượt pyridin (0,054ml, 0,661mmol) và 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphorinan-2,4,6-trioxit (50% dung dịch trong etyl axetat, 0,281 g 0,441mmol)vào dung dịch*axit trans*-2-clo-5-(2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan carboxamido)benzoic (C67) (0,100g, 0,220mmol) và 1-(4-flophenyl)ethan-1-amin (0,037g, 0,220mmol) trong etyl axetat (3ml), và dung dịch màu vàng nhạt thu được được khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian xấp xỉ 12 giờ. Dung dịch được cô đặc dưới dòng khí nitơ, và tinh chế bằng sắc ký cột nhanh silica gel có pha động là hexans/etyl axetat. Các phần sạch được kết hợp và cô dưới chân không trên thiết bị bay hơi quay để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dầu không màu, sạch (0,058g, 44%).

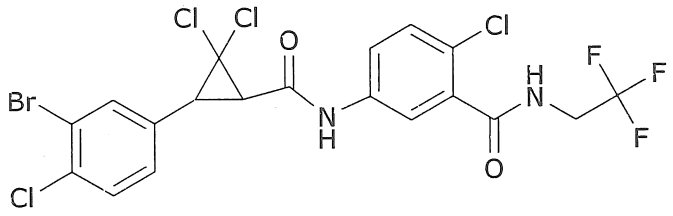
Ví dụ 24: Điều chế hợp chất 2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3,4-diflophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F108)



Bổ sung lần lươt pyridin (0,068ml, 0,843mmol) và 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphorinan-2,4,6-trioxit (50% dung dịch trong etyl axetat, 0,357g, 0,562mmol) vào dung dịch 5-amino-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (C70) (0,071g, 0,281mmol) và *axit trans*-2,2-diclo-3-(3,4-diflophenyl)xyclopropancarboxylic (C124) (0,075g, 0,281mmol) trong etyl axetat (3ml), và dung dịch màu vàng nhạt thu được được khuấy ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng trong thời gian xấp xỉ 14 giờ. Dung dịch được cô đặc dưới dòng khí nitơ, và tinh chế bằng sắc ký cột nhanh silica gel có pha động là hexans/etyl axetat. Các phần sạch được kết hợp và cô dưới chân không trên thiết bị bay hơi quay để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng bọt màu trắng (0,083g, 56%).

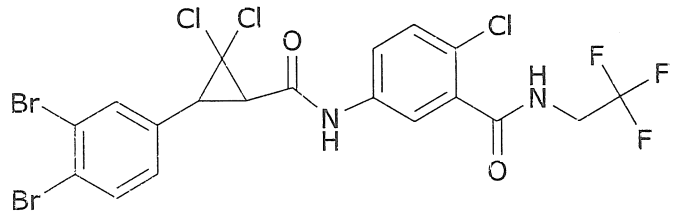
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 24:

5-(*trans*-3-(3-brom-4-clophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F109)



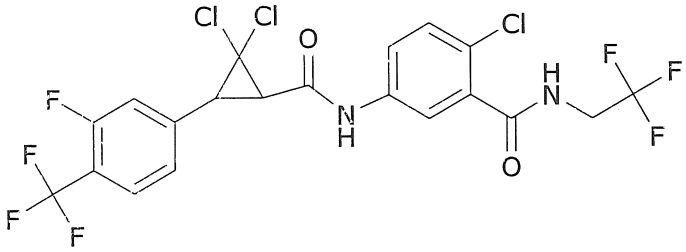
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,100g, 75%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3,4-dibromphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F111)



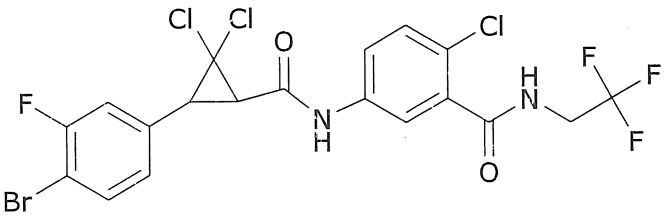
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,090g, 71%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-flo-4-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F112)



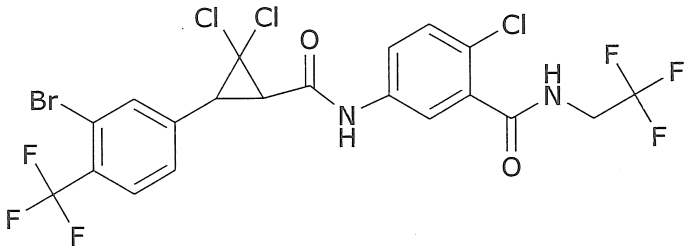
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,073g, 53%).

5-(*trans*-3-(4-brom-3-flophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F113)



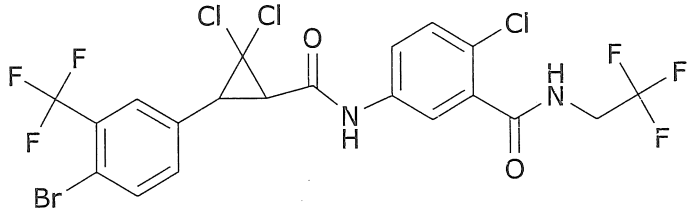
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,086g, 64%).

5-(*trans*-3-(3-brom-4-(triflometyl) phenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F114)



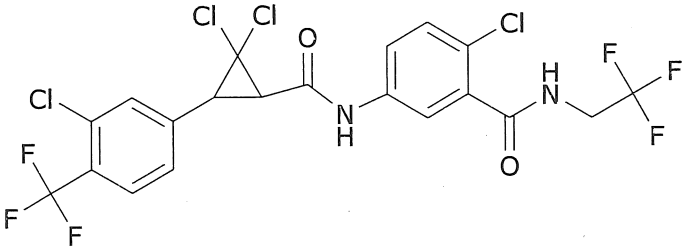
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,085g, 66%).

5-(*trans*-3-(4-brom-3-(triflometyl) phenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F115)



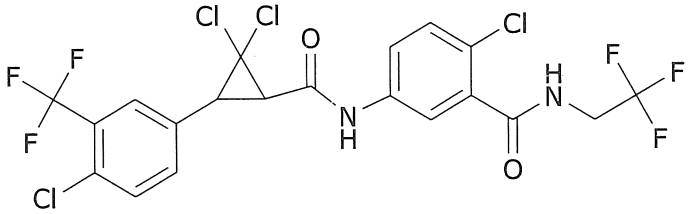
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,095g, 74%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F116)



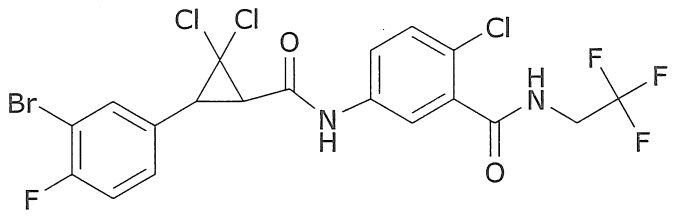
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,081g, 60%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F117)



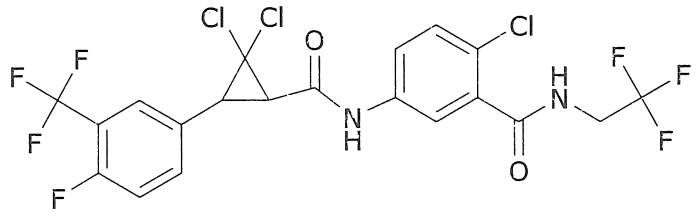
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,097g, 72%).

5-(*trans*-3-(3-brom-4-flophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F118)



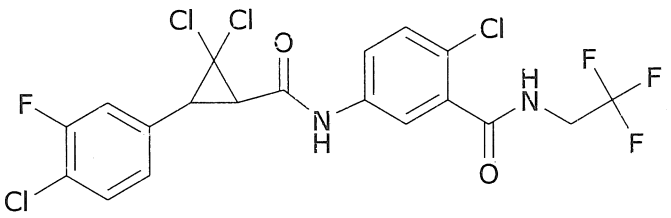
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,113g, 83%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-flo-3-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F119)



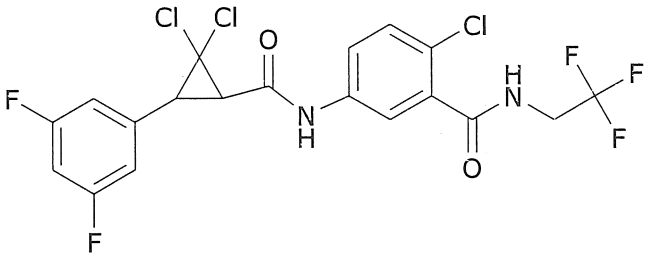
Được phân lập dưới dạng bột vàng (0,111g, 81%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F120)



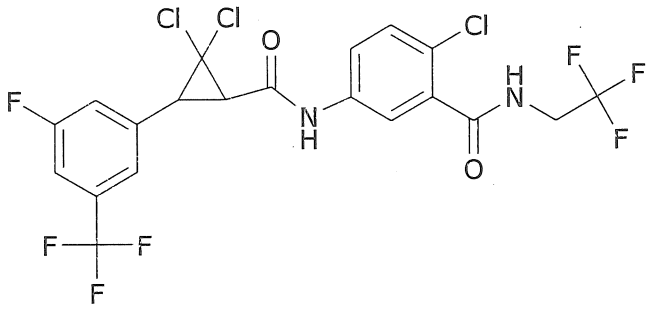
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,120g, 83%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diflophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F121)



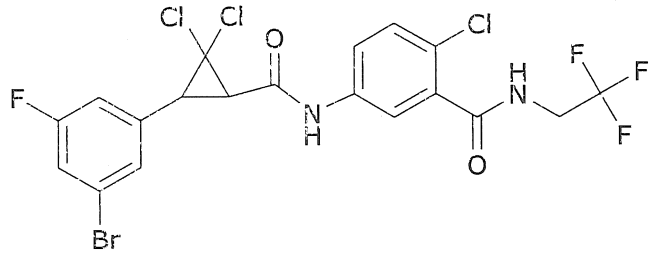
Được phân lập dưới dạng bột màu trắng (0,058g, 39%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-flo-5-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F122)



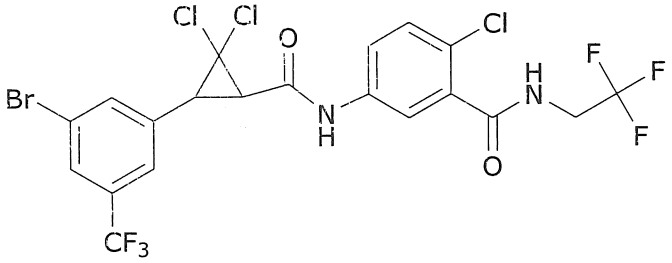
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,112g, 82%).

5-(*trans*-3-(3-brom-5-flophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F123)



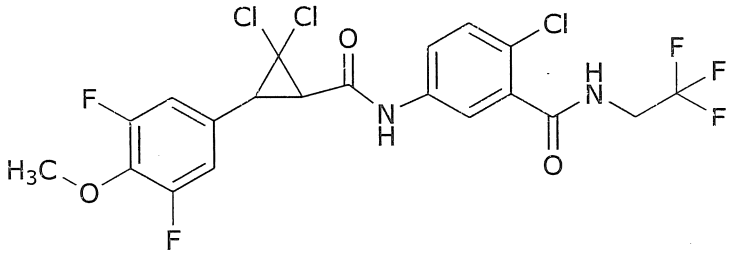
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,097g, 72%).

5-(*trans*-3-(3-brom-5-(triflometyl) phenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxamido)-2-clo-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F124)



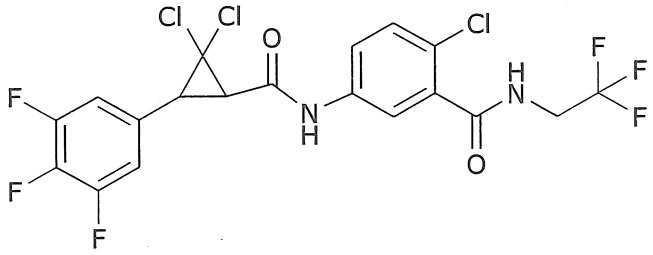
Được phân lập dưới dạng dầu không màu sạch (0,102g, 80%).

2-clo-5-*trans*-(2,2-diclo-3-(3,5-diflo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F125)



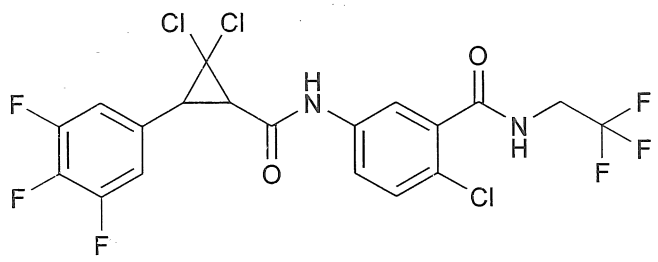
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,075g, 80%).

2-clo-5-*trans*-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triflophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F126)



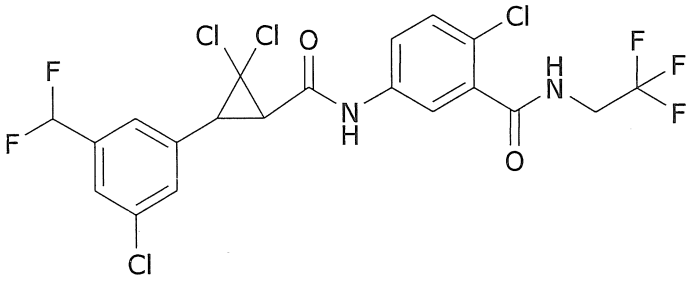
Được phân lập dưới dạng dầu không màu sạch (0,052g, 54%).

2-clo-5-*cis*-(2,2-diclo-3-(3,4,5-triflophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F127)



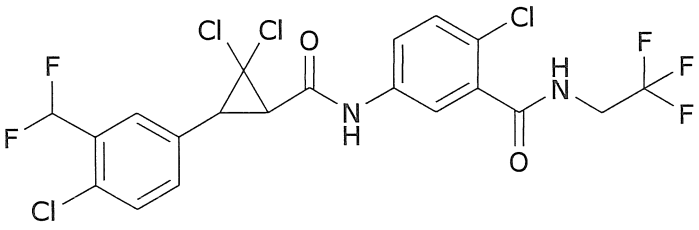
Được phân lập dưới dạng dầu không màu sạch (0,017g, 18%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-5-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F128)



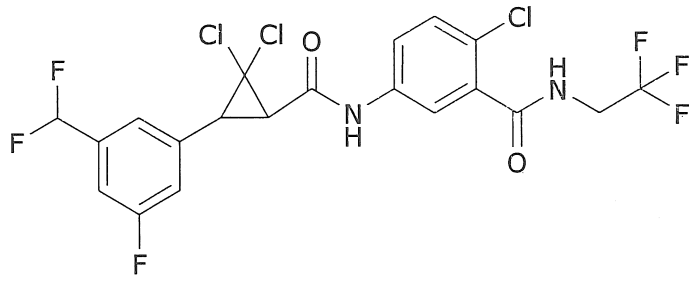
Được phân lập dưới dạng dầu màu vàng (0,063g, 73%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F129)



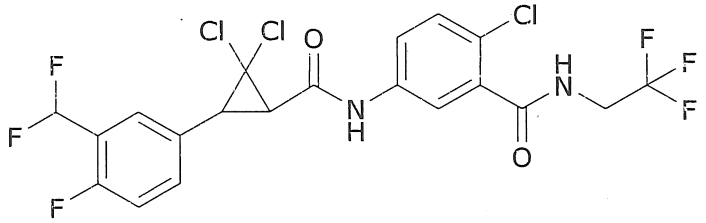
Được phân lập dưới dạng dầu màu vàng nhạt (0,063g, 73%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl)-5-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F130)



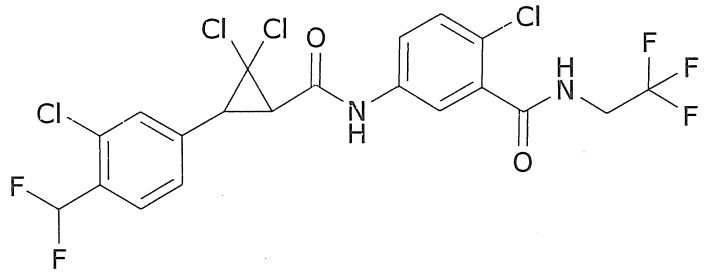
Được phân lập dưới dạng bọt vàng (0,051g, 61%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl)-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F131)



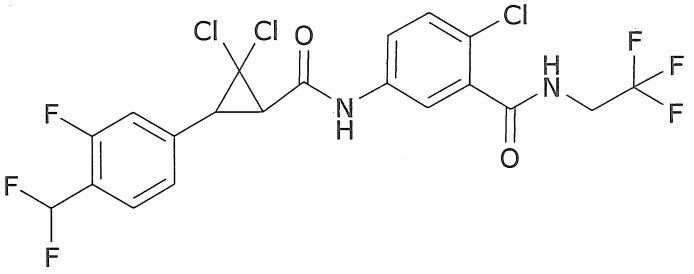
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,059g, 70%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F132)



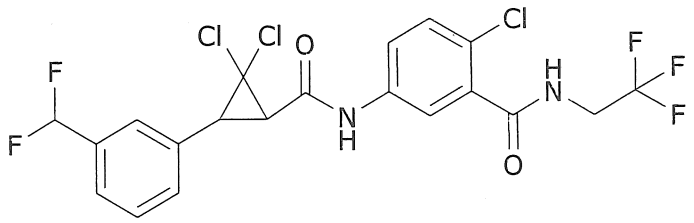
Được phân lập dưới dạng bọt vàng (0,068g, 78%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-(diflometyl)-3-flophenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F133)



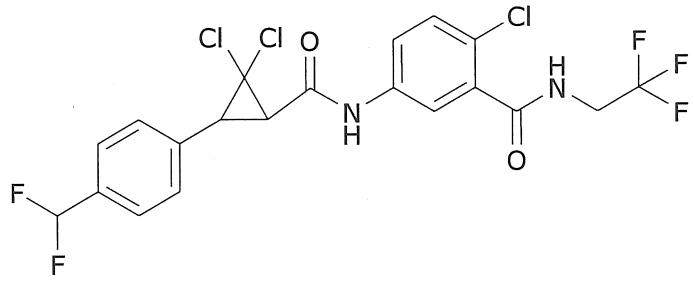
Được phân lập dưới dạng bọt vàng (0,059g, 70%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(3-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F134)



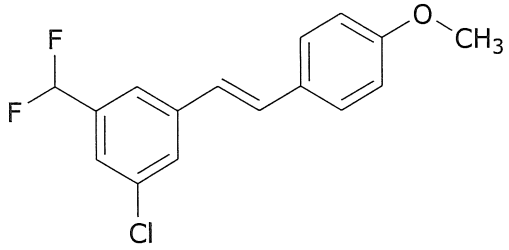
Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,058g, 71%).

2-clo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(4-(diflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxamido)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)benzamit (F135)



Được phân lập dưới dạng bọt màu trắng (0,057g, 70%).

Ví dụ 25: Điều chế hợp chất (*E*)-1-clo-3-(diflometyl)-5-(4-metoxystyryl)benzen (C107)

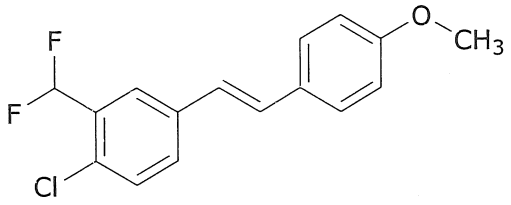


Bổ sung dietylaminosulfur triflorua (31,5ml, 238,97mmol) ở nhiệt độ -78°C vào dung dịch được khuấy (*E*)-3-clo-5-(4-metoxystyryl) benzaldehyt (C115) (13g,

47,79mmol) trong diclometan (130ml). Dung dịch thu được được khuấy trong thời gian 20 giờ ở nhiệt độ nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được làm mát về nhiệt độ 0°C, và dung dịch natri bicarbonat chứa nước bão hòa được bổ sung từng giọt. Các lớp được phân lập và lớp chứa nước được chiết tách với diclometan (3 x 75ml). Tổ hợp lớp hữu cơ was được tinh chế bằng nước và nước muối, được làm khô qua natri sulfat, và cô. Vật liệu thô được tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng 10-20% etyl axetat trong hexans là dung môi rửa giải tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu vàng nhạt (13,1g, 94%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,55 (s, 1H), 7,45 (d, J = 8,8 Hz, 3H), 7,34 (s, 1H), 7,10 (d, J = 16 Hz, 1H), 6,90 (t, J = 8,4 Hz, 3H), 6,61 (t, J = 56,4 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -111,72.

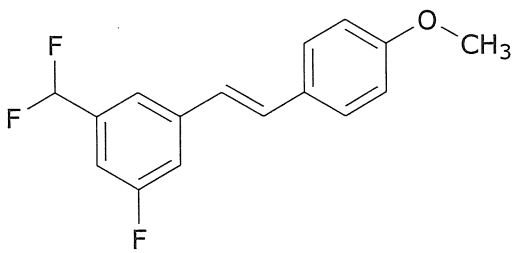
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 25:

(*E*)-1-clo-2-(diflometyl)-4-(4-metoxystyryl) benzen (C108)



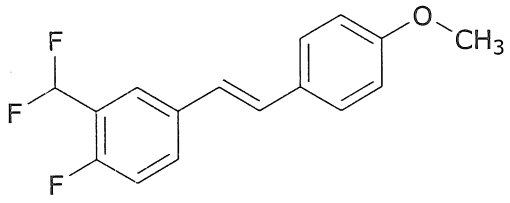
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (12g, 94%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,75 (s, 1H), 7,51 - 7,44 (m, 3H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,13 (d, J = 6,6 Hz, 1H), 7,06 (s, 1H), 6,95 - 6,89 (m, 3H), 3,95(s, 3H); ^{19}F NMR (282 MHz, $CDCl_3$) δ -115,31; ESIMS *m/z* 295 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-(diflometyl)-3-flo-5-(4-metoxystyryl) benzen (C109)



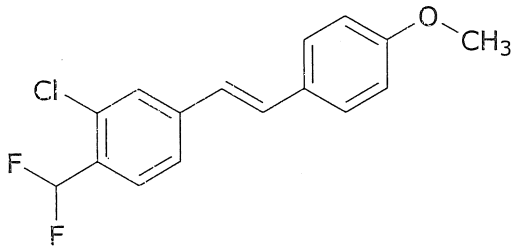
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (20g, 75%); ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,46 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,38 (s, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,08 (t, J = 16,2 Hz, 2H), 6,92 (t, J = 15,6 Hz, 3H), 6,63 (t, J = 56,0 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 279 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-(diflometyl)-1-flo-5-(4-metoxystyryl) benzen (C110)



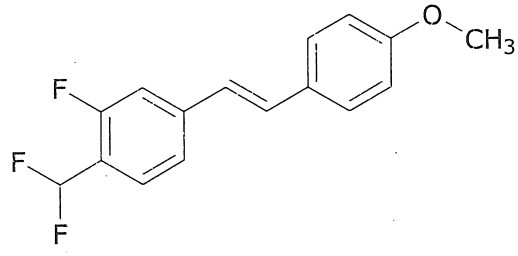
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (14,0g, 70%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,69 (d, *J* = 9,0 Hz, 1H), 7,57 - 7,53 (m, 1H), 7,45 (d, *J* = 9,9 Hz, 2H), 7,13 - 7,06 (m, 2H), 7,00 - 6,89 (m, 4H), 3,85 (s, 3H); ESIMS *m/z* 279 ($[M+H]^+$).

(*E*)- 2-clo-1-(diflometyl)- 4-(4-metoxystyryl) benzen (C111)



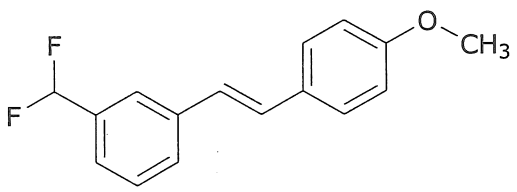
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (18,0g, 90%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,61 (d, *J* = 8,0 Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,47 - 7,43 (m, 3H), 7,14 - 7,07 (m, 1H), 6,94 - 6,80 (m, 4H), 3,85(s, 3H); ESIMS *m/z* 294 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-(diflometyl)-2-flo-4-(4-metoxystyryl) benzen (C112)



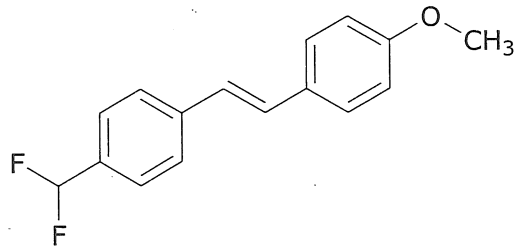
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (9g, 55%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,54 (t, *J* = 8,0 Hz, 1H), 7,46 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 7,32 (d, *J* = 8,0 Hz, 1H), 7,22 (d, *J* = 11,6 Hz, 1H), 7,11 (d, *J* = 16,4 Hz, 1H), 7,01 - 6,83(m, 4H), 3,95 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -113,57, -114,25, -120,33; ESIMS *m/z* 279 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-(diflometyl)-3-(4-metoxystyryl) benzen (C113)



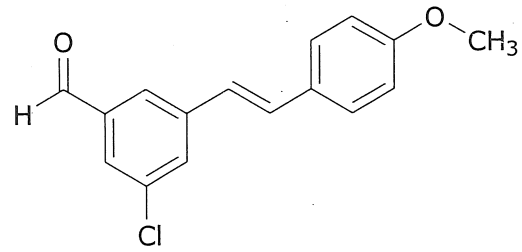
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (6g, 68%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,62 - 7,56 (m, 2H), 7,48 - 7,34 (m, 4H), 7,11 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,95 - 6,89 (t, 2H), 6,66 (t, 1H), 3,95 (s, 3H); ^{19}F NMR (282 MHz, $CDCl_3$) δ -110,84; ESIMS m/z 261 ($[M+H]^+$).

(*E*)-1-(diflometyl)-4-(4-metoxystyryl) benzen (C114)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (15,4g, 75%); ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,57 - 7,45 (m, 6H), 7,12 (d, J = 15,9 Hz, 1H), 7,00 - 6,89 (m, 3H), 6,64 (t, J = 57 Hz, 1H), 3,92 (s, 3H); ESIMS m/z 260,17 ($[M+H]^+$).

Ví dụ 26: Điều chế hợp chất (*E*)-3-clo-5-(4-metoxystyryl) benzaldehyt (C115)

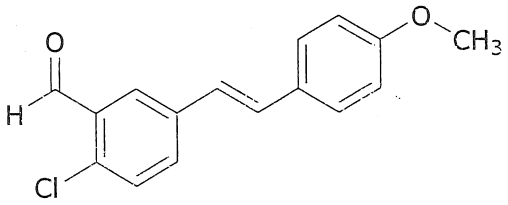


Bổ sung vào 1-metoxy-4-vinylbenzen (18,3g, 136,9mmol) và trietylamin (50,5ml, 273,96mmol) vào dung dịch được khuấy 3-brom-5-clobenzaldehyt (20,0g, 91,32mmol) trong dimetylaxetamit, và hỗn hợp phản ứng được loại khí có khí argon trong thời gian 5 phút. Bổ sung paladi(II) axetat (410 mg, 1,83mmol) và tri-*o*-tolylphosphin (1,11g, 3,65mmol), và hỗn hợp phản ứng thu được được làm nóng đến nhiệt độ 100°C trong thời gian 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước và chiết tách với etyl axetat. Tổ hợp lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat và cô dưới áp lực giảm. Vật liệu thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng hệ etyl axetat 5-10% trong petroleum ete là

dung môi rửa giải tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu vàng (13,5g, 54%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 9,99 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,69 (s, 2H), 7,47 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,16 (d, J = 16,2 Hz, 1H), 6,94 (t, J = 8,4 Hz, 3H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 273 ($[M+H]^+$).

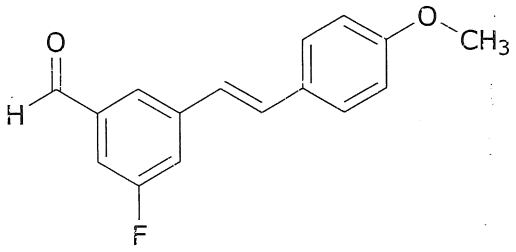
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 26:

(*E*)-2-clo-5-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C116)



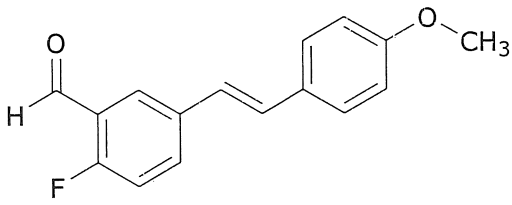
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (11,8g, 27%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 10,45 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,62 (d, J = 6,4 Hz, 1H), 7,46 - 7,40 (m, 3H), 7,12 (d, J = 16,4 Hz, 1H), 6,95 - 6,90 (m, 3H), 3,95 (s, 3H); ESIMS *m/z* 273 ($[M+H]^+$).

(*E*)-3-flo-5-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C117)



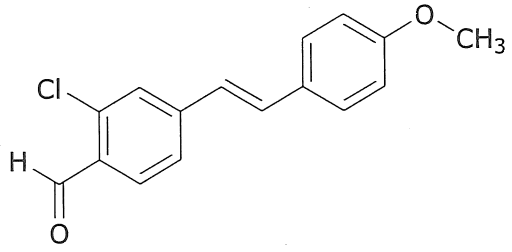
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt (25g, 57%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 10 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,48 - 7,40 (m, 4H), 7,16 (d, J = 16,2 Hz, 1H), 6,94 (t, J = 15,6 Hz, 3H), 3,84 (s, 3H); ESIMS *m/z* 275 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-flo-5-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C118)



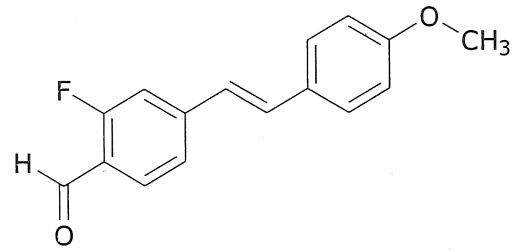
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,25g, 20%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,43 (s, 1H), 7,90 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,54 - 7,46 (m, 4H), 7,20 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,94 - 6,90 (m, 3H), 3,85 (s, 3H); ESIMS m/z 274 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-clo-4-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C119)



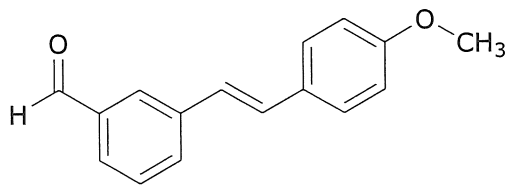
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (8,0g, 57%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,41 (s, 1H), 7,97 (dd, J = 2,4, 6,8 Hz, 1H), 7,71 - 7,67 (m, 1H), 7,44 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,18 - 7,13 (m, 1H), 7,08 - 7,04 (m, 1H), 6,95 - 6,90 (m, 3H), 3,85 (s, 3H); ESIMS m/z 257 ($[M+H]^+$).

(*E*)-2-flo-4-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C120)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu (15g, 78%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,35 (s, 1H), 7,83 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 2H), 6,96 - 6,91 (m, 3H), 3,95 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -122,26; ESIMS m/z 257 ($[M+H]^+$).

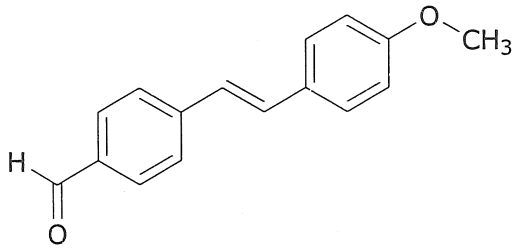
(*E*)-3-(4-metoxystyryl)benzaldehyt (C121)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu (18g, 46%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,15 (s, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,73 (d, J = 7,2 Hz, 2H), 7,53 - 7,46 (m, 3H), 7,17

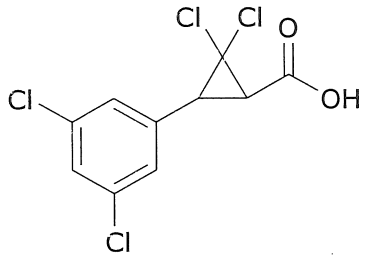
(d, J = 16,8 Hz, 1H), 7,01 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 3,84(s, 3H); ESIMS m/z 239 ($[M+H]^+$).

(*E*)-4-(4-metoxystyryl) benzaldehyt (C122)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu nhạt (9g, 47%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10 (s, 1H), 7,84 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,23 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,00 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H).

Ví dụ 27: Điều chế hợp chất *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclo-propan-1axit carboxylic (C1)

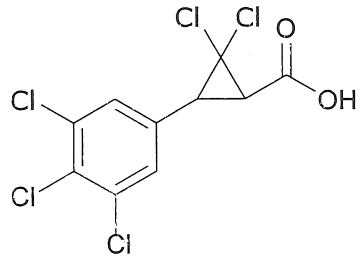


Natri permanganat (40% chứa nước) (84g, 236mmol) được bổ sung từng giọt vào hỗn hợp được khuấy *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C115) (58,7g, 196mmol) trong axeton (982ml) ở nhiệt độ 15°C. Hỗn hợp thụ được được khuấy ở nhiệt độ 20°C trong thời gian 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với isopropyl alcohol (20ml) và cô để loại bỏ axeton. Celite® và chứa nước axit hydrocloric (1 N, 295ml, 295mmol) được bổ sung vào phần còn lại màu nâu. Hỗn hợp thụ được được pha loãng với etyl axetat (500ml) và lọc qua Celite®. Phần lọc được tinh chế bằng nước muối (200ml). Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat, được lọc và cô. Hỗn dịch thu được được pha loãng với heptan (~200ml) và cho phép để làm đặc lại ở nhiệt độ 20°C. Chất rắn được thu lại, được tinh chế bằng heptan và làm khô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (54,68g, 91%):^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,36 (t, J = 1,9 Hz, 1H), 7,17 (dd, J = 1,9, 0,7 Hz, 2H), 3,48 - 3,37 (m, 1H), 2,87 (d, J = 8,3 Hz,

1H); ^{13}C NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 135,44, 135,28, 128,66, 127,30, 39,68, 36,88; ESIMS *m/z* = 298,9 ([M-H])$^-$.

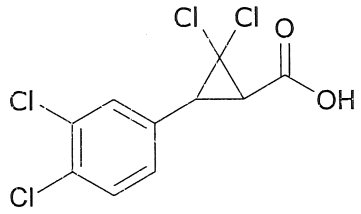
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 27:

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C2)



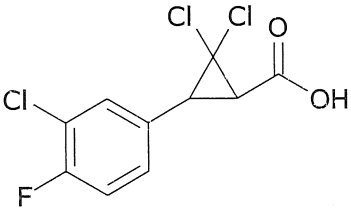
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (2,78g, 95%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,41 (s, 1H), 7,81 (d, *J* = 0,6 Hz, 2H), 3,62 (d, *J* = 8,6 Hz, 1H), 3,52 (d, *J* = 8,6 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 332 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic(C3)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (124g, 82%): mp 133 - 135°C: ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 13,39 (s, 1H), 7,76 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 7,64 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 7,44 (dd, *J* = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 3,49 (s, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,34, 133,35, 130,47, 130,33, 130,09, 129,77, 128,81, 61,43, 37,00, 36,06.

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C16)

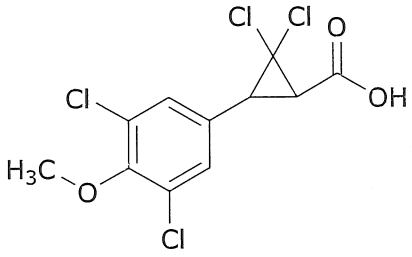


Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (165g, 71%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,57 (s, 1H), 7,42 (dd, *J* = 8,2, 7,6 Hz, 1H), 7,11 - 6,98 (m, 2H), 3,46 (d, *J* =

8,2 Hz, 1H), 2,85 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -114,07; ESIMS *m/z* 282 ([M-H]$^-$).

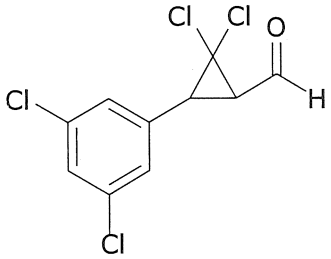
Việc điều chế khác, được phân lập dưới dạng bột màu trắng (10,385g, 77%): 119-121°C; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,83 (s, 1H), 7,32 (d, J = 6,9 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 6,7 Hz, 2H), 3,45 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,85 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 172,18, 159,26, 156,77, 130,95, 129,26, 129,22, 128,57, 128,50, 121,52, 121,34, 116,94, 116,73, 61,59, 39,64, 37,30; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -115,16; ESIMS *m/z* 281 [(M-H)$^-$].

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropancarboxylic (C123)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (1,33g, 96%): mp 161-164°C; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13,35 (s, 1H), 7,63 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,52 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,6 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,81, 151,02, 131,07, 129,63, 128,03, 61,93, 60,52, 37,22, 36,54; ESIMS *m/z* 329 [(M-H)$^-$].

Ví dụ 28: Điều chế hợp chất *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclo-propan-1-carbaldehyt (C140)

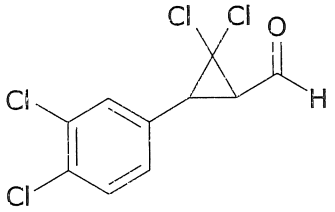


Axit hydrocloric chứa nước (2 N, 237ml) được bổ sung vào dung dịch được khuấy 1,3-diclo-5-((*trans*-2,2-diclo-3-(dietoxymetyl)xyclopropyl)benzen (C145) (85,7g, 227mmol) trong axetonitril (1184ml). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 20°C trong thời gian 16 giờ. Hỗn hợp thu được được pha loãng với nước (200ml) và cô để loại bỏ axetonitril. Hỗn hợp chứa nước thu được được chiết tách với hexan (600ml). Lớp hữu cơ được tinh chế bằng nước (300ml), được làm khô qua natri sulfat khan, được lọc và cô.

Hợp chất thô được tinh chế bằng sắc ký để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu vàng (58,7g, 86%, độ tinh khiết 95%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,54 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 7,46 - 7,09 (m, 3H), 3,51 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 2,92 (dd, J = 8,0, 4,0 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 193,41, 135,33, 135,09, 128,78, 127,34, 42,89, 39,31; IR (màng mỏng) 3077,79, 2847,30, 1713,57, 1590,66, 1566,39, 1416,76, 1387,06. IR: 3078, 2847, 1714, 1590, 1566, 1417, 1387.

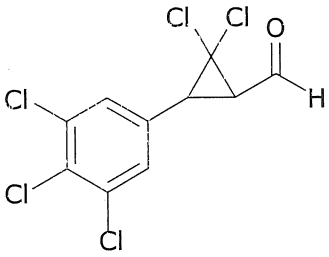
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 28:

trans-2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C141)



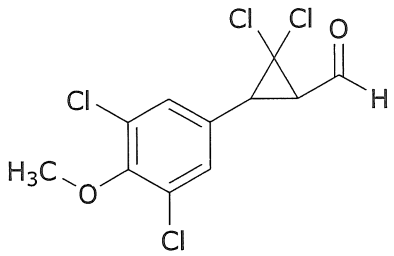
Được phân lập dưới dạng dầu cam (143g, 98%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,53 (d, J = 4,1 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,37 (dd, J = 2,2, 0,7 Hz, 1H), 7,12 (ddd, J = 8,3, 2,2, 0,7 Hz, 1H), 3,51 (dd, J = 7,9, 0,8 Hz, 1H), 2,90 (dd, J = 8,0, 4,1 Hz, 1H).

trans-2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C142)



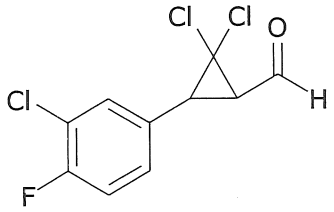
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu vàng (2,8g, 69%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,55 (d, J = 3,9 Hz, 1H), 7,30 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 3,48 (dt, J = 8,0, 0,8 Hz, 1H), 2,92 (dd, J = 7,9, 3,9 Hz, 1H).

trans-2,2-diclo-3-(3,5-diclo-4-metoxyphenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C143)



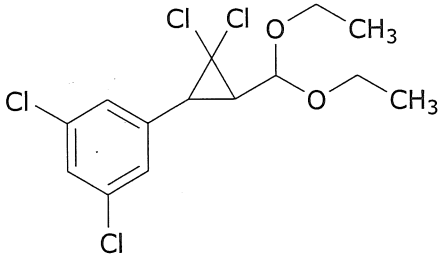
Được phân lập dưới dạng dầu màu vàng nhạt (1,346g, 74%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,52 (d, *J* = 4,0 Hz, 1H), 7,22 (s, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,48 (d, *J* = 8,0 Hz, 1H), 2,91 (dd, *J* = 8,0, 4,0 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 191,67, 150,58, 127,74, 127,54, 127,35, 59,76, 58,94, 41,14, 37,13; EIMS *m/z* 314.

trans-2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C144)



Được phân lập dưới dạng dầu màu vàng (12,496g, 71%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,52 (d, *J* = 4,1 Hz, 1H), 7,33 (d, *J* = 7,2 Hz, 1H), 7,16 (dd, *J* = 6,8, 1,0 Hz, 2H), 3,53 (d, *J* = 7,9 Hz, 1H), 2,90 (dd, *J* = 7,9, 4,1 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 193,77, 159,27, 156,78, 131,03, 129,04, 129,00, 128,66, 128,59, 121,49, 121,31, 116,95, 116,74, 61,68, 43,10, 39,25; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -115,01; EIMS *m/z* 266.

Ví dụ 29: Điều chế hợp chất 1,3-diclo-5-(*trans*-2,2-diclo-3-(dietoxy-metyl)xyclopropyl)benzen (C145)

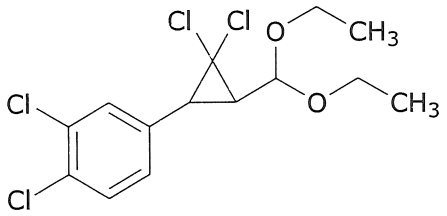


Bình 4 cổ dung tích 1L được trang bị có cánh khuấy cơ học, bộ ngưng tụ, cảm biến nhiệt độ và đầu vào nitơ được nạp (*E*)-1,3-diclo-5-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)benzen (C150) (40g, 138mmol) và $CHCl_3$ (447ml). Tetrabutylamoni hexaflophosphat(V) (1,081g, 2,76mmol) được bổ sung. Dung dịch màu vàng nhạt được

làm nóng đến nhiệt độ 45°C. Bằng việc khuấy mạnh (~400 rpm), natri hydroxit chứa nước (50%, 182ml) được bổ sung từng giọt qua phễu chiết bổ sung (trong thời gian hơn 1 giờ). Sau thời gian 20 giờ, hỗn hợp được cho phép làm mát. Hỗn hợp được pha loãng với hexan (200ml). Lớp trên hữu cơ được gạn (ra khỏi phần hỗn dịch bên dưới chứa nước) qua Celite®, tinh chế bánh lọc bằng hexan (200ml). Phần lọc được tinh chế bằng nước muối (~200ml), được làm khô qua natri sulfat, được lọc và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu nâu (50,2g, 97%, độ sạch 95%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,31 (t, J = 1,9 Hz, 1H), 7,15 (dd, J = 1,9, 0,7 Hz, 2H), 4,59 (d, J = 6,2 Hz, 1H), 3,80 - 3,57 (m, 4H), 2,77 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,25 (dd, J = 8,5, 6,2 Hz, 1H), 1,30 (t, J = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, J = 7,1 Hz, 3H).

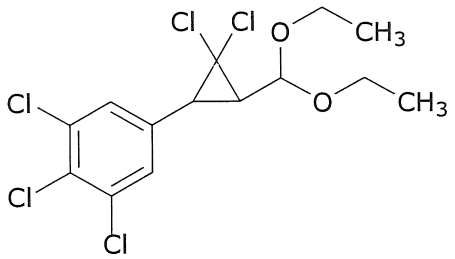
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 29:

1,2-diclo-4-(*trans*-2,2-diclo-3-(dietoxymetyl)xyclopropyl)benzen (C146)



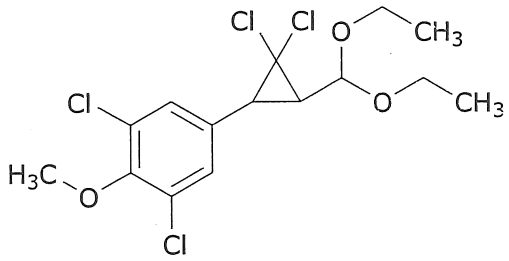
Được phân lập dưới dạng dầu màu nâu (184g, 99%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,43 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 2,2, 0,7 Hz, 1H), 7,10 (ddd, J = 8,3, 2,1, 0,7 Hz, 1H), 4,59 (d, J = 6,2 Hz, 1H), 3,82 - 3,55 (m, 4H), 2,77 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,24 (dd, J = 8,5, 6,3 Hz, 1H), 1,30 (t, J = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, J = 7,1 Hz, 3H).

1,2,3-triclo-5-*(trans*-2,2-diclo-3-(dietoxymetyl)xyclopropyl)benzen (C147)



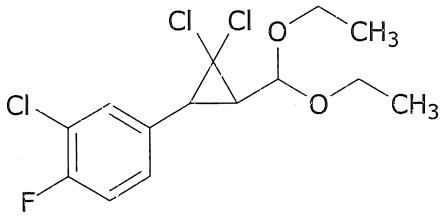
Được phân lập dưới dạng dầu màu nâu (146g, 93%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,29 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 4,59 (d, J = 6,1 Hz, 1H), 3,82 - 3,54 (m, 4H), 2,75 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,23 (dd, J = 8,5, 6,1 Hz, 1H), 1,30 (t, J = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, J = 7,0 Hz, 3H).

trans-1,3-diclo-5-(2,2-diclo-3-(dietoxymetyl)xyclopropyl)-2-metoxybenzen (C148)



Được phân lập dưới dạng dầu cam (2,254g, 80%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,20 (d, *J* = 0,5 Hz, 2H), 4,58 (d, *J* = 6,2 Hz, 1H), 3,90 (s, 3H), 3,67 (m, 4H), 2,74 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 2,22 (dd, *J* = 8,5, 6,2 Hz, 1H), 1,31 (m, 3H), 1,21 (m, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 151,87, 131,55, 129,27, 129,20, 127,21, 101,21, 62,39, 61,88, 61,68, 60,70, 37,67, 36,96, 15,34, 15,25; EIMS *m/z* 387.

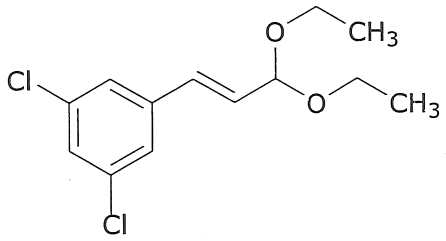
2-clo-4-(*trans*-2,2-diclo-3-(dietoxymetyl)xyclopropyl)-1-flo-benzen (C149)



Được phân lập dưới dạng dầu màu nâu (63g, 96%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,44 (dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz, 1H), 7,29 - 7,22 (m, 1H), 7,09 (t, *J* = 8,7 Hz, 1H), 6,62 (dd, *J* = 16,1, 1,2 Hz, 1H), 6,14 (dd, *J* = 16,1, 5,0 Hz, 1H), 5,05 (dd, *J* = 4,9, 1,2 Hz, 1H), 3,70 (dq, *J* = 9,3, 7,0 Hz, 2H), 3,56 (dq, *J* = 9,4, 7,1 Hz, 2H), 1,25 (t, *J* = 7,1 Hz, 6H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 158,91, 156,42, 133,65, 133,62, 130,47, 128,65, 128,07, 128,05, 126,39, 126,32, 121,26, 121,08, 116,72, 116,51, 100,93, 61,17, 15,24; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -116,36.

Việc điều chế khác, được phân lập dưới dạng dầu màu hổ phách (22,38g, 88%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,31 (m, 1H), 7,13 (m, 2H), 4,59 (d, *J* = 6,3 Hz, 1H), 3,69 (m, 4H), 2,78 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 2,23 (dd, *J* = 8,5, 6,3 Hz, 1H), 1,30 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H), 1,20 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -116,48; ; EIMS *m/z* 295 [M-OEt].

Ví dụ 30: Điều chế hợp chất (*E*)-1,3-diclo-5-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)benzen (C150)

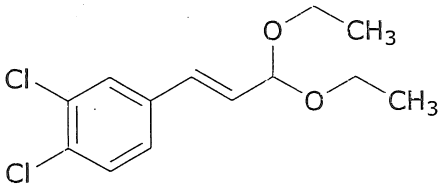


Bước 1a: Axetaldehyt (120g, 2688mmol) được bổ sung vào hỗn hợp được khuấy 3,5-diclobenzaldehyt (96g, 538mmol) trong toluen (400ml) ở nhiệt độ 0°C. Dung dịch kali hydroxit (3,35g, 53,8mmol) trong rượu metyl (10ml) được bổ sung từng giọt qua phễu chiết bổ sung. Hỗn hợp thu được được khuấy ở nhiệt độ 0°C trong thời gian 4 giờ cho đến khi tất cả 3,5-diclobenzaldehyt được dùng bằng sắc ký lớp mỏng. Bước 1b: Etyl axetat (500ml) và axit hydrocloric được cô đặc (37% chứa nước, 44,1ml, 538mmol) được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng. Hỗn hợp thụ được được làm nóng đến nhiệt độ 80°C, và dung dịch không màu được cho phép để chưng cất (200ml). Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với nước (500ml) và chiết tách với etyl axetat. Lớp hữu cơ được tinh chế bằng nước muối, được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô để thu được (*E*)-3-(3,5-diclophenyl) acrylaldehyt là chất rắn màu vàng nhạt (115 g) mà được sử dụng trực tiếp mà không cần tinh chế thêm: ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 9,72 (dd, J = 7,4, 0,5 Hz, 1H), 7,43 (q, J = 1,8 Hz, 3H), 7,35 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 6,69 (dd, J = 16,0, 7,4 Hz, 1H).

Bước 2: Trietoxymetane (31,4g, 208mmol) và pyridin-1-ium 4-metylbenzensulfonat (0,528g, 2,079mmol) được bổ sung vào dung dịch được khuấy (*E*)-3-(3,5-diclophenyl) acrylaldehyt (44g, 208mmol) trong etanol (416ml). Hỗn hợp thụ được được khuấy ở nhiệt độ 20°C trong thời gian 20 giờ. Dung dịch natri carbonat chứa nước bão hòa (50ml) được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng. Hỗn hợp thu được được cô đặc ở nhiệt độ 45°C để loại bỏ etanol. Phần cô đặc được pha loãng với nước và chiết tách với hexan. Lớp hữu cơ được tinh chế bằng nước muối, được làm khô qua natri sulfat, được lọc và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng dầu màu vàng nhạt (56,13g, 93%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,25 (dt, J = 10,6, 1,9 Hz, 3H), 6,61 (dd, J = 16,1, 1,1 Hz, 1H), 6,22 (dd, J = 16,1, 4,7 Hz, 1H), 5,17 (s, 1H), 5,14 - 5,00 (m, 1H), 3,78 - 3,49 (m, 4H), 1,24 (q, J = 7,2 Hz, 6H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 139,34, 135,14, 130,27, 129,88, 127,71, 125,08, 100,60, 61,20, 15,25.

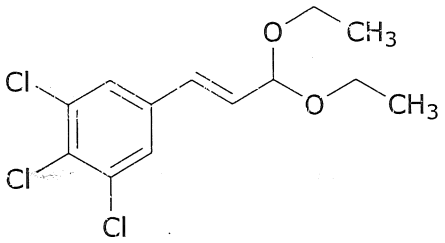
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 30:

(*E*)-1,2-diclo-4-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)benzen(C151)



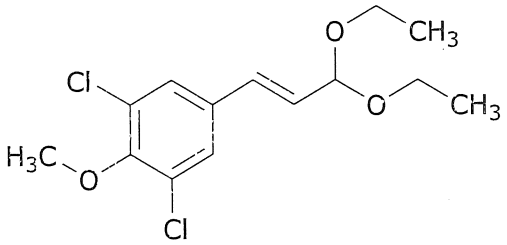
Được phân lập dưới dạng dầu cam (142g, 91%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,48 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 7,39 (dd, *J* = 8,3, 0,8 Hz, 1H), 6,62 (d, *J* = 16,1 Hz, 1H), 6,20 (ddd, *J* = 16,1, 4,9, 0,8 Hz, 1H), 5,06 (dt, *J* = 4,9, 1,0 Hz, 1H), 3,78 - 3,48 (m, 4H), 1,25 (td, *J* = 7,1, 0,8 Hz, 6H).

(*E*)-1,2,3-triclo-5-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)benzen(C152)



Được phân lập dưới dạng dầu cam (40g, 91%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,41 (s, 2H), 6,58 (dd, *J* = 16,1, 1,2 Hz, 1H), 6,21 (dd, *J* = 16,1, 4,6 Hz, 1H), 5,06 (dd, *J* = 4,7, 1,2 Hz, 1H), 3,69 (dq, *J* = 9,3, 7,1 Hz, 2H), 3,55 (dq, *J* = 9,5, 7,0 Hz, 2H), 1,25 (t, *J* = 7,1 Hz, 6H).

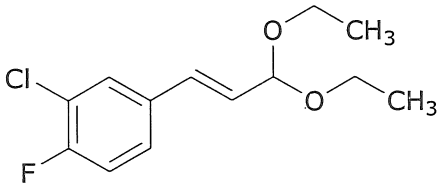
(E)-1,3-diclo-5-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)-2-metoxybenzen (C153)



Được phân lập dưới dạng dầu màu vàng (2,305g, 56%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,32 (s, 2H), 6,56 (d, *J* = 16,0 Hz, 1H), 6,14 (dd, *J* = 16,1, 4,8 Hz, 1H), 5,05 (dd, *J* = 4,8, 1,0 Hz, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 3,55 (m, 2H), 1,25 (t, *J* = 7,1 Hz,

6H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 151,75, 133,87, 129,87, 129,45, 128,85, 126,91, 100,68, 61,14, 60,73, 15,24; EIMS *m/z* 304.

(*E*)-2-clo-4-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)-1-flobenzen (C154)

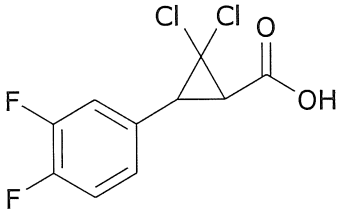


Được phân lập dưới dạng dầu cam (283g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,44 (dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz, 1H), 7,29 - 7,22 (m, 1H), 7,09 (t, *J* = 8,7 Hz, 1H), 6,62 (dd, *J* = 16,1, 1,2 Hz, 1H), 6,14 (dd, *J* = 16,1, 5,0 Hz, 1H), 5,05 (dd, *J* = 4,9, 1,2 Hz, 1H), 3,70 (dq, *J* = 9,3, 7,0 Hz, 2H), 3,56 (dq, *J* = 9,4, 7,1 Hz, 2H), 1,25 (t, *J* = 7,1 Hz, 6H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 158,91, 156,42, 133,65, 133,62, 130,47, 128,65, 128,07, 128,05, 126,39, 126,32, 121,26, 121,08, 116,72, 116,51, 100,93, 61,17, 15,24; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -116,36.

Việc điều chế khác, được phân lập dưới dạng dầu không màu (16,75g, 64%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,43 (dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,07 (t, *J* = 8,7 Hz, 1H), 6,62 (d, *J* = 16,1 Hz, 1H), 6,13 (dd, *J* = 16,1, 4,9 Hz, 1H), 5,05 (dd, *J* = 4,9, 1,0 Hz, 1H), 3,70 (dq, *J* = 9,4, 7,1 Hz, 2H), 3,56 (dq, *J* = 9,4, 7,0 Hz, 2H), 1,25 (t, *J* = 7,1 Hz, 5H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 158,91, 156,42, 133,65, 133,62, 130,47, 128,65, 128,07, 128,05, 126,39, 126,32, 121,26, 121,08, 116,72, 116,51, 100,93, 61,17, 15,24; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -116,36; EIMS *m/z* 258.

Các hợp chất sau được điều chế theo cách tương tự như đối với các cách tiến hành được chỉ ra trong các Ví dụ từ 27 đến 30:

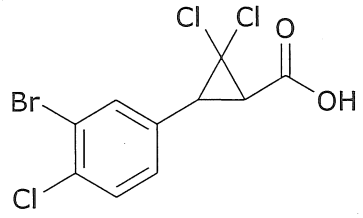
Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,4-diflophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C124)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (1,44g, 67%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,69 (s, 1H), 7,18 (dt, *J* = 9,9, 8,3 Hz, 1H), 7,10 (ddd, *J* = 10,8, 7,3, 2,3 Hz,

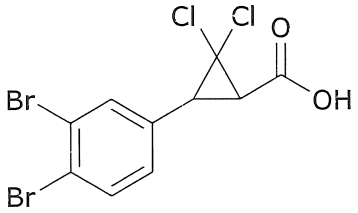
1H), 7,01 (ddt, J = 8,1, 3,8, 1,7 Hz, 1H), 3,44 (dd, J = 8,4, 1,0 Hz, 1H), 2,83 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -136,40, -136,46, -137,42, -137,48; ESIMS *m/z* 266 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-4-clophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C125)



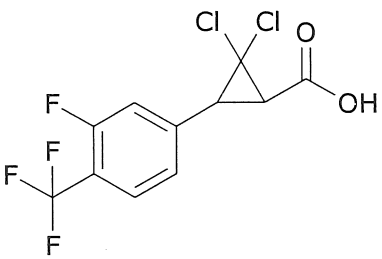
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (1,05g, 63%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,07 - 7,63 (m, 1H), 7,58 - 7,42 (m, 2H), 7,17 (dd, J = 8,3, 2,1 Hz, 1H), 3,43 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,86 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 171,46, 134,71, 133,88, 132,43, 130,42, 128,70, 122,73, 77,33, 77,22, 77,01, 76,69, 61,51, 39,50, 37,21; ESIMS *m/z* 343 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,4-dibromphenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C126)



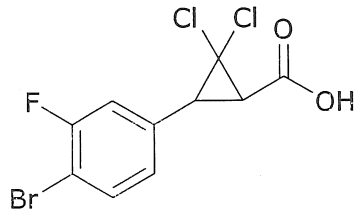
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,488g, 57%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,85 (s, 1H), 7,77 - 7,47 (m, 2H), 7,08 (ddd, J = 8,3, 2,1, 0,7 Hz, 1H), 3,57 - 3,25 (m, 1H), 2,86 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 171,54, 133,82, 133,78, 133,08, 128,78, 125,13, 124,98, 77,33, 77,22, 77,01, 76,70, 61,41, 39,59, 37,14, 0,01; ESIMS *m/z* 387 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-flo-4-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C127)



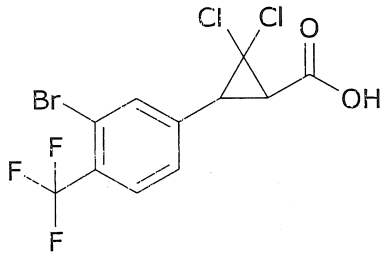
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng giống sáp (4,09g, 69%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,83 (s, 1H), 7,63 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,23 - 7,04 (m, 2H), 3,51 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,92 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61,40, -61,43, -113,24, -113,27; ESIMS *m/z* 316 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(4-brom-3-flophenyl)- 2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C128)



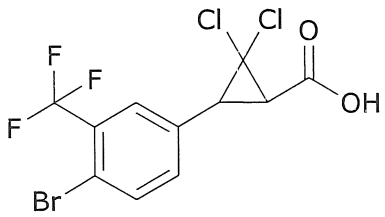
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,41g, 42%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,04 (s, 1H), 7,57 (dd, J = 8,2, 7,1 Hz, 1H), 7,00 (ddd, J = 33,6, 8,7, 2,1 Hz, 2H), 3,43 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,85 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -106,06; ESIMS *m/z* 327 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-4-(triflometyl) phenyl)- 2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C129)



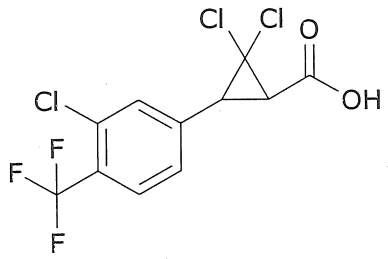
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,55g, 54%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,78 - 7,57 (m, 2H), 7,42 - 7,29 (m, 1H), 3,50 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,93 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,66, -62,67, -62,81; ESIMS *m/z* 377 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(4-brom-3-(triflometyl) phenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C130)



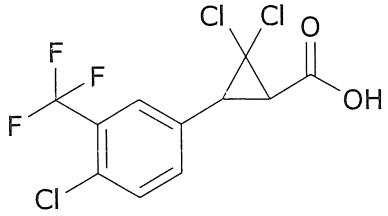
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (1,21g, 51%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,87 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,30 (dd, J = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 3,49 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,77, -62,78; ESIMS *m/z* 377 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-clo-4-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C131)



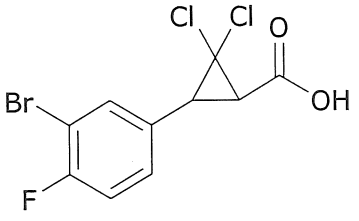
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,778g, 43%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,72 (s, 1H), 7,71 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 7,53 - 7,39 (m, 1H), 7,35 - 7,19 (m, 1H), 3,50 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,93 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,63; ESIMS *m/z* 332 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C132)



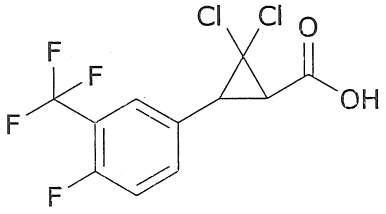
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (2,02g, 43%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,96 - 7,51 (m, 3H), 7,39 (dd, J = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 2,90 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,75, -62,75; ESIMS *m/z* 332 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-4-flophenyl)-2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C133)



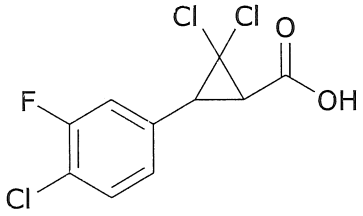
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,850g, 44%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,47 (s, 1H), 7,47 (ddd, J = 6,3, 2,3, 0,7 Hz, 1H), 7,32 - 7,08 (m, 2H), 3,44 (dd, J = 8,3, 1,0 Hz, 1H), 2,84 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -107,16; ESIMS *m/z* 327 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-flo-3-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C134)



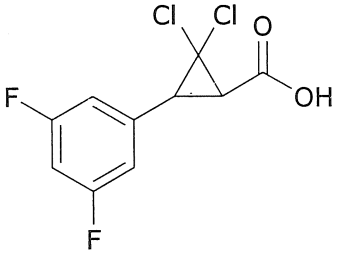
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (3,08g, 67%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,18 (s, 1H), 7,64 - 7,39 (m, 2H), 7,24 (t, J = 9,3 Hz, 1H), 3,50 (dd, J = 8,4, 1,0 Hz, 1H), 2,89 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61,48, -61,51, -114,23, -114,26, -114,29; ESIMS *m/z* 316 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(4-clo-3-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C135)



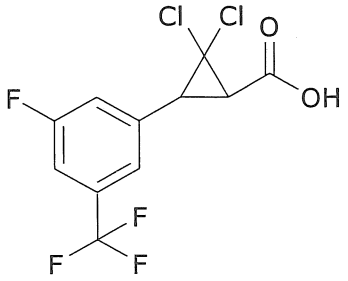
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,96g, 36%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,57 (s, 1H), 7,42 (dd, J = 8,2, 7,6 Hz, 1H), 7,11 - 6,98 (m, 2H), 3,46 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 2,85 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -114,07; ESIMS *m/z* 282 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3,5-diflophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C136)



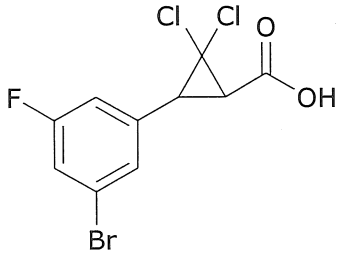
Được phân lập dưới dạng dầu không màu sạch (1,55g, 29%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,44 (s, 1H), 6,82 (qd, *J* = 6,4, 2,3 Hz, 3H), 3,44 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 2,86 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -108,49, -108,69, -108,82, -109,85; ESIMS *m/z* 266 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-2,2-diclo-3-(3-flo-5-(triflometyl) phenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C137)



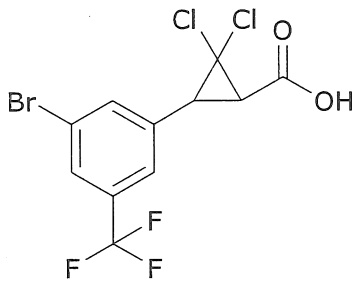
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (3,7g, 55%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,40 (s, 1H), 7,42 - 7,27 (m, 2H), 7,20 (dt, *J* = 8,9, 2,0 Hz, 1H), 3,53 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 2,93 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,86, -109,49; ESIMS *m/z* 316 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-5-flophenyl)- 2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C138)



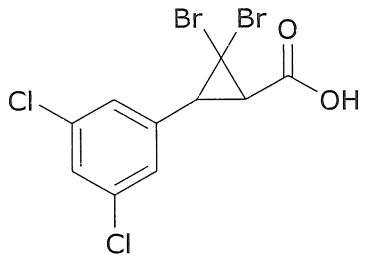
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,76g, 47%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,06 (s, 1H), 7,36 - 7,14 (m, 2H), 7,03 - 6,87 (m, 1H), 3,45 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H), 2,87 (d, *J* = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -109,73, -109,73; ESIMS *m/z* 327 ([M-H]$^-$).

Axit *trans*-3-(3-brom-5-(triflometyl) phenyl)- 2,2-dicloxyclopropan-1-carboxylic (C139)



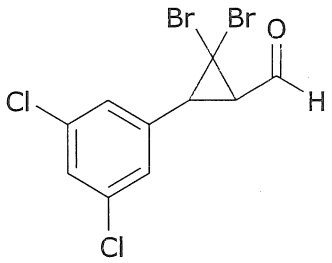
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (0,375g, 31%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,52 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,62 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,52 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 2,93 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62,84; ESIMS *m/z* 377 ([M-H]$^-$).

Ví dụ 31: Điều chế hợp chất axit *trans*-2,2-dibrom-3-(3,5-diclophenyl) xyclopropan-1-carboxylic (C155)



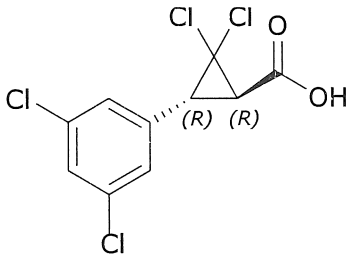
Bổ sung natri hydrogen sulfit (3,26g, 31,36mmol) vào dung dịch *trans*-2,2-dibrom-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-1-carbaldehyt (C156) (1,67g, 4,48mmol) trong axetonitril (15,36ml) và nước (2,5ml). Dung dịch thu được được làm mát về nhiệt độ 0°C, natri clorit (3,54g, 17,92mmol) được bổ sung chậm, và dung dịch được khuấy trong thời gian qua đêm trong khi làm ấm chậm đến nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp sau đó được pha loãng với dung dịch axit hydrocloric chứa nước (1N) cho đến khi độ pH bằng hoặc nhỏ hơn 3. Hỗn hợp sau đó được chiết tách với etyl axetat lặp đi lặp lại nhiều lần. Phần chiết của tổ hợp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat, được lọc và cô dưới chân không. Việc tinh chế chất rắn thô bằng sắc ký cột nhanh với hệ etyl axetat/hexan 0-100% là dung dịch rửa giải đã tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu nâu nhạt (0,91g, 52%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,36 (t, J = 1,9 Hz, 1H), 7,17 (dd, J = 1,9, 0,8 Hz, 2H), 3,39 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 2,91 (d, J = 8,2 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl^3$) δ 172,15, 136,91, 135,25, 128,64, 127,29, 40,29, 37,32, 26,57; ESIMS *m/z* 386 ([M-H]$^-$).

Ví dụ 32: Điều chế hợp chất *trans*-2,2-dibrom-3-(3,5-diclophenyl) xyclopropan-1-carbaldehyt (C156)



Bổ sung tetrabutylamoni hexaflophosphat(V) (70,4 mg, 0,182mmol) tiếp theo là bổ sung cẩn thận natri hydroxit rắn (1454 mg, 36,3mmol) vào dung dịch (*E*)-1,3-diclo-5-(3,3-dietoxyprop-1-en-1-yl)benzen (C150) (0,500g, 1,817mmol) trong bromform (12,1ml) được . Hỗn hợp được làm nóng đến nhiệt độ 90°C trong khi khuấy qua đêm. Hỗn hợp được pha loãng với diclometan và nước và chiết tách với diclometan bổ sung. Lớp hữu cơ sau đó được làm khô qua natri sulfat, được lọc, và cô. Việc tinh chế bằng sắc ký cột nhanh sử dụng etyl axetat/hexan từ 0-100% là dung dịch rửa giải tạo thành dung môi rửa giải mà sau đó được hòa tan trong axeton (4ml) và chứa nước axit hydrocloric (2N)(1ml, 2mmol). Hỗn hợp được khuấy qua đêm. Hỗn hợp được pha loãng với dung dịch natri bicarbonat bão hòa cho đến khi độ pH lớn hơn 7. Hỗn hợp sau đó được chiết tách với dietyl ete và etyl axetat, và các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua natri sulfat và cô để thu được sản phẩm màu nâu đậm (0,03g, 4%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,48 (d, *J* = 4,0 Hz, 1H), 7,37 (t, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,17 (dd, *J* = 1,9, 0,7 Hz, 2H), 3,60 - 3,36 (m, 1H), 2,90 (dd, *J* = 7,9, 4,0 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 194,74, 136,55, 135,31, 128,76, 127,34, 42,34, 39,84, 26,05; ESIMS *m/z* 343 ([M-CHO]$^-$).

Ví dụ 33: Điều chế hợp chất axit (1*R*,3*R*)-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)-xyclopropan-1-carboxylic (C157)



Bước phân tách thứ nhất: (*R*)-1-Phenyletanamin (6,49g, 53,0mmol) được bổ sung chậm vào dung dịch được khuấy *axit rac*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-

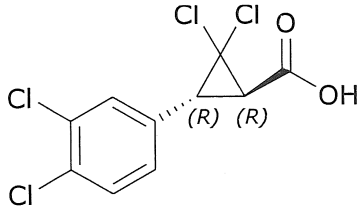
carboxylic) (32,45g, 106mmol) trong axeton (106ml). Dung dịch thu được được khuấy ở nhiệt độ 45°C. Sau khi chất rắn bắt đầu lắng, hỗn hợp được đặt ở nhiệt độ 5°C trong thời gian 4 giờ. Chất rắn được thu lại, được tinh chế bằng axeton được làm mát tối thiểu và làm khô. Muối rắn màu trắng được pha loãng với etyl axetat (100ml) và tinh chế bằng chứa nước axit hydrocloric (1 N, 10ml) và nước muối (30ml). Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat, được lọc và cô để thu được hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (10,33g, 88% lượng dư là chất đồng phân đối hình "*ee*"-enantiomeric excess).

Bước phân tách thứ hai: (*R*)-1-Phenyletanamin (3,4g, 28mmol) được bổ sung chậm vào dung dịch được khuấy *axit rac*-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)xyclopropan-carboxylic) (10,33g, 88% *ee*) trong axeton (100ml). Sau thời gian 2 giờ, chất rắn được thu lại, được tinh chế bằng axeton được làm mát tối thiểu và làm khô. Chất rắn được xử lý với chứa nước axit hydrocloric để tạo ra hợp chất mong muốn dưới dạng chất rắn màu trắng (7,84g, 97% *ee*, 24,2%): Độ quay cực riêng: +47,4 (10 mg/mL trong axetonitril, 589 nm, 25,2°C); ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7,36 (t, J = 1,9 Hz, 1H), 7,17 (dd, J = 1,9, 0,7 Hz, 2H), 3,48 - 3,37 (m, 1H), 2,87 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 166,28, 136,40, 133,39, 127,27, 127,04, 61,36, 37,10, 35,98; ESIMS *m/z* 298,9 ([M-H]$^-$).

ee được xác định bằng phương pháp HPLC Chiral như sau: Cột: CHIRALPAK@ ZWIX(+), kích cỡ hạt 3 µm, kích thước 3 mm x 150 mm, DAIC 511584; Pha động: 49% axetonitril/49% metanol/nước có axit formic 50mM và dietylamin; Tốc độ lưu thông: 0,5ml/phút; Thời gian: 9 phút; Nhiệt độ: 25°C

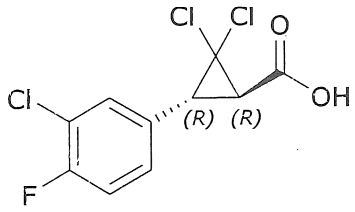
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 33:

Axit (1*R*,3*R*)-2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C158)



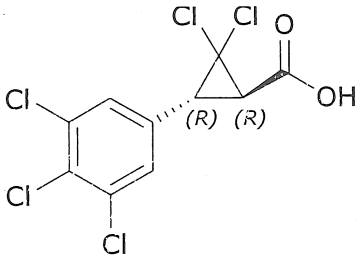
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (6,7g, 30%, 96% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C3.

Axit (1*R*,3*R*)-2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C159)



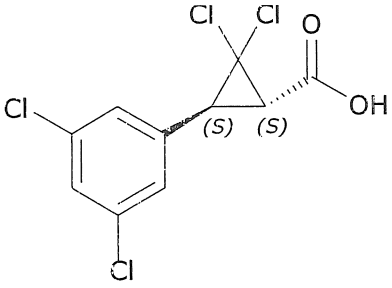
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,5g, 13%, 99% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C16.

Axit (1*R*,3*R*)-2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C160)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (2g, 29%, 99% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C2.

Ví dụ 34: axit (1*S*,3*S*)-2,2-diclo-3-(3,5-diclophenyl)-xyclopropan-1-carboxylic(C161)

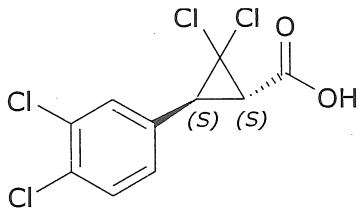


Dịch cái từ bước phân tách axit 1st *R,R*- (từ Ví dụ 33) được cô đặc và hòa tan trong axeton (~100ml) và làm ấm đến 45°C. Bổ sung (*S*)-1-phenyletanamin (5,0g, 41,2mmol, 0,8 eq) bằng cách nhào trộn. Dung dịch thu được được khuấy ở nhiệt độ 45°C. Sau khi chất rắn bắt đầu lắng, hỗn hợp được đặt ở nhiệt độ 5°C trong thời gian 2 giờ. Chất rắn được thu lại, được tinh chế bằng axeton được làm mát tối thiểu và làm khô trong chân không ở nhiệt độ 35°C. Chất rắn được xử lý với chứa nước axit clohydric để tạo ra axit *S,S* tự do là chất rắn màu trắng (9,87g, 59%, 85% *ee*). Bước phân tách thứ hai là 85% *ee* được kết hợp với axit *S,S*(13,45g, 41,7mmol, 85% *ee*) sử dụng cùng sản phẩm với (*S*)-1-phenyletanamin (3,8g, 31,3mmol, 0,75 eq) đã tạo ra axit *S,S*là chất rắn màu trắng (8,53g, 26%, 99% *ee*). Độ quay cực riêng: -51,9 (10 mg/mL trong axetonitril, 589 nm, 25,2°C). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C1

ee được xác định bằng phương pháp HPLC Chiral như sau: Cột: CHIRALPAK@ ZWIX(+), kích cỡ hạt 3 µm, kích thước 3 mm x 150 mm, DAIC 511584; Pha động: 49% axetonitril/49% metanol/nước có axit formic 50mM và dietylamin; Tốc độ lưu thông: 0,5ml/phút; Thời gian: 9 phút; Nhiệt độ: 25°C

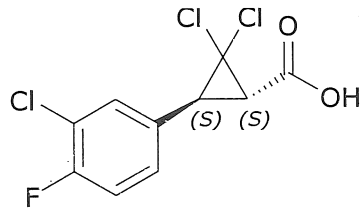
Các hợp chất sau được điều chế theo phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong ví dụ 34:

Axit (1*S*,3*S*)-2,2-diclo-3-(3,4-diclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C162)



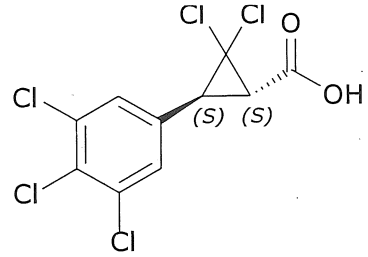
Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (7g, 35%, 98% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C3.

Axit (1*S*,3*S*)-2,2-diclo-3-(3-clo-4-flophenyl)xyclopropan-1-carboxylic (C163)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,64g, 27%, 98% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C16.

Axit (1*S*,3*S*)-2,2-diclo-3-(3,4,5-triclophenyl)xyclopropan-1-carboxylic(C164)



Được phân lập dưới dạng chất rắn màu trắng (0,75g, 41%, 99% *ee*). Dữ liệu phân tích phù hợp với axit raxemic C2.

Nhận ra là một số chất phản ứng và điều kiện phản ứng không có khả năng tương thích đối với tính hữu dụng nhất định mà có thể có trong các hợp chất nhất định có công thức (I) hoặc các hợp chất nhất định được sử dụng trong việc tạo ra các phâ ntử nhất định có công thức (I). Trong trường hợp này, có thể cần thiết dùng các quy trình bảo vệ theo

tiêu chuẩn và khử bảo vệ được báo cáo một cách toàn diện trong tài liệu và và đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này. Ngoài ra, trong một số trường hợp có thể cần thực hiện thêm các bước tổng hợp thông thường không được nêu ở đây để hoàn thành quy trình tổng hợp các hợp chất mong muốn. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ nhận ra rằng có thể đạt được các quy trình tổng hợp các hợp chất mong muốn bằng cách thực hiện một số bước của quy trình thông thường theo thứ tự khác với như được nêu. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ nhận ra rằng có thể thực hiện các phản ứng chuyển hóa hoặc chuyển hóa qua lại nhóm chức tiêu chuẩn trên các hợp chất mong muốn để đưa ra hoặc thay đổi các nhóm thế.

Các thử nghiệm sinh học

Các thử nghiệm sinh học sau đây đối với Sâu xanh da láng (Beet Armyworm) (*Spodoptera exigua*), Sâu bắp cải (*Trichoplusia ni*), Rầy mềm hại quả đào (*Myzus persicae*), và Muỗi gây sốt vàng (*Aedes aegypti*), được bao gồm ở đây do thiệt hại mà chúng gây ra. Hơn nữa, Sâu xanh da láng (Beet Armyworm) và sâu bắp cải là hai loài chỉ thị tốt cho phạm vi rộng về sinh vật gây hại loại nhai nghiền. Ngoài ra, rầy mềm hại quả đào là loài chỉ thị tốt cho phạm vi rộng về sinh vật gây hại hút nhựa cây. Các kết quả đối với ba loài chỉ thị này cùng với muỗi gây sốt vàng thể hiện tính hữu dụng rộng của hợp chất có công thức (I) trong việc kiểm soát sinh vật gây hại trong ngành chân khớp (Phyla Arthropoda), thân mềm (Mollusca), và giun tròn (Nematoda) (Drewes et al.)

Ví dụ A: Các thử nghiệm sinh học trên Sâu xanh da láng (Beet Armyworm)(*Spodoptera exigua*, LAPHEG) ("BAW"), và Sâu bắp cải (Cabbage Looper) (*Trichoplusia ni*, TRIPNI) ("CL")

Sâu xanh da láng (Beet Armyworm) là sinh vật gây hại nghiêm trọng về kinh tế đối với cỏ linh lăng, măng tây, củ cải đường, cam quýt, ngô, bông, hành, đậu Hà Lan, ớt, khoai tây, đậu nành, củ cải đường, hoa hướng dương, thuốc lá, và cà chua, trong số các cây trồng khác. Nó có nguồn gốc ở Đông Nam Á nhưng hiện nay được tìm thấy ở Châu Phi, Úc, Nhật Bản, Bắc Mỹ, và Nam Âu. Ấu trùng có thể ăn theo đàn lớn gây thiệt hại mùa màng. Được biết đến là kháng các thuốc diệt sinh vật gây hại.

Sâu bắp cải sinh vật gây hại nghiêm trọng được tìm thấy trên thế giới. Nó tấn công cỏ linh lăng, đậu, củ cải đường, bông cải xanh, bắp cải tí hon (Brussel sprouts), cải xoăn,

rau diếp, dưa hấu, mù tạt, rau mùi tây, đậu Hà Lan, ớt, khoai tây, đậu nành, rau bina, bí, cà chua, củ cải, và dưa hấu, trong số các cây trồng khác. Các loài này phá hoại lớn đối với cây trồng do sự phàm ăn của nó. Ấu trùng tiêu thụ ba lần khối lượng của chúng theo lượng thức ăn hàng ngày. Vị trí ăn được đánh dấu bởi sự tập hợp lớn của chất nhầy, chất ướt, phân mà có thể góp phần vào áp lực gây bệnh cao hơn do đó gây ra các vấn đề thứ cấp trên cây trồng ở vị trí ăn. Được biết đến là kháng các thuốc diệt sinh vật gây hại.

Do đó, vì các nhân tố nêu trên nên việc kiểm soát sinh vật gây hại này là quan trọng. Hơn nữa, các hợp chất mà kiểm soát các sinh vật gây hại này (BAW và CL), mà được biết đến là sinh vật gây hại loại nhai nghiền, sẽ hữu ích trong việc kiểm soát sinh vật gây hại khác mà nhai nghiền trên cây trồng.

Các hợp chất nhất định được nêu trong tài liệu này được thử nghiệm đối với BAW và CL sử dụng các cách tiến hành được nêu trong các Ví dụ sau. Trong việc báo cáo các kết quả, "Bảng tỷ lệ BAW & CL" được sử dụng (Xem phần bảng).

Thử nghiệm sinh học BAW

Việc thử nghiệm sinh học trên BAW được thực hiện sử dụng thử nghiệm trên khay chế độ ăn có 128 giếng. Ấu trùng BAW tuổi từ một đến năm giây được đặt vào mỗi giếng (3ml) của khay chế độ ăn mà đã được lọc trước bằng khoảng 1,5ml của chế độ ăn nhân tạo mà ở đó 50 $\mu g/cm^2$ hợp chất thử nghiệm (được hòa tan trong 50µl hỗn hợp hệ 90:10 axeton-nước) đã được áp dụng (đối với mỗi tám giếng) và sau đó được cho phép làm khô. Các khay được phủ bằng lớp phủ tự dính sạch, được làm cho thông hơi để cho phép trao đổi khí, và giữ ở nhiệt độ 25°C, 14:10 sáng-tối trong thời gian từ năm đến bảy ngày. Phần trăm tỷ lệ mắc bệnh được ghi lại trong thời gian ấu trùng trong mỗi giếng; hoạt tính trong tám giếng sau đó được lấy trung bình. Các kết quả được chỉ ra trên Bảng được gọi là "Bảng ABC: Các kết quả sinh học" (Xem Phần bảng).

Thử nghiệm sinh học trên CL

Thử nghiệm sinh học trên CL được thực hiện sử dụng thử nghiệm trên khay chế độ ăn có 128 giếng. Ấu trùng CL tuổi từ một đến năm giây được đặt vào mỗi giếng (3ml) của khay chế độ ăn mà đã được lọc trước bằng 1ml của chế độ ăn nhân tạo mà 50 $\mu g/cm^2$ của hợp chất thử nghiệm (được hòa tan trong 50 µL hệ hỗn hợp axeton-nước 90:10) đã được áp dụng (đối với mỗi trong số tám giếng) và sau đó được cho phép làm khô. Các

khay được phủ bằng lớp phủ tự dính sạch, được làm cho thông hơi để cho phép trao đổi khí, và giữ ở nhiệt độ 25°C, 14:10 sáng-tối trong thời gian từ năm đến bảy ngày. Phần trăm tỷ lệ mắc bệnh được ghi lại trong thời gian Ấu trùng trong mỗi giếng; hoạt tính trong tám giếng sau đó được lấy trung bình. Các kết quả được chỉ ra trên Bảng được gọi là "Bảng ABC: Các kết quả sinh học" (Xem Phần bảng).

Ví dụ B: Thử nghiệm sinh học trên rầy mềm hại quả đào (Green Pmỗi Aphid) (*Họ Myzus persicae*, MYZUPE) ("GPA").

GPA là sinh vật gây hại rệp vừng đáng kể nhất của cây đào, làm giảm sự phát triển, héo lá, và sự chết của các mô khác. Nó cũng nguy hiểm do nó đóng vai trò là sinh vật lây nhiễm đối với việc chuyển tải các virut thực vật, như virut khoai tây Y và virut lan truyền khoai tây đến các thành viên của họ cà dược/khoai tây *họ Solanaceae*, và các loại virut khảm khác nhau đới với nhiều loại cây lương thực khác. GPA tấn công các thực vật như bông cải xanh, cải ngựa, cải bắp, cà rốt, súp lơ, củ cải trắng, cà tím, đậu xanh, rau diếp, Mắc ca (macadamia), đu đủ, ớt, khoai lang, cà chua, cải xoong, và bí ngòi, trong số các thực vật khác. GPA cũng tấn công nhiều cây trang trí như hoa cẩm chướng, hoa cúc, hoa trắng bắp cải, hoa cảnh, và hoa hồng. GPA đã phát triển kháng đối với sinh vật gây hại. Hiện nay, đó là sinh vật gây hại mà có số lượng lớn thứ ba về các trường hợp đã báo cáo về việc kháng côn trùng (Sparks et al.). Do đó, do việc kiểm soát các nhân tố nêu trên của sinh vật gây hại này là quan trọng. Hơn nữa, các hợp chất mà kiểm soát sinh vật gây hại này (GPA), mà được biết đến là sinh vật gây hại hút nhựa cây, hữu dụng trong việc kiểm soát sinh vật gây hại khác mà ăn thức ăn từ thực vật.

Các hợp chất nhất định được nêu trong tài liệu này được thử nghiệm đối với GPA sử dụng các cách tiến hành được nêu trong Ví dụ sau đây. Trong việc báo cáo các kết quả, "Bảng tỷ lệ GPA & YFM" được sử dụng (Xem Phần bảng).

Các cây giống con bắp cải được trồng trong chậu 7,62 cm, có các lá thật từ 2-3 nhỏ (3-5 cm), được sử dụng làm nền thử nghiệm. Cây giống đã bị nhiễm 20-50 GPA (giai đoạn trưởng thành không cánh và giai đoạn bạch huyết) một ngày trước khi áp dụng hóa chất. Bốn chậu có các cây giống cá thể được sử dụng cho mỗi việc xử lý. Các hợp chất thử nghiệm (2 mg) được hòa tan trong 2ml dung môi axeton/metanol (1:1), tạo ra các dung dịch gốc của hợp chất thử nghiệm nồng độ 1000 ppm . Các dung dịch gốc được pha loãng 5X bằng Tween 20 0,025% trong nước để thu được dung dịch của hợp chất thử

nghiệm ở nồng độ 200ppm. Bộ phun cầm tay có phần hút được sử dụng để phun dung dịch vào cả hai mặt của lá bắp cải cho đến khi chảy thành ròng. Thực vật đối chứng (kiểm tra dung môi) được phun có chất pha loãng chỉ chứa 20% theo thể tích hệ dung môi axeton/metanol (1:1). Thực vật được xử lý được giữ trong phòng giữ trong thời gian ba ngày ở nhiệt độ khoảng 25°C và độ ẩm tương đối xung quanh (RH-relative humidity) trước khi đánh giá. Việc đánh giá được thực hiện bằng cách đếm số rệp cây sống trên thực vật dưới kính hiển vi. Phần trăm kiểm soát được đo sử dụng công thức hiệu chỉnh Abbott (W. S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), pp.265-267) như sau. % kiểm soát được hiệu chỉnh = 100 * (X - Y) / X trong đó X = Số rệp cây sống trên thực vật kiểm tra dung môi và Y = Số rệp cây sống trên thực vật được xử lý. Các kết quả được chỉ ra trên Bảng được gọi là "Bảng ABC: Các kết quả sinh học" (Xem Phần bảng).

Ví dụ C: Thử nghiệm sinh học trên muỗi gây sốt vàng (*Aedes aegypti*, AEDSAE) ("YFM").

YFM thích sống dựa vào người và thường được tìm thấy nhất trong hoặc gần môi trường sống của con người. YFM là sinh vật lây nhiễm để truyền các bệnh. Nó là muỗi mà có thể truyền được bệnh sốt xuất huyết và bệnh virut sốt vàng. Bệnh sốt vàng là loại bệnh truyền nhiễm muỗi nguy hiểm thứ hai sau sốt rét. Bệnh sốt vàng là bệnh sốt xuất huyết do virut cấp tính và đến 50% người bị ảnh hưởng nặng mà không xử lý sẽ bị chết do bệnh sốt vàng. Có 200,000 trường hợp được dự đoán là bệnh sốt vàng, gây ra 30,000 người chết trên toàn thế giới mỗi năm. Bệnh sốt Dengue là bệnh do virut, gây khó chịu; đôi khi được gọi là "sốt vỡ xương" hoặc "sốt vỡ tim" do những cơn đau nhói mà nó có thể tạo ra. Bệnh sốt Dengue giết khoảng 20,000 người mỗi năm. Do đó, do việc kiểm soát các nhân tố nêu trên của sinh vật gây hại này là quan trọng. Hơn nữa, các hợp chất mà kiểm soát sinh vật gây hại (YFM) này, mà đã được biết đến là sinh vật gây hại qua đường hút, hữu dụng trong việc kiểm soát sinh vật gây hại khác mà làm cho con người và động vật đau đớn.

Các hợp chất nhất định được nêu trong tài liệu này được thử nghiệm đối với YFM sử dụng các cách tiến hành được nêu theo đoạn sau đây. Trong việc báo cáo các kết quả, "Bảng tỷ lệ GPA & YFM" được sử dụng (Xem Phần bảng).

Các đĩa gốc chứa 400 µg hợp chất được hòa tan trong 100 µL dimetyl sulfoxit (DMSO) (đương lượng đối với 4000 ppm dung dịch) được sử dụng. Đĩa gốc của các hợp chất được kết hợp chứa 15 µL trên giếng. Bổ sung vào đĩa này 135 µL hỗn hợp nước/axeton 90:10 vào mỗi giếng. Người máy được lập trình để phân tán 15 µL dung dịch cần hút từ đĩa gốc vào đĩa nông có 96 giếng trống (đĩa "con"). Có 6 bản lặp (các đĩa "con") được tạo ra trên gốc. Đĩa "con" đã tạo ra sau đó bị nhiễm ngay với ấu trùng YFM.

Ngày mà trước khi các đĩa cần được xử lý, trứng muỗi được đặt vào nước Millipore chứa bột gan để nở (4 g. thành 400ml). Sau khi đĩa "con" được tạo ra bằng cách sử dụng người máy, chúng được cho nhiễm với 220 µL của hỗn hợp bột gan/ấu trùng muỗi (ấu trùng khoảng 1 ngày tuổi). Sau khi các đĩa được cho nhiễm với ấu trùng muỗi, nắp chống bay hơi được sử dụng để che đĩa để làm giảm việc bị khô. Các đĩa được giữ ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 ngày trước khi đánh giá. Sau thời gian 3 ngày, mỗi giếng được quan sát và tính điểm dựa vào tỷ lệ chết. Các kết quả được chỉ ra trên Bảng được gọi là "Bảng ABC: Các kết quả sinh học" (Xem Phần bảng).

Muối cộng hợp axit nông dụng, dẫn xuất muối, solvat, dẫn xuất este, chất đa hình, chất đồng vị, và nuclit phóng xạ

Hợp chất có công thức có thể được bào chế thành muối cộng hợp axit nông dụng. Bằng cách ví dụ không giới hạn, chức amin có thể tạo ra muối với clohydric, bromhydric, sulfuric, phosphoric, axetic, benzoic, xitric, malonic, salicylic, malic, fumaric, oxalic, sucxinic, tartaric, lactic, gluconic, ascorbic, maleic, aspartic, benzensulfonic, metansulfonic, etansulfonic, hydroxyl-metansulfonic, và axit hydroxyetansulfonic. Ngoài ra, Bằng cách ví dụ không giới hạn, chức axit có thể tạo ra muối bao gồm các nhóm được dẫn xuất từ kim loại kiềm hoặc kiềm thổ và nhóm được dẫn xuất từ amoniac và amin. Các ví dụ về các cation được ưu tiên bao gồm natri, kali, và magiê.

Hợp chất có công thức (I) có thể được bào chế thành dẫn xuất muối. Bằng cách ví dụ không giới hạn, dẫn xuất muối có thể được điều chế bằng cách tiếp xúc bazơ tự do với lượng đủ của axit mong muốn để tạo ra muối. Bazơ tự do có thể được tái tạo bằng cách xử lý muối có dung dịch bazơ chứa nước loãng thích hợp như natri hydroxit chứa nước loãng, kali carbonat, amoniac, và natri bicarbonat. Như ví dụ, trong một số trường hợp, thuốc diệt sinh vật gây hại, như 2,4-D, được tạo ra tan trong nước tốt hơn bằng cách chuyển hóa nó thành muối dimetylamin.

Hợp chất có công thức (I) có thể được bào chế thành các phức bền với dung môi, sao cho phức duy trì nguyên vẹn sau khi dung môi không được tạo phức bị loại bỏ. Các phức này thường được gọi là "solvat." Tuy nhiên, mong muốn cụ thể để tạo ra hydrat bền với nước là dung môi.

Hợp chất có công thức (I) chứa chức axit có thể được tạo ra thành dẫn xuất este. Dẫn xuất este này sau đó có thể thể được áp dụng theo cùng cách như các hợp chất được bộc lộ trong tài liệu này được áp dụng.

Hợp chất có công thức (I) có thể được tạo ra là dạng tinh thể đa hình khác. Hiện tượng đa hình quan trọng trong sự phát triển sản phẩm nông hóa do sự khác nhau của dạng tinh thể đa hình hoặc các cấu trúc của cùng hợp chất có thể có các tính chất vật lý và đặc tính sinh học rất khác nhau.

Hợp chất có công thức (I) có thể được tạo ra chất đồng vị khác nhau. Đặc biệt quan trọng là các hợp chất có ^{2}H (cũng đã biết là đơteri) hoặc ^{3}H (cũng đã biết là triti) ở vị trí là ^{1}H. Hợp chất có công thức (I) có thể được tạo ra với các nuclit phóng xạ khác nhau. Đặc biệt quan trọng là là các hợp chất có ^{14}C (cũng đã biết là cacbon phóng xạ). Hợp chất có công thức (I) có đơteri, triti, hoặc ^{14}C có thể được sử dụng trong nghiên cứu sinh học cho phép đánh dấu trong quá trình hóa học và sinh lý và nghiên cứu bán rã, cũng như, các nghiên cứu MoA.

Các tổ hợp

Theo một phương án khác theo sáng chế, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng trong tổ hợp (như, theo hỗn hợp thành phần, hoặc việc áp dụng đồng thời hoặc lần lượt) với một hoặc nhiều hoạt chất.

Theo một phương án khác theo sáng chế, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng trong tổ hợp (như, theo hỗn hợp thành phần, hoặc việc dùng đồng thời hoặc lần lượt) với một hoặc nhiều hoạt chất mà mỗi hoạt chất có MoA có nghĩa là giống như, tương tự, nhưng thường là khác với, MoA của các hợp chất có công thức (I).

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng trong tổ hợp (như, theo hỗn hợp thành phần, hoặc việc dùng đồng thời hoặc lần lượt) với một hoặc nhiều hợp chất có các đặc tính diệt ve, diệt tảo, diệt chim, diệt khuẩn, diệt nấm,

diệt cỏ, diệt côn trùng, diệt nhuyễn thể, diệt giun tròn, diệt động vật gặm nhấm, và/hoặc diệt virut.

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng theo tổ hợp (như, trong hỗn hợp thành phần, hoặc việc dùng đồng thời hoặc lần lượt) với một hoặc nhiều hợp chất mà là thuốc diệt sinh vật ăn lá, thuốc đuổi chim, thuốc triệt sản, thuốc diệt cỏ an toàn, thuốc thu hút côn trùng, thuốc đuổi côn trùng, thuốc chống động vật có vú, thuốc gây rối loạn giao phối, thuốc hoạt hóa thực vật, thuốc điều chỉnh sự tăng trưởng thực vật, và/hoặc thuốc có tác dụng hiệp đồng.

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) có thể cũng được sử dụng theo tổ hợp (như, theo hỗn hợp thành phần, hoặc việc dùng đồng thời hoặc lần lượt) với một hoặc nhiều chất diệt sinh vật gây hại sinh học.

Theo một phương án khác, trong các tổ hợp chế phẩm thuốc diệt sinh vật gây hại của hợp chất có công thức (I) và hoạt chất có thể được sử dụng theo sự thay đổi lớn về tỷ lệ khối lượng. Ví dụ, trong hỗn hợp hai thành phần, tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất, các tỷ lệ khối lượng trên Bảng B có thể được sử dụng. Tuy nhiên, thông thường, tỷ lệ khối lượng nhỏ hơn khoảng từ 10:1 đến 1:10 được ưu tiên. Đôi khi cũng được ưu tiên để sử dụng ba, bốn, năm, sáu, bảy, hoặc lớn hơn, hỗn hợp thành phần bao gồm hợp chất có công thức (I) và hai hoặc nhiều hơn hoạt chất bổ sung.

Tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất còn có thể được mô tả là *X*:*Y*; trong đó *X* là các phần theo khối lượng của hợp chất có công thức (I) và *Y* các phần theo khối lượng của hoạt chất. Khoảng số của các phần theo khối lượng đối với *X* là $0 < X \leq 100$ và các phần theo khối lượng đối với *Y* là $0 < Y \leq 100$ và thể hiện bằng đồ thị trên Bảng C. Bằng cách ví dụ không giới hạn, tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất có thể là 20:1.

Các khoảng tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất có thể được nêu là X_1:Y_1 đến X_2:Y_2, trong đó *X* và *Y* được xác định như trên.

Theo một phương án, khoảng tỷ lệ khối lượng có thể nằm trong khoảng từ X_1:Y_1 đến X_2:Y_2, trong đó $X_1 > Y_1$ và $X_2 < Y_2$. Bằng cách ví dụ không giới hạn, khoảng tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất có thể nằm giữa 3:1 và 1:3, bao gồm cả các điểm đầu.

Theo một phương án khác, khoảng tỷ lệ khối lượng có thể nằm trong khoảng từ X_1:Y_1 đến X_2:Y_2, trong đó $X_1 > Y_1$ và $X_2 > Y_2$. Bằng cách ví dụ không giới hạn, khoảng tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất có thể nằm giữa 15:1 và 3:1, bao gồm cả các điểm đầu.

Theo một phương án khác, khoảng tỷ lệ khối lượng có thể nằm trong khoảng từ X_1:Y_1 đến X_2:Y_2, trong đó $X_1 < Y_1$ và $X_2 < Y_2$. Bằng cách ví dụ không giới hạn, khoảng tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức (I) so với hoạt chất có thể nằm giữa 1:3 và 1:20, bao gồm điểm đầu.

Chế phẩm

Thuốc diệt sinh vật gây hại nhiều lần không thích hợp đối với việc dùng ở dạng tinh khiết của nó. Thông thường cần bổ sung các chất khác sao cho thuốc diệt sinh vật gây hại có thể được sử dụng ở nồng độ được yêu cầu và ở dạng thích hợp, cho phép dễ áp dụng, xử lý, vận chuyển, lưu trữ, và hoạt tính thuốc diệt sinh vật gây hại tối đa. Do đó, thuốc diệt sinh vật gây hại được bào chế thành, ví dụ, bả, nhũ tương được cô đặc, bụi, dịch đặc có thể nhũ hóa, chất hun khói, gel, hạt nhỏ, vi nang, xử lý hạt giống, hỗn dịch đặc, hỗn dịch, viên nén, chất lỏng tan trong nước, hạt phân tán trong nước hoặc bột chảy khô, bột ướt, và dung dịch có thể tích cực nhỏ.

Thuốc diệt sinh vật gây hại được áp dụng thường nhất là hỗn dịch chứa nước hoặc nhũ tương chứa nước được điều chế từ các chế phẩm cô đặc của thuốc diệt sinh vật gây hại này. Các chế phẩm có thể hòa tan trong nước, tạo hỗn dịch trong nước, hoặc tạo nhũ tương này hoặc là dạng rắn, thường được biết đến là bột ướt, hạt phân tán trong nước, các chất lỏng thường được biết đến là dịch đặc nhũ hóa, hoặc dạng hỗn dịch chứa nước. Bột ướt, mà có thể được kết lại để tạo ra các hạt phân tán trong nước, bao gồm hỗn hợp thuốc diệt sinh vật gây hại được trộn nhuyễn, chất mang, và chất hoạt động bề mặt. Nồng độ của thuốc diệt sinh vật gây hại thường nằm trong khoảng từ 10% đến 90% theo khối lượng. Chất mang thường được chọn trong số các loại đất sét attapulgit, đất sét montmorillonit, đất diatomit, hoặc các silicat được tinh sạch. Chất hoạt động bề mặt có hiệu quả, bao gồm nằm trong khoảng từ 0,5% đến 10% bột ướt, được tìm thấy trong lignin được sulfonat hoá, naphtalensulfonat cô đặc, naphtalensulfonat, alkylbenzensulfonat, alkyl sulfat, và chất hoạt động bề mặt không ion như các sản phẩm cộng etylen oxit của alkyl phenol.

Các dịch đặc nhũ hóa của thuốc diệt sinh vật gây hại bao gồm nồng độ thông thường là thuốc diệt sinh vật gây hại, như nằm trong khoảng từ 50 đến 500gam trên lit chất lỏng được hòa tan trong chất mang có nghĩa là hoặc là dung môi có thể trộn lẫn với nước hoặc hỗn hợp dung môi hữu cơ không thể trộn với nước và chất nhũ hóa. Dung môi hữu cơ hữu dụng bao gồm các chất thơm, đặc biệt là xylen và phần cất dầu mỏ, đặc biệt là các phần olefin và aphtalen có nhiệt độ sôi cao của dầu như naphta thơm nặng. Các dung môi hữu cơ khác cũng có thể được sử dụng, như dung môi terpen bao gồm các dẫn xuất nhựa đường, keton béo như xyclohexanon, và các rượu phức như 2-etoxyetanol. Các chất nhũ hóa thích hợp dùng cho các dịch đặc nhũ hóa được chọn từ các chất hoạt động bề mặt dạng anion thông thường và không ion.

Hỗn dịch chứa nước bao gồm hỗn dịch của thuốc diệt sinh vật gây hại không hòa tan trong nước được phân tán trong chất mang chứa nước ở nồng độ nằm trong khoảng từ 5% đến 50% theo khối lượng. Hỗn dịch được điều chế bằng cách nghiền nhỏ thuốc diệt sinh vật gây hại và trộn mạnh nó thành chất mang bao gồm nước và chất hoạt động bề mặt. Các thành phần, như muối vô cơ và chất gôm tự nhiên hoặc tổng hợp, cũng được bổ sung để làm tăng mật độ và độ nhớt của chất mang chứa nước. Thường hiệu quả nhất để nghiền và trộn thuốc diệt sinh vật gây hại ở cùng lúc bằng cách điều chế hỗn hợp chứa nước và làm đồng nhất nó trong thiết bị như máy nghiền cát, máy nghiền bi, hoặc thiết bị làm đồng nhất kiểu pít tông. Thuốc diệt sinh vật gây hại ở dạng hỗn dịch có thể tạo vi nang trong polyme dẻo.

Các hệ phân tán dầu (OD) bao gồm thể hỗn dịch của thuốc diệt sinh vật gây hại không tan trong dung môi hữu cơ được phân tán tốt trong hỗn hợp dung môi hữu cơ và các chất nhũ hóa ở nồng độ nằm trong khoảng từ 2% đến 50% theo khối lượng. Một hoặc nhiều thuốc diệt sinh vật gây hại có thể được hòa tan trong dung môi hữu cơ. Dung môi hữu cơ hữu dụng bao gồm các chất thơm, đặc biệt là xylen và phần cất dầu mỏ, đặc biệt là các phần olefin và aphtalen có nhiệt độ sôi cao của dầu như naphta thơm nặng. Các dung môi khác có thể bao gồm dầu thực vật, dầu lấy từ hạt, và các este của dầu thực vật và dầu lấy từ hạt. Các chất nhũ hóa thích hợp dùng cho hệ phân tán dầu được chọn từ chất hoạt động bề mặt có anion thông thường và không ion. Chất cô đặc hoặc chất gel hóa được bổ sung vào chế phẩm của hệ phân tán dầu để cải biến tính lưu biến hoặc chảy của chất lỏng và để ngăn sự tách ra và sự lắng của các hạt hoặc các giọt phân tán.

Thuốc diệt sinh vật gây hại có thể còn được áp dụng làm các chế phẩm dạng hạt mà cụ thể hữu dụng cho việc áp dụng đối với đất. Chế phẩm hạt thường chứa từ 0,5% đến 10% theo khối lượng thuốc diệt sinh vật gây hại, được phân tán trong chất mang mà bao gồm đất sét hoặc chất tương tự. Chế phẩm này thường được điều chế bằng cách hòa tan thuốc diệt sinh vật gây hại trong dung môi thích hợp và áp dụng nó vào chất mang dạng hạt, mà đã được tạo ra trước đối với kích cỡ hạt thích hợp, nằm trong khoảng từ 0,5 mm đến 3 mm. Chế phẩm này còn có thể được bào chế bằng cách tạo ra bột nhão hoặc hỗn hợp bột nhão của chất mang và hợp chất, và sau đó nghiền và làm khô để thu được kích cỡ hạt mong muốn. Dạng khác của các hạt là hạt nhũ hóa với nước (EG). Nó là chế phẩm bao gồm các hạt được áp dụng làm dạng nhũ tương dầu trong nước thông thường của (các) hoạt chất, hoặc là được hòa tan hoặc pha loãng trong dung môi hữu cơ, sau khi làm tan rã và hòa tan trong nước. Các hạt có thể nhũ hóa với nước bao gồm một hoặc nhiều (các) hoạt chất, hoặc là được hòa tan hoặc pha loãng trong dung môi hữu cơ thích hợp có nghĩa là được thấm hút trong lớp polyme hòa tan trong nước hoặc các kiểu khác của chất kết dính tan hoặc không tan.

Bụi chứa thuốc diệt sinh vật gây hại được điều chế bằng cách trộn nhuyễn vào nhau thuốc diệt sinh vật gây hại thành dạng bột có chất mang nông nghiệp ở dạng bụi thích hợp, như đất sét kaolin, đất đá núi lửa, và tương tự. Bụi có thể chứa thích hợp trong khoảng từ 1% đến 10% của thuốc diệt sinh vật gây hại. Bụi có thể được áp dụng ở dạng phủ lên hạt hoặc phủ lên lá bằng máy thổi bụi.

Cụ thể cũng có thể áp dụng thuốc diệt sinh vật gây hại dưới dạng dung dịch trong dung môi hữu cơ thích hợp, thông thường là dầu mỏ, ví dụ như dầu phun, mà được sử dụng rộng rãi trong hóa học nông nghiệp.

Thuốc diệt sinh vật gây hại còn có thể được áp dụng ở dạng chế phẩm sol khí. Trong chế phẩm này, thuốc diệt sinh vật gây hại được hòa tan hoặc được phân tán trong chất mang, mà là hỗn hợp nhiên liệu đẩy tạo áp lực. Chế phẩm sol khí được bao gói trong vật chứa mà từ đó hỗn hợp được phân tán qua van phun.

Bả thuốc diệt sinh vật gây hại được tạo ra khi thuốc diệt sinh vật gây hại được trộn với thức ăn hoặc chất hóa học thu hút côn trùng hoặc cả hai. Khi sinh vật gây hại ăn bả, chúng cũng tiêu thụ cả thuốc diệt sinh vật gây hại. Bả có thể được lấy ở dạng hạt, gel, bột

có tính chảy, chất lỏng, hoặc chất rắn. Bả có thể được sử dụng trong nơi ở của sinh vật gây hại.

Thuốc xông là thuốc diệt sinh vật gây hại mà có áp suất hơi tương đối cao và do đó có thể có làm khí theo nồng độ thích hợp để giết sinh vật gây hại trông đất hoặc không gian kín. Độc tính của thuốc phun tỷ lệ với nồng độ của nó và thời gian tiếp xúc. Chúng khác biệt ở chỗ có khả năng khuếch tán và hoạt động tốt bằng cách thẩm thấu vào hệ hô hấp của sinh vật gây hại hoặc được hấp thụ qua lớp biểu bì của sinh vật gây hại. Thuốc xông được áp dụng để kiểm soát các sinh vật gây hại cho sản phẩm lưu trữ dưới tấm chống khí, trong phòng kín hoặc tòa nhà, hoặc trong các khoang đặc biệt.

Thuốc diệt sinh vật gây hại có thể được tạo vi nang bằng cách tạo hỗn dịch các hạt hoặc giọt thuốc diệt sinh vật gây hại trong polyme dẻo có dạng khác nhau. Bằng cách thay đổi, tính chất hóa học của polyme hoặc bằng cách thay đổi các yếu tố trong quy trình chế biến, các vi nang có thể được tạo thành với các kích cỡ khác nhau, độ hòa tan, độ dày của thành, và độ thấm. Các yếu tố này quyết định tốc độ mà hoạt chất nằm bên trong được giải phóng, mà lần lượt, ảnh hưởng đến năng suất dư, tốc độ hoạt động và mùi của sản phẩm. Vi nang có thể được bảo chế làm hỗn dịch đặc hoặc các hạt phân tán trong nước.

Dịch cô đặc tan trong dầu được tạo ra bằng cách hòa tan thuốc diệt sinh vật gây hại trong dung môi mà sẽ giữ thuốc diệt sinh vật gây hại trong dung dịch. Dung dịch dầu của thuốc diệt sinh vật gây hại thường được tiêu diệt hoặc giết sinh vật gây hại nhanh hơn các chế phẩm khác do dung môi của chúng có hoạt tính diệt sinh vật gây hại và việc hòa tan của vỏ sáp có thành phần làm tăng tốc độ hấp thụ của thuốc diệt sinh vật gây hại. Ưu điểm khác của dung dịch dầu bao gồm tính ổn định bảo quản tốt hơn, sự thẩm thấu của các khe hở tốt hơn, và sự bám dính vào bề mặt trơn tốt hơn.

Phương án khác là nhũ tương dầu trong nước, trong đó nhũ tương bao gồm hạt cầu dầu mà mỗi hạt dầu được tạo ra lớp phủ tinh thể lỏng dạng phiến và phân tán trong pha nước, trong đó mỗi hạt cầu dầu chứa ít nhất một hợp chất mà có hoạt tính nông nghiệp, và phủ riêng bằng lớp một phiến hoặc nhiều phiến bao gồm: (1) ít nhất một chất hoạt động bề mặt ưa béo không ion, (2) ít nhất một chất hoạt động bề mặt ưa nước không ion, và (3) ít nhất một chất hoạt động bề mặt ion, trong đó các hạt cầu có kích thước cụ thể trung bình nhỏ hơn 800 nanomet.

Các thành phần chế phẩm khác

Thông thường, khi các hợp chất được nêu trong (I) được sử dụng trong chế phẩm, chế phẩm này còn có thể chứa các thành phần khác. Các thành phần này bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, (đây là một danh sách không đầy đủ và không loại trừ lẫn nhau) các chất thấm ướt, chất phân bố, chất kết dính, chất thẩm thấu, chất đệm, các chất chelat hoá, các chất làm giảm trôi, các chất tương thích, các chất chống bọt, các chất tẩy rửa, và chất nhũ hoá. Một số thành phần được mô tả dưới đây

Chất thấm ướt là chất mà được bổ sung vào chất lỏng làm tăng làm tăng cường độ phân bố hoặc thẩm thấu của chất lỏng bằng cách giảm sức căng mặt phân cách giữa chất lỏng và bề mặt mà nó đang phân bố. Chất thấm ướt được sử dụng dùng cho hai chức năng chính ở các chế phẩm hóa nông: trong quá trình xử lý và sản xuất để làm tăng tốc độ thấm ướt của bột trong nước để tạo ra dịch đặc cho dịch đặc dạng lỏng tan hoặc dịch đặc dạng hỗn dịch; và trong quá trình trộn sản phẩm với nước trong bể phun để giảm thời gian thấm ướt của bột thấm ướt và cải thiện độ thẩm thấu của nước vào trong hạt phân tán trong nước. Các ví dụ về chất thấm ướt được sử dụng trong bột có thể thấm ướt, hỗn dịch đặc, và các chế phẩm hạt phân tán trong nước là: natri lauryl sulfat; natri dioctyl sulfosuxcinat; alkyl phenol etoxylat; và rượu etoxylat béo.

Chất phân tán là chất mà hấp phụ trên bề mặt của hạt, giúp đảm bảo trạng thái phân tán của các hạt và ngăn chúng kết tụ lại. Chất phân tán được bổ sung vào các chế phẩm nông hóa học để tạo điều kiện thuận lợi cho sự phân tán và hỗn dịch trong khi sản xuất, và đảm bảo sự phân tán lại thành nước trong bể phun mới. Chúng được sử dụng rộng rãi trong bột thấm ướt, hỗn dịch đặc, và các hạt phân tán trong nước. Chất hoạt động bề mặt mà được sử dụng làm chất phân tán có khả năng hấp phụ mạnh trên bề mặt hạt và tạo ra lớp chắn không gian hoặc có điện tích đối với sự kết tụ lại của các hạt. Các chất hoạt động bề mặt thường được sử dụng nhất là anion, không ion, hoặc hỗn hợp hai dạng. Đối với chế phẩm bột thấm ướt, chất phân tán thông thường nhất là natri lignosulfonat. Đối với hỗn dịch đặc, sự hấp phụ và ổn định rất tốt đạt được bằng cách sử dụng các chất đa điện phân, như dịch đặc natri-naphthalen-sulfonat-formaldehyt. Các este tristyrylphenol etoxylat phosphat cũng được sử dụng. Các chất không ion như dịch đặc alkylaryletylen oxit và chất đồng trùng hợp khối EO-PO đôi khi được kết hợp với anion làm chất phân tán dùng cho hỗn dịch đặc. Trong những năm gần đây, các kiểu mới về các

chất hoạt động bề mặt polyme có khối lượng hợp chất cao đã được phát triển làm chất phân tán. Các chất này có 'mạch chính' kỵ nước rất dài và số lượng lớn chuỗi etylen oxit tạo ra 'răng' của chất hoạt động bề mặt dạng 'lược'. Polyme có khối lượng hợp chất cao này có thể tạo ra tính bền trong thời gian dài rất tốt đối với các hỗn dịch đặc do các mạch chính kỵ nước có nhiều điểm neo trên các bề mặt hạt. Các ví dụ về chất phân tán được sử dụng trong các chế phẩm nông hoá là: natri lignosulfonat; dịch đặc natri naphtalen sulfonat formaldehyt; este tristyrylphenol-etoxylat-phosphat; rượu etoxylat béo; alkyl etoxylat; chất đồng trùng hợp khối EO-PO; và chất đồng trùng hợp ghép.

Chất nhũ hóa là chất mà làm ổn định thể hỗn dịch của giọt của pha lỏng này trong pha lỏng khác. Không có chất nhũ hóa, hai chất lỏng tách thành hai pha chất lỏng không trộn lẫn được. Hỗn hợp nhũ hóa thường được sử dụng nhất chứa alkylphenol hoặc rượu béo có mười hai hoặc nhiều hợp chất etylen oxit và muối canxi hòa tan trong dầu của axit dodecylbenzensulfonic. Khoảng trị số cân bằng ưa nước-ưa béo ("HLB-hydrophile-lipophile balance") nằm trong khoảng từ 8 đến 18 thường tạo ra thể nhũ tương ổn định tốt. Thể nhũ tương đôi khi có thể được cải thiện bằng việc bổ sung lượng nhỏ chất hoạt động bề mặt đồng trùng hợp khối EO-PO.

Chất hòa tan là chất hoạt động bề mặt mà sẽ tạo ra vi hạt trong nước ở nồng độ trên nồng độ vi hạt giới hạn. Vi hạt sau đó có thể hòa tan hoặc làm tan vật liệu không tan trong nước trong phần vi hạt kỵ nước. Loại chất hoạt động bề mặt thường được sử dụng cho việc hòa tan là chất không ion, sorbitan monooleat, sorbitan monooleat etoxylat, và este metyl oleat.

Chất hoạt động bề mặt đôi khi được sử dụng riêng hoặc là với các chất phụ gia khác như khoáng chất hoặc dầu thực vật làm chất bổ trợ cho hỗn hợp xịt phun để cải thiện hiệu suất sinh học của thuốc diệt sinh vật gây hại trên mục tiêu. Loại chất hoạt động bề mặt được sử dụng để tăng tính sinh học thường phụ thuộc vào bản chất và cách hoạt động của thuốc diệt sinh vật gây hại. Tuy nhiên, chúng thường là chất không ion như: alkyl etoxylat; rượu etoxylat béo mạch thẳng; và amin etoxylat béo.

Chất mang hoặc chất pha loãng ở chế phẩm nông nghiệp là vật liệu được bổ sung vào thuốc diệt sinh vật gây hại để tạo ra sản phẩm có độ bền theo yêu cầu. Chất mang thường là vật liệu có khả năng hấp thụ cao, trong khi chất pha loãng thường là vật thường

là vật liệu khả năng hấp thụ thấp. Chất mang và chất pha loãng được sử dụng trong chế phẩm là bụi, bột ướt, hạt, và hạt phân tán trong nước.

Dung môi hữu cơ được sử dụng chủ yếu trong chế phẩm là dịch đặc nhũ hóa, nhũ tương dầu trong nước, hỗn dịch, các thể phân tán dầu, và chế phẩm có thể tích siêu nhỏ, và các chế phẩm hạt đến mức độ nhỏ hơn. Đôi khi hỗn hợp dung môi được sử dụng. Các nhóm chính thứ nhất của dung môi là dầu parafin béo như dầu hỏa hoặc parafin được tinh chế. Nhóm chính thứ hai (và thường nhất) bao gồm dung môi thơm như xylen và các phần cất có khối lượng hợp chất cao hơn dung môi thơm C9 và C10. Các hydrocarbon được clo hóa hữu dụng làm đồng dung môi để ngăn sự kết tinh của thuốc diệt sinh vật gây hại khi chế phẩm được nhũ hóa trong nước. Đôi khi rượu được sử dụng làm đồng dung môi để làm tăng khả năng của dung môi. Các dung môi khác có thể bao gồm dầu thực vật, dầu lấy từ hạt, và các este của dầu thực vật và dầu lấy từ hạt.

Chất làm đặc hoặc chất gel hóa được chủ yếu sử dụng ở chế phẩm của hỗn dịch đặc, chất phân tán dầu, nhũ tương và chất nhũ hóa để để sửa đổi tính lưu biến hoặc tính chảy của chất lỏng và ngăn sự tách ra của các hạt hoặc các giọt phân tán. Các chất làm đặc, gel, và chống làm lắng thường có hai loại, cụ thể là các hạt không hòa tan trong nước và polyme tan trong nước. Có thể tạo ra hỗn dịch đặc và chế phẩm phân tán trong dầu sử dụng đất sét và silic. Các ví dụ về các loại vật liệu này, bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, montmorillonit, bentonit, magiê nhôm silic, và attapulgit. Các polysaccharit hòa tan trong nước trong các dịch đặc dạng hỗn dịch gốc nước đã được sử dụng làm chất làm đặc gel hoá trong nhiều năm. Các loại polysaccharit hầu hết thường được sử dụng là các chiết xuất tự nhiên của hạt và rong biển hoặc là các chất dẫn xuất tổng hợp của xenluloza. Ví dụ về các loại vật liệu bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, gôm guar; gôm từ đậu châu chấu; carrageenam; alginat; metyl xenluloza; natri carboxymetyl xenluloza (SCMC); và hydroxyetyl xenluloza (HEC). Các loại chất chống lắng khác dựa trên tinh bột biến tính, polyacrylat, polyvinyl rượu, và polyetylen oxit. Chất chống lắng tốt khác là gôm xantan.

Vi sinh vật có thể làm hỏng sản phẩm được bào chế. Do đó, các chất bảo quản được sử dụng để loại bỏ hoặc làm giảm ảnh hưởng của chúng. Ví dụ về các chất này bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở: axit propionic và muối natri của chúng; axit sorbic và

muối natri hoặc kali của chúng; axit benzoic và muối natri của chúng; muối natri của *axit p*-hydroxybenzoic; metyl *p*-hydroxybenzoat; và 1,2-benzisothiazolin-3-on (BIT).

Sự có mặt của chất hoạt động bề mặt thường làm cho các chế phẩm gốc nước nổi bọt trong các thao tác trộn trong quy trình sản xuất và áp dụng qua bể phun. Để giảm xu hướng tạo bọt, chất chống tạo bọt thường được thêm vào trong quy trình sản xuất hoặc trước khi đổ vào chai. Thông thường, có hai loại chất chống tạo bọt, cụ thể là silicon và phi silicon. Silicon thường là nhũ tương chứa nước của dimetyl polysiloxan, trong khi các chất chống xốp phi silicon là các loại dầu không tan trong nước, như octanol và nonanol, hoặc silic. Trong cả hai trường hợp, chức năng của chất chống tạo bọt là thay thế chất hoạt động bề mặt từ mặt phân cách không khí-nước.

Các chất "Màu xanh lục " (*ví dụ*., chất bổ trợ, chất hoạt động bề mặt, dung môi) có thể làm giảm tác động tổng thể môi trường của các chế phẩm bảo vệ thực vật. Các chất màu xanh lục có khả năng phân hủy sinh học và thường có được dẫn xuất từ nguồn tự nhiên và/hoặc bền, *ví dụ* nguồn thực vật và động vật. Các ví dụ cụ thể là: dầu thực vật, dầu lấy từ hạt, và các este của chúng, đồng thời là các alkyl polyglucozit được alkoxylat hóa.

Việc áp dụng

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng vào vị trí bất kỳ. Các vị trí cụ thể để áp dụng các hợp chất này bao gồm vị trí mà ở đó có linh lăng, hạnh nhân, táo, lúa mạch, đậu, cây cải dầu, ngô, bông, họ cải, hoa, các loại cỏ làm thức ăn cho gia súc (cỏ lùng, cỏ ngô, cỏ roi, cỏ hạt màu xanh Kentucky, và cỏ ba lá), trái cây, rau diếp, yến mạch, cây hạt lấy dầu, cam, đậu phộng, lê, ớt, khoai tây, lúa, lúa miến, đậu nành, dâu tây, mía, củ cải đường, hoa hướng dương, thuốc lá, cà chua, lúa mì (ví dụ: Lúa mì cứng mùa đông màu đỏ, lúa mì mềm mùa đông màu đỏ, lúa mì trắng mùa đông, lúa mì cứng mùa xuân màu đỏ, và lúa mì cứng mùa xuân), và các loại cây trồng có giá trị đang phát triển hoặc hạt giống của chúng sẽ được trồng.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được áp dụng ở nơi có thực vật, như cây trồng, đang phát triển và ở nơi có mức độ thấp (thậm chí không có sự hiện diện thực sự) của sinh vật gây hại mà có thể ảnh hưởng thương mại đến các thực vậy này. Áp dụng các hợp chất này trong vị trí này là có lợi cho thực vật được phát triển ở vị trí này. Lợi ích

này, có thể bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở: giúp thực vật phát triển hệ rễ tốt hơn; giúp sự chống chịu tốt hơn các điều kiện phát triển khắc nghiệt; cải thiện sức sống của thực vật; cải thiện năng suất của thực vật *(ví dụ* làm tăng sinh khối và/hoặc làm tăng hàm lượng thành phần có giá trị); cải thiện sức sống của thực vật (*ví dụ*. cải thiện sự phát triển thực vật và/hoặc lá màu xanh hơn); cải thiện chất lượng thực vật (*ví dụ* cải thiện hàm lượng hoặc thành phần trong các thành phầ nnhất định); và cải thiện khả năng chống chịu đối với áp lực vô sinh và/hoặc hữu sinh của thực vật.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng đối với amoni sulfat khi việc này có thể tạo ra các lợi ích bổ sung.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng trên, trong, hoặc xung quanh thực vật biến đổi di truyền để thể hiện các đặc tính chuyên biệt, như *Vi khuẩn gram dương* (ví dụ Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1 / Cry35Ab1), các chất độc diệt côn trùng khác, hoặc thực vật này biểu biện tính dung nạp của thuốc diệt cỏ, hoặc có các gen ngoại lai "xếp chồng lên nhau" biểu hiện các chất độc diệt côn trùng, dung nạp thuốc diệt cỏ, tăng cường dinh dưỡng, hoặc bất kỳ các tính trạng có lợi khác.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng đối với các phần lá và/hoặc quả của thực vật để kiểm soát sinh vật gây hại. Hoặc là các hợp chất này sẽ tiếp xúc trực tiếp với sinh vật gây hại, hoặc sinh vật gây hại dùng các hợp chất này khi ăn thực vật hoặc trong khi chiết tách nhựa hoặc các chất dinh dưỡng khác từ thực vật.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được áp dụng đối với đất, và khi được áp dụng theo cách này, sinh vật gây hại ăn rễ và thân có thể được kiểm soát. Rễ có thể hấp thụ các hợp chất này nhờ đó lấy nó vào các phần lá của thực vật để kiểm soát các sinh vật gây hại hút nhựa và nhai đất.

Sự di chuyển có hệ thống của thuốc diệt sinh vật gây hại trong thực vật có thể được dùng để kiểm soát sinh vật gây hại trên một phần của thực vật bằng cách áp dụng (ví dụ bằng cách phun vào vị trí) hợp chất có công thức (I) đối với phần khác của thực vật. Ví dụ, việc kiểm soát côn trùng ăn lá có thể đạt được bằng việc tưới nhỏ giọt hoặc tưới rãnh, bằng cách xử lý đất ví dụ với đất trước hoặc sau khi trồng, hoặc bằng cách xử lý hạt giống của thực vật trước khi trồng.

Hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng với bả. Thông thường, với bả, bả được đặt trên đất mà, ví dụ, mối có thể đến tiếp xúc với, và/hoặc được gắn với, bả. Bả cũng có thể được phủ lên bề mặt của tòa nhà, (bề mặt ngang, dọc hoặc xiên) mà, ví dụ, kiến, mối, gián, và ruồi, có thể đến tiếp xúc với, và/hoặc được gắn với, bả.

Hợp chất có công thức (I) có thể được gói bên trong, hoặc được đặt lên trên bề mặt của viên nang. Kích cỡ của viên nang có thể nằm trong khoảng kích cỡ nanomet (đường kính nằm trong khoảng từ 100-900 nanomet) đến kích cỡ micromet (đường kính nằm trong khoảng từ 10-900 micro).

Hợp chất có công thức (I) có thể được phủ lên trứng của sinh vật gây hại. Do khả năng duy nhất của trứng của một số sinh vật gây hại chống lại thuốc diệt sinh vật gây hại nhất định, nên việc dùng được lặp lại của các hợp chất này có thể mong muốn kiểm soát ấu trùng mới xuất hiện.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng làm việc xử lý hạt. Việc xử lý hạt được áp dụng đối với tất cả các loại hạt, bao gồm các loại mà từ đó thực vật biến đổi di truyền thể hiện các đặc điểm ưu việt sẽ nảy mầm. Các ví dụ điển hình bao gồm các thực vật này mà biểu hiện các protein gây độc đối với sinh vật gây hại không xương sống, như *Vi khuẩn gram dương* hoặc các chất độc diệt côn trùng khác, các thực vật mà biểu hiện khả năng dung nạp chất diệt cỏ, như hạt đậu nành "Roundup Ready", hoặc các thực vật có gen ngoại lại "được đưa vào" biểu hiện các chất độc diệt côn trùng, dung nạp chất diệt cỏ, tăng cường chất dinh dưỡng, chịu hạn, hoặc các đặc điểm có lợi khác bất kỳ. Hơn nữa, việc xử lý hạt này bằng các hợp chất có công thức (I) có thể còn đạt được khả năng là thực vật chống chịu các điều kiện phát triển khắc nghiệt tốt hơn. Điều này dẫn đến một cây khỏe mạnh, khỏe mạnh hơn, mà có thể dẫn đến năng suất cao hơn vào thời điểm thu hoạch. Thông thường, từ 1gam hợp chất này đến 500gam trên 100,000 hạt được mong đợi là tạo ra các lợi ích tốt, lượng từ 10gam đến 100gam trên 100,000 hạt được mong đợi là tạo ra lợi ích tốt hơn, và lượng từ 25gam đến 75gam trên 100,000 được mong đợi là tạo ra lợi ích tốt hơn.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng với một hoặc nhiều trong việc cải tạo đất.

Hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để kiểm soát nội ký sinh và ngoại ký sinh trong ngành thú y hoặc trong lĩnh vực giữ gìn động vật không phải con người. Các hợp chất này có thể được áp dụng bằng việc dùng qua đường miệng ở dạng, ví dụ, viên nén, viên nang, đồ uống, hạt, bằng việc dùng qua da ở dạng, ví dụ, ngâm, phun, đổ lên, vạch lên trên, và bụi, và bằng việc dùng qua đường tiêm ở dạng, ví dụ, tiêm.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng thuận lợi trong việc bảo vệ vật nuôi, ví dụ gia súc, gà, ngan, dê, lợn, cừu, và gà tây. Chúng cũng có thể được sử dụng thuận lợi trong các thú nuôi như, ngựa, chó, và mèo. Sinh vật gây hại cụ thể để kiểm soát là ruồi, bọ chét, và ve mà làm khó chịu đối với động vật này. Các chế phẩm thích hợp được dùng qua đường miệng đối với động vật với nước uống hoặc thức ăn. Các chế phẩm và liều dùng mà thích hợp phụ thuộc vào các loài.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để kiểm soát giun ký sinh, đặc biệt là đường ruột, trong động vật được liệt kê trên.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được dùng theo phương pháp điều trị đối với việc chăm sóc sức khỏe con người. Các phương pháp này bao gồm, nhưng không bị giới hạn đối với, việc dùng qua đường miệng ở dạng, ví dụ, viên nén, viên nang, đồ uống, hạt, và bằng việc dùng qua da.

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng vào sinh vật ngoại lai gây hại. Sinh vật gây hại trên thế giới đã di trú đến môi trường mới (đối với sinh vật gây hại này) và do đó trở thành loài ngoại lai mới trong môi trường mới này. Các hợp chất này cũng có thể được sử dụng trên các loài ngoại lai mới để kiểm soát chúng trong môi trường mới này.

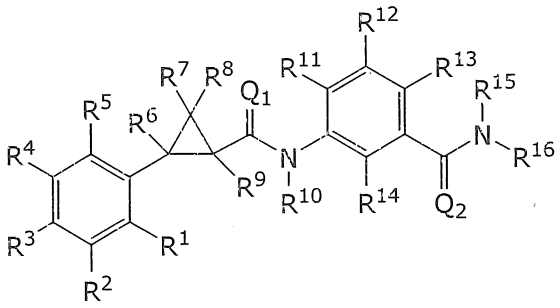
Trước khi thuốc diệt sinh vật gây hại có thể được sử dụng hoặc bán theo thương mại, thuốc diệt sinh vật gây hại này trải qua quy trình đánh giá dài bởi cơ quan chính phủ khác nhau (địa phương, khu vực, tiểu bang, quốc gia, và quốc tế). Các yêu cầu về dữ liệu phong phú được quy định bởi các cơ quan quản lý và phải được xử lý thông qua việc tạo và phát dữ liệu bởi người đăng ký sản phẩm hoặc bởi bên thứ ba thay mặt cho người đăng ký sản phẩm, thường sử dụng máy tính có kết nối với World Wide Web. Các cơ quan chính phủ sau đó xem xét lại các dữ liệu đó và nếu quyết định là an toàn được ký kết, thì cung cấp cho người sử dụng tiềm năng hoặc người bán có chứng nhận đăng ký sản phẩm.

Sau đó, ở nơi mà đăng ký sản phẩm được cấp bằng và hỗ trợ, người sử dụng hoặc người bán này có thể sử dụng hoặc bán thuốc diệt sinh vật gây hại này.

Hợp chất theo (I) có thể được thử nghiệm để xác định ảnh hưởng của nó đối với sinh vật gây hại. Hơn nữa, cách hoạt động của các nghiên cứu có thể được thực hiện để xác định nếu hợp chất đã nêu có cách hoạt động khác so với thuốc diệt sinh vật gây hại khác. Sau đó, dữ liệu được thu được này có thể được phổ biến, như qua internet, đến bên thứ ba.

Do đó, khi xem xét vấn đề nêu trên, và các bảng trong Phần bảng, các phương án (D) bổ sung sau đây, không đầy đủ, được đề xuất.

1D. Hợp chất có công thức sau



(I)

trong đó:

(A) R^1 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, $S(O)_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, $S(O)_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(B) R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, $S(O)_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, $S(O)_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(C) R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(D) R^4 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(E) R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(F) R^6 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl;

(G) R^7 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, và I;

(H) R^8 được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, và I;

(I) R^9 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl;

(J) R^{10} được chọn từ nhóm bao gồm H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl(C_1-C4)alkoxy, C(=O)(C_1-C_4)alkyl, và (C_1-C_4)alkoxyC(=O)(C_1-C_4)alkyl;

(K) R^{11} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(L) R^{12} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(M) R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(N) R^{14} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$$NH_2$, và ($C_1$-$C_4$)haloalkyl-S(O)$_2$$NH_2$;

(O) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl(C_1-C4)alkoxy, C(=O)(C_1-C_4)alkyl, và (C_1-C_4)alkoxyC(=O)(C_1-C_4)alkyl;

(P) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkylphenyl, (C_2-C_8)alkenyl, (C_2-C_8)alkynyl, (C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)alkyl, O-phenyl, O-(C_2-C_8)alkenyl, O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, O-(C_1-C_8)alkylphenyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-C(=O) nH-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-NHC(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-(C_1-C_8)haloalkyl, và (C_1-C_8)alkyl-S(O)$_2$-NH_2,

trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN,

OH, NH_2, NO_2, $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkoxy, $(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $N((C_1$-$C_8)alkyl)_2$, $C(O)O(C_1$-$C_8)$alkyl, benzothioenyl, 2,3-dihydro-1*H*-imidazolonyl, furanyl, pyrazolyl, pyridinyl, thiazolyl, và triazolyl;

(Q) R^{15} và R^{16} có thể tùy ý cùng tạo ra liên kết hydrocarbyl no hoặc không no có từ 2 đến 5 cạnh, mà có thể chứa một hoặc nhiều nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, lưu huỳnh, và oxy,

trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN, NH_2, và NO_2;

(R) mỗi Q^1 và Q^2 được chọn độc lập từ nhóm bao gồm O và S; và

N-oxit, muối cộng hợp axit nông dụng, dẫn xuất muối, solvat, dẫn xuất este, dạng tinh thể đa hình, chất đồng vị, chất đồng phân lập thể được hòa tan, và chất hỗ biến, của hợp chất có công thức (I).

2D. Hợp chất theo phương án 1D, trong đó carboxamido, và phenyl, mà được liên kết với xyclopropan, là theo cấu trúc *R,R*.

3D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên (để làm rõ 1D và 2D) trong đó R^1 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl.

4D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, và CF_3.

5D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, và CF_3,.

6D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^4 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl và CF_3.

7D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl.

8D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^6 là H.

9D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^7 là C hoặc Br.

10D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên R^8 là Cl hoặc Br.

11D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^9 là H.

12D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{10} là H.

13D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{11} là H.

14D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{12} là H.

15D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và $(C_1$-$C_4)$haloalkyl.

16D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, và CF_3.

17D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{14} là H.

18D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và $(C_1$-$C_4)$alkyl.

19D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và CH_3.

20D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkylphenyl, $(C_2$-$C_8)$alkenyl, $(C_2$-$C_8)$alkynyl, $(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S(O)-$(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-S$(O)_2$-$(C_1$-$C_8)$alkyl, O-phenyl, O-$(C_2$-$C_8)$alkenyl, O-$(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, O-$(C_1$-$C_8)$alkylphenyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$alkyl$(C_3$-$C_8)$xycloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-O-$(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $(C_1$-$C_8)$alkyl-C(=O) nH-$(C_1$-$C_8)$haloalkyl, và $(C_1$-$C_8)$alkyl-NHC(O)-$(C_1$-$C_8)$alkyl, trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể

được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, I, CN, $(C_1$-$C_8)$alkyl, $(C_1$-$C_8)$alkoxy, $(C_1$-$C_8)$haloalkyl, $N((C_1$-$C_8)alkyl)_2$, và pyridinyl.

21D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_2$, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH(CH_3)_2$, CH_2xyclopropyl, CH_2CH_2xyclopropyl, CH_2xyclobutyl, CH_2phenyl, CH_2CH_2phenyl, $CH_2C{=}CH$, $CH_2C{=}CH$, CH_2CF_3, CH_2CHF_2, $CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2F$, $CH_2CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2S(O)CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $C(CH_3)_2CH_2S(O)_2CH_3$, Ophenyl, $OCH_2CH{=}CH_2$, OCH_2xyclopropyl, OCH_2phenyl, $CH_2CH_2OCH_2$xyclopropyl, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CF_3$, $CH_2C(=O)$ $nHCH_2CF_3$, và $CH_2CH_2NHC(=O)CH_3$, trong đó mỗi CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, xyclopropyl, xyclobutyl, và phenyl, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, $C(CH_3)_3$, CF_3, OCH_3, OCH_2CH_3, $N(CH_3)_2$, và pyridinyl.

22D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó R^{15} and R^{16} đều là liên kết hydrocarbyl no có 4 cạnh,trong đó liên kết hydrocarbyl đã nêu được thế bằng một hoặc nhiều F.

23D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó hợp chất này là đồng phân lập thể được hòa tan.

24D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó Q^1 là O.

25D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó Q^2 là O.

26D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó hợp chất đã nêu được chọn từ các hợp chất trên Bảng 2 và Bảng P1.

27D. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó hợp chất đã nêu được chọn từ các hợp chất từ F1 đến F75, F78, F79, F84 đến F88, F91 đến F100, F102 đến F109, F111 đến F135, PF1 đến PF7, và PF10 đến PF16.

28D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên đề xuất hợp chất (để làm rõ D1 đến D27 sau đây được gọi là "các phương án hợp chất") còn bao gồm chất mang.

29D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất.

30D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất được chọn từ thuốc diệt ve, thuốc diệt tảo, thuốc diệt sinh vật ăn lá, thuốc diệt chim, thuốc diệt vi khuẩn, thuốc đuổi chim, thuốc triệt sản, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ an toàn, thuốc diệt cỏ, thuốc thu hút côn trùng, thuốc đuổi côn trùng, thuốc diệt côn trùng, thuốc chống động vật có vú, thuốc gây rối loạn giao phối, thuốc diệt ốc sên thuốc diệt giun tròn, thuốc hoạt hóa thực vật, thuốc điều chỉnh sự tăng trưởng thực vật, thuốc diệt động vật gặm nhấm, thuốc có tác dụng hiệp đồng, và thuốc diệt virut.

31D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất được chọn từ AIGA.

32D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa AI-1.

33D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa AI-2.

34D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa Lotilaner.

35D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa Hợp chất được chọn từ BảngA.

36D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất được chọn từ AIGA-2.

37D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa thuốc diệt sinh vật gây hại sinh học.

38D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ Chất ức chế Axetylcolinsteraza (AChE).

39D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất đối kháng kênh clorua có cổng GABA.

40D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất điều hòa kênh natri.

41D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất chủ vận trên thụ thể nicotinic axetylcolin (nAChR).

42D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất hoạt hóa ở vị trí khác trên thụ thể nicotinic axetylcolin (nAChR).

43D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất hoạt hóa kênh clorua.

44D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất tương tự hoocmon trẻ.

45D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế không đặc hiệu khác nhau (đa vị trí).

46D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất điều hòa cơ quan dây âm.

47D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức sự sinh trưởng của mạt.

48D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất phá vỡ vi khuẩn của màng ruột giữa của côn trùng.

49D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ chất ức chế ATP syntaza trong ty thể.

50D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ Chất không ghép đôi của sự phospharyl hóa oxi hóa qua việc phá vỡ của gradien proton.

51D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất phong bế thụ thể axetylcolin nicotin (nAChR).

52D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, kiểu 0.

53D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, kiểu 1.

54D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từchất phá vỡ quy trình lột xác của côn trùng hai cánh.

55D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất chủ vận của thụ thể ecdyson.

56D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất chủ vận của thụ thể Octopamin.

57D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế vận chuyển electron phức III của ty thể.

58D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế vận chuyển electron phức I của ty thể.

59D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất phong bế natri phụ thuộc điện áp.

60D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ Inhibitors of axetyl CoA carboxylase.

61D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế vận chuyển electron phức IV của ty thể.

62D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất ức chế vận chuyển electron phức II của ty thể.

63D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ các chất điều hòa thụ thể Ryanodin.

64D. Chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất từ Nhóm UN.

65D. Quy trình kiểm soát sinh vật gây hại này là quy trình bao gồm việc áp dụng vào vị trí, lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại của hợp chất theo một trong các phương án hợp chất bất kỳ.

66D. Quy trình kiểm soát sinh vật gây hại này là quy trình bao gồm việc áp dụng vào vị trí, lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại của chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 28D đến 64D.

67D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm kiến, rệp cây, rệp giường, bọ cánh cứng, bọ dài đuôi, sâu bướm, gián, dế, sâu tai, bọ chét, ruồi, châu chấu, giòi, bọ rầy xanh, rận, châu chấu, ấu trùng ruồi, mạt, giun tròn, rầy, rệp lá, ong cắn lá, rệp cây, bọ bạc, sên đất, ốc sên, nhện, bọ đuôi bật, bọ xít, rết tơ (Symphylan) (lớp rết tơ), mối, bọ trĩ, ve, ong bắp cày, ruồi trắng, và bọ bổ củi.

68D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này là sinh vật gây hại hút nhựa cây.

69D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm rệp cây, bọ rầy xanh, nhậy, rệp cây, bọ trĩ, rệp lá, sâu ăn bột, bọ xít, và ruồi trắng.

70D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm các bộ chấy rận và bộ cánh nửa.

71D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm *Aulacasp là* spp., *Aphrophora* spp., *Aph là* spp., *Bemisia* spp., *Coccus* spp., *Euschistus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nezara* spp., và *Rhopalosiphum* spp.

72D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này là sinh vật gây hại loại nhai nghiền.

73D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm sâu bướm, bọ cánh cứng, châu chấu, và châu chấu.

74D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm cánh cứng (Coleoptera) và cánh vẩy (Lepidoptera).

75D. Quy trình theo phương án bất kỳ trong số các phương án 65D hoặc 66D, trong đó sinh vật gây hại này được chọn từ nhóm bao gồm *Anthonomus* spp., *Cerotoma* spp., *Chaetocnema* spp., *Colasp là* spp., *xyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Hypera* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp.

Các đề mục nhỏ trong tài liệu này chỉ thuận tiên và không phải được sử dụng để giải thích phần bất kỳ của chúng.

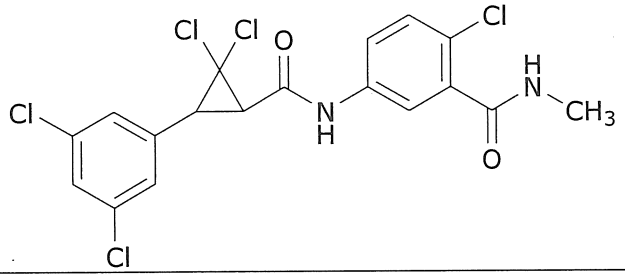
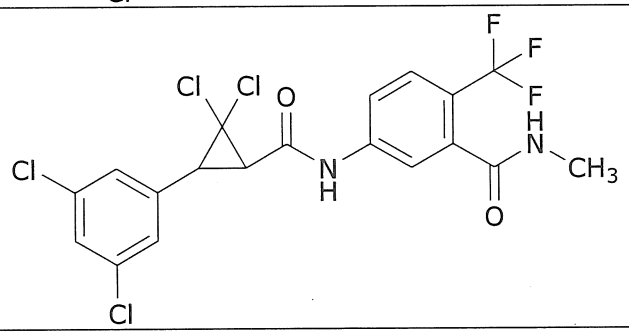
Bảng B

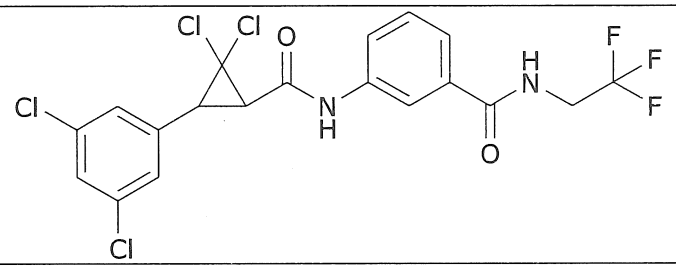
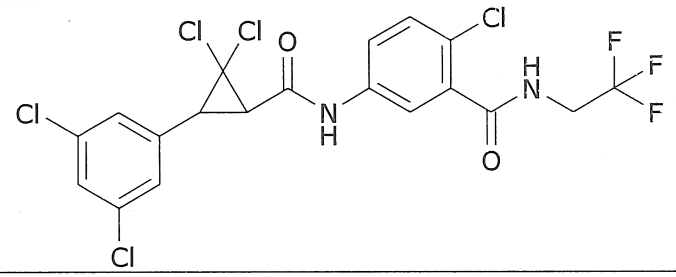
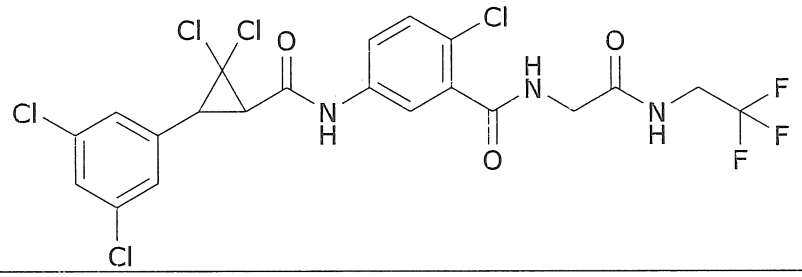
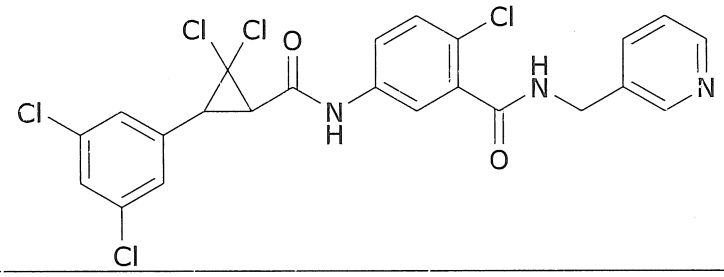
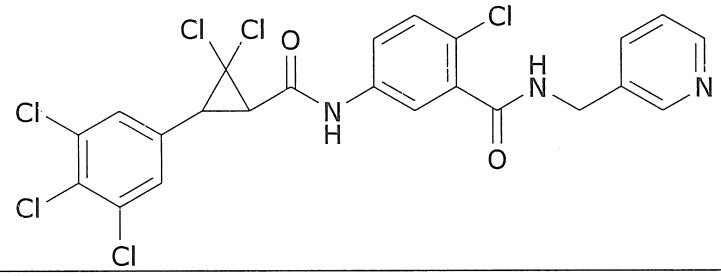
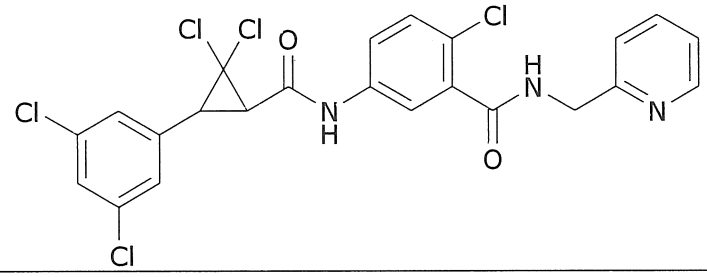
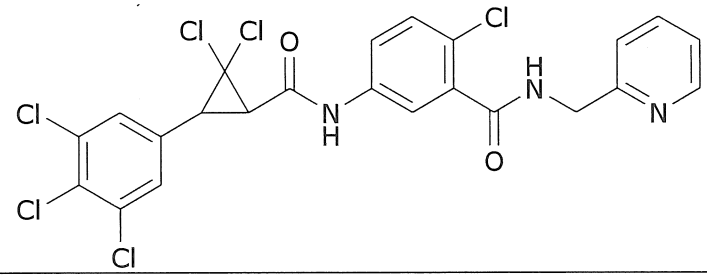
Tỷ lệ khối lượng Hợp chất có công thức (I) : hoạt chất
100:1 đến 1:100
50:1 đến 1:50
20:1 đến 1:20
10:1 đến 1:10
5:1 đến 1:5
3:1 đến 1:3
2:1 đến 1:2
1:1

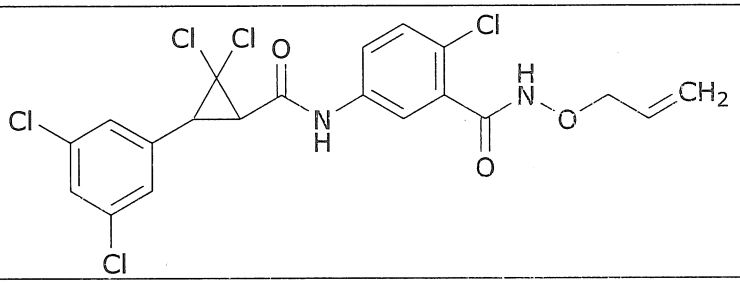
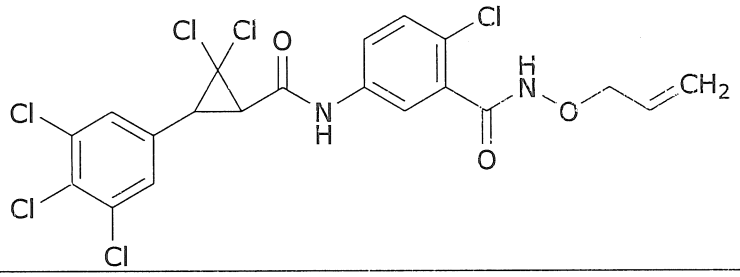
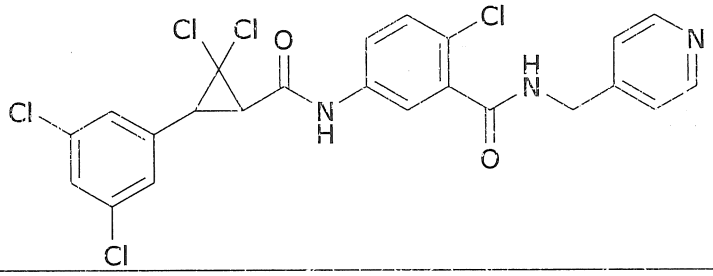
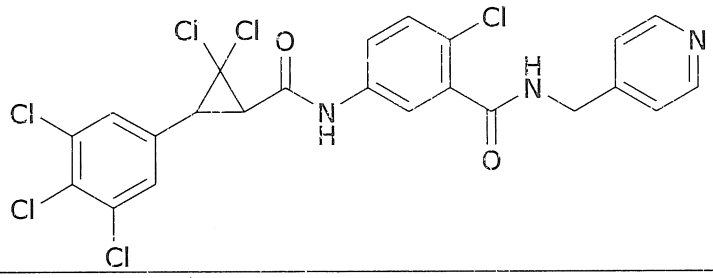
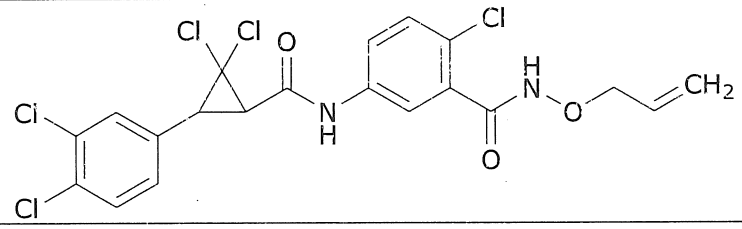
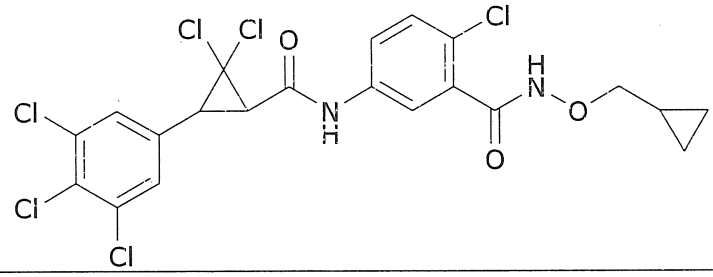
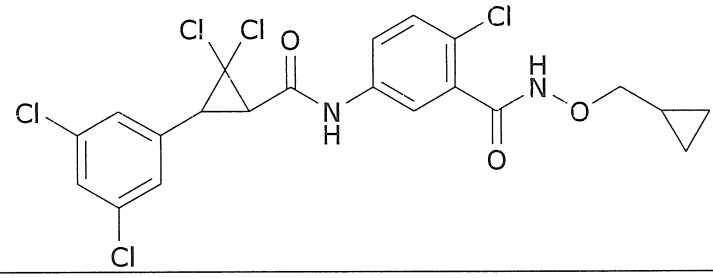
Bảng C

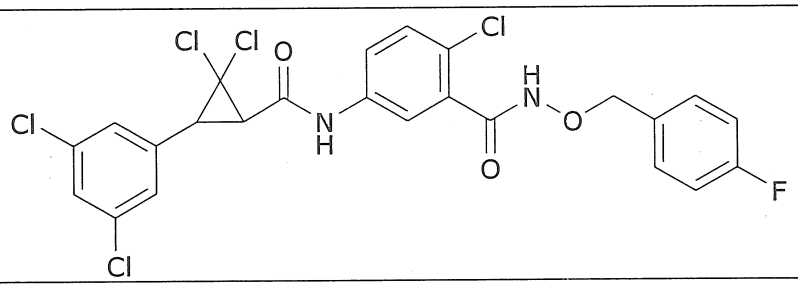
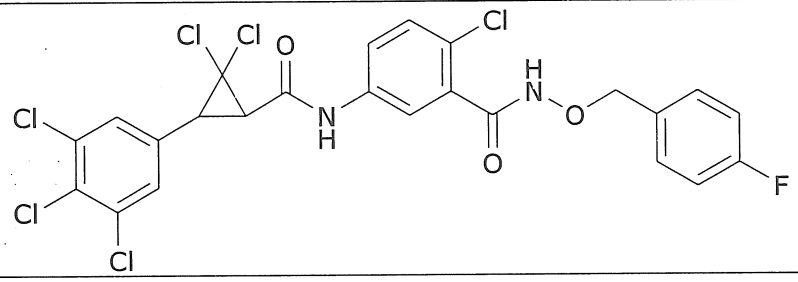
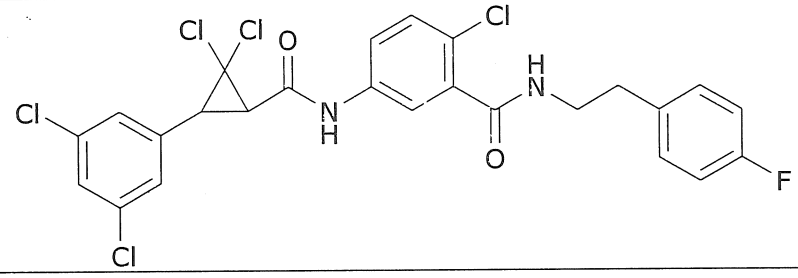
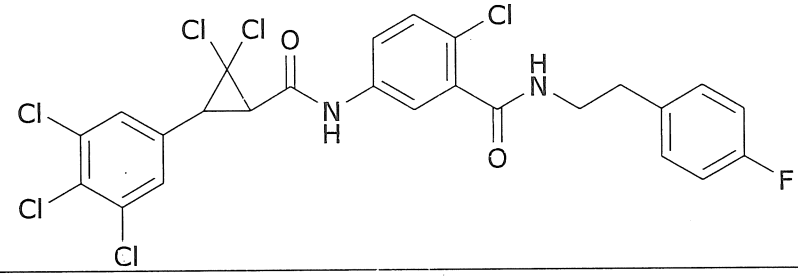
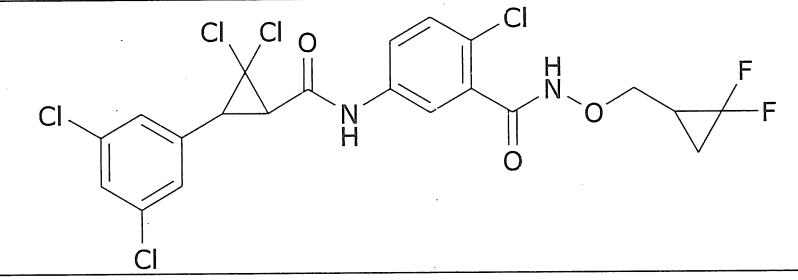
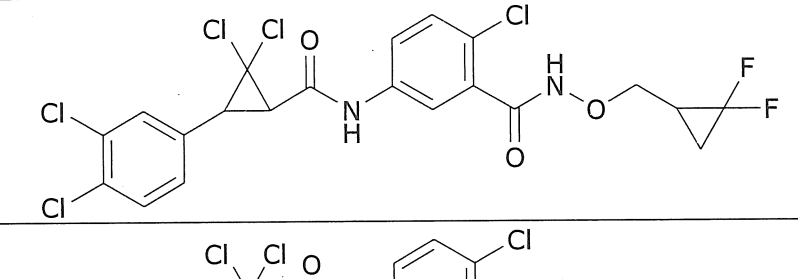
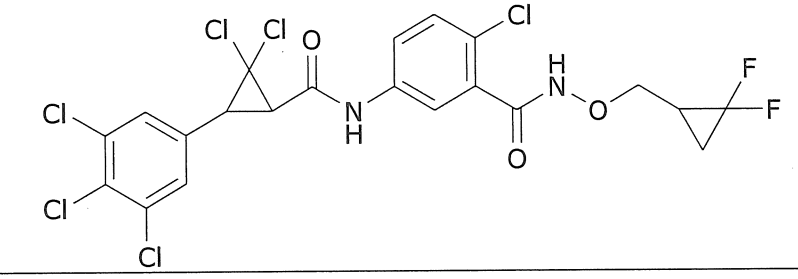
Hoạt chất (Y) Phần theo khối lượng										
	100	*X,Y*		*X,Y*			*X,Y*			
	50	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*			*X,Y*	*X,Y*		
	20	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*		*X,Y*	
	15	*X,Y*	*X,Y*					*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
	10	*X,Y*		*X,Y*						
	5	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*				*X,Y*		
	3	*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
	2	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*		*X,Y*	
	1	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
		1	2	3	5	10	15	20	50	100
		Hợp chất có công thức (I) *(X) Phần theo khối lượng*								

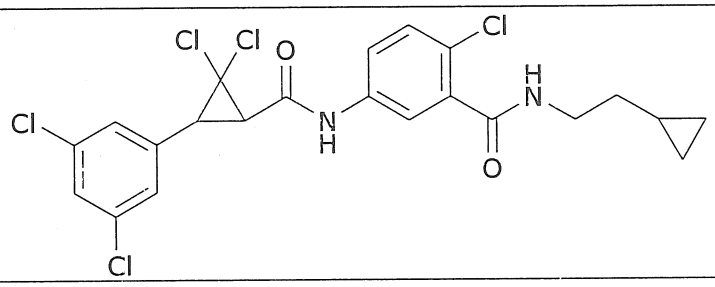
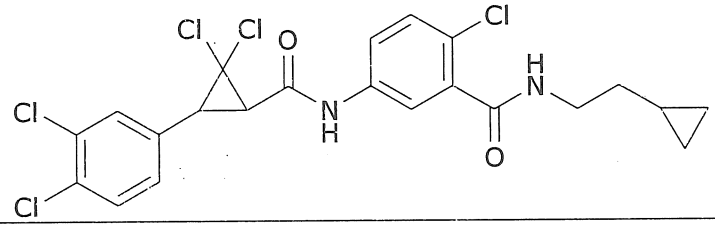
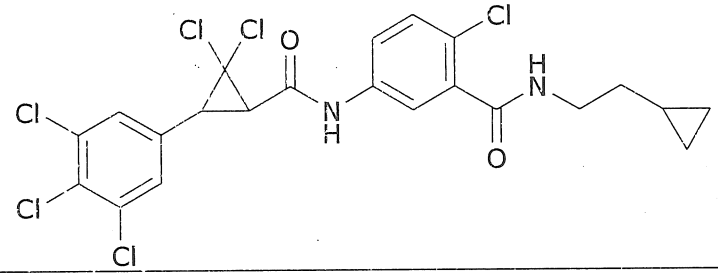
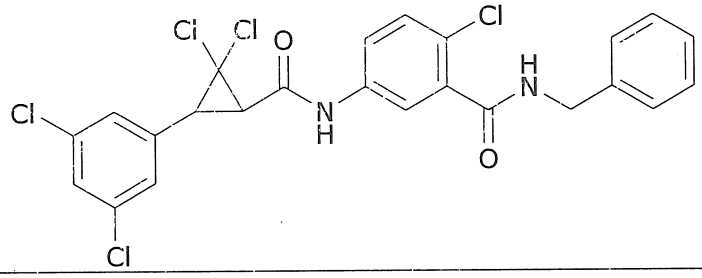
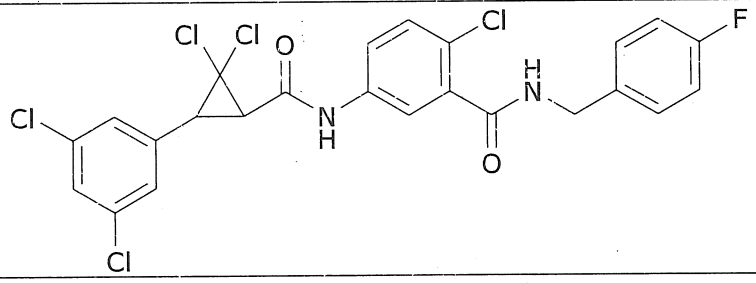
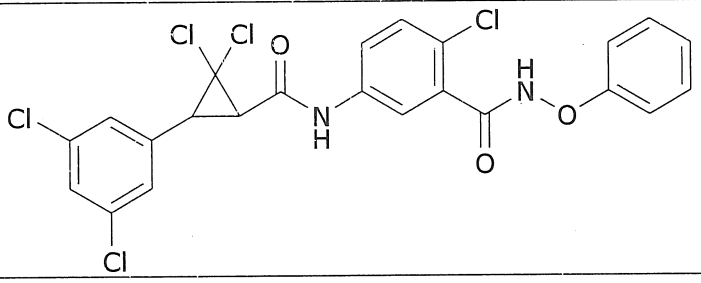
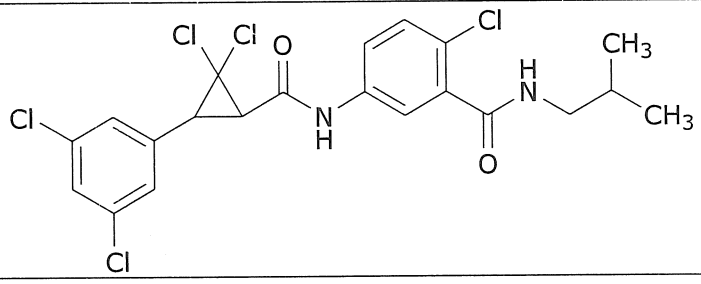
Bảng 2. Cấu tạo và phương pháp điều chế dùng cho các hợp chất chuỗi F và PF

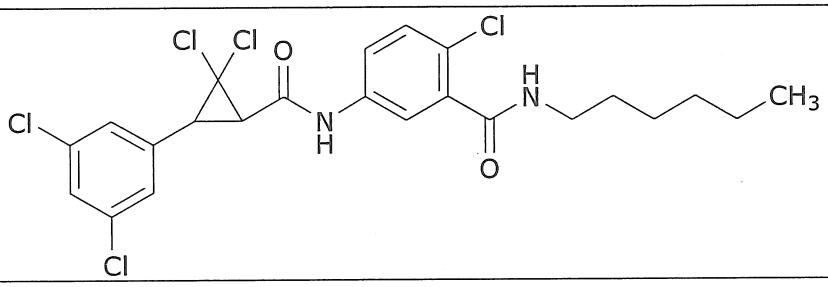
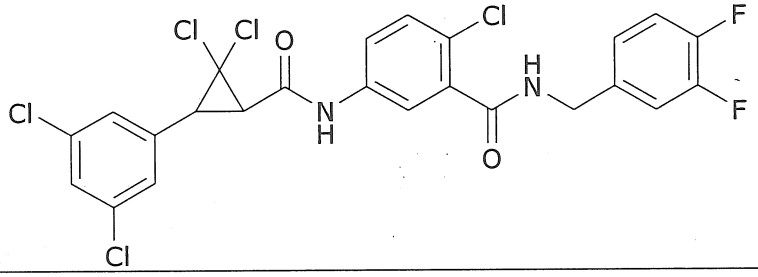
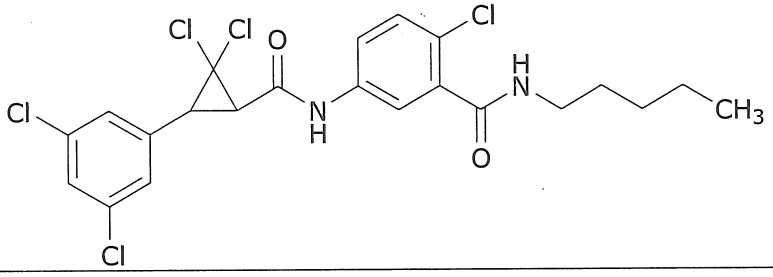
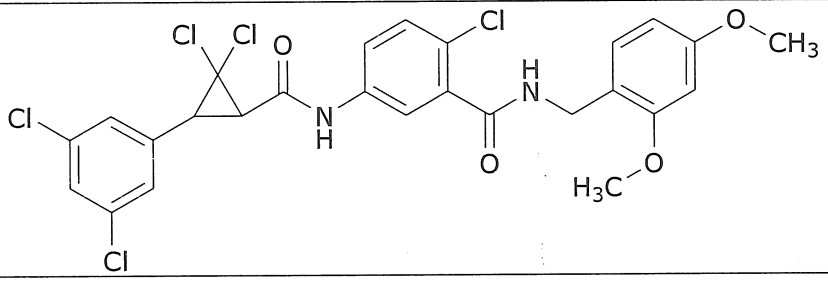
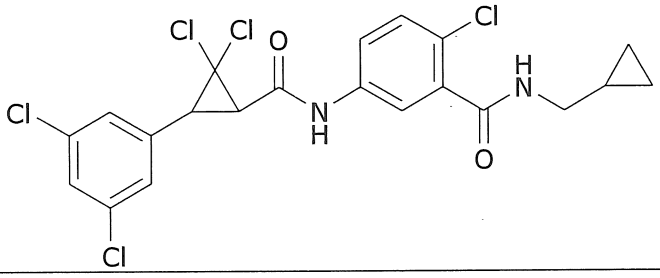
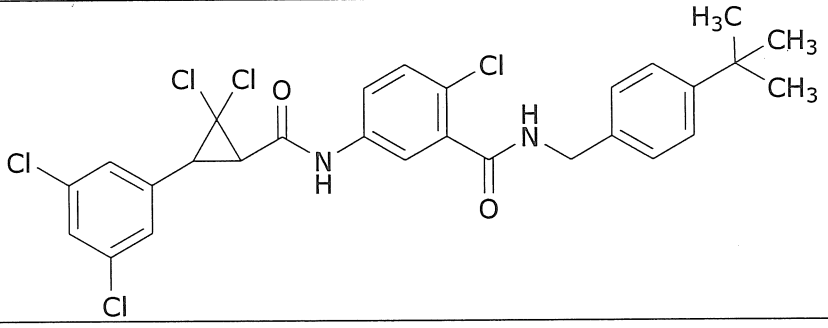
Số	Cấu trúc	Điều chế
F1		13
F2		13

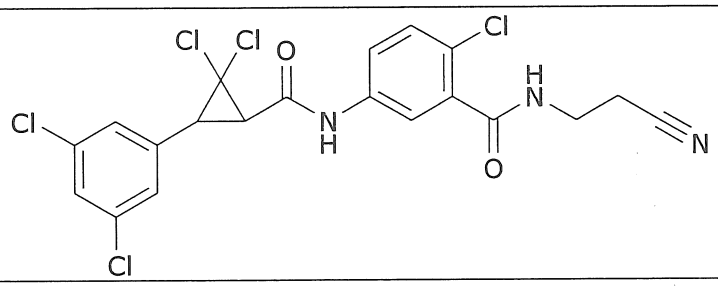
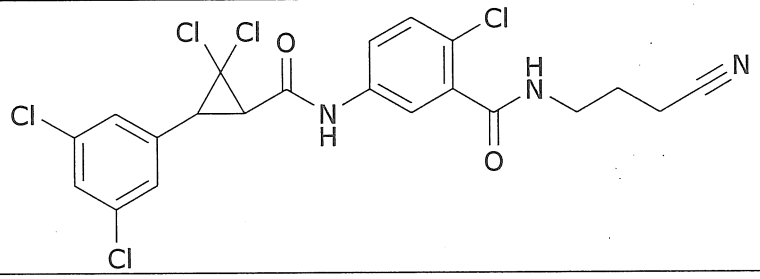
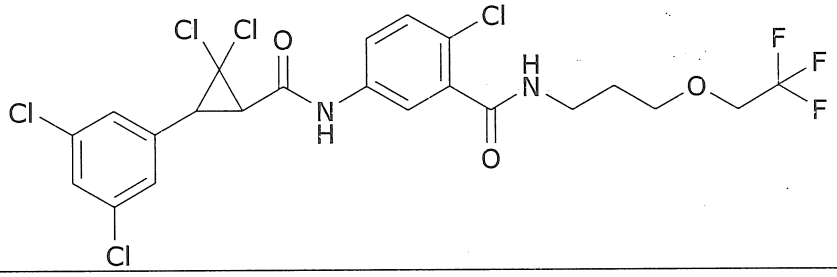
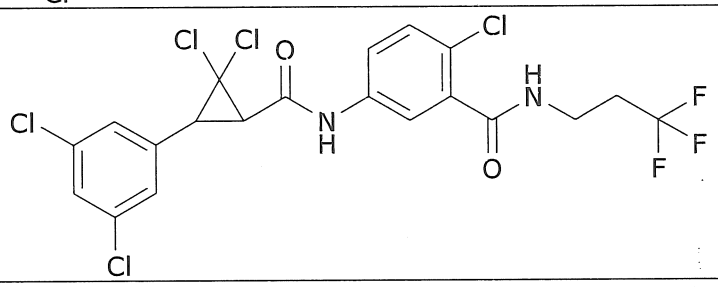
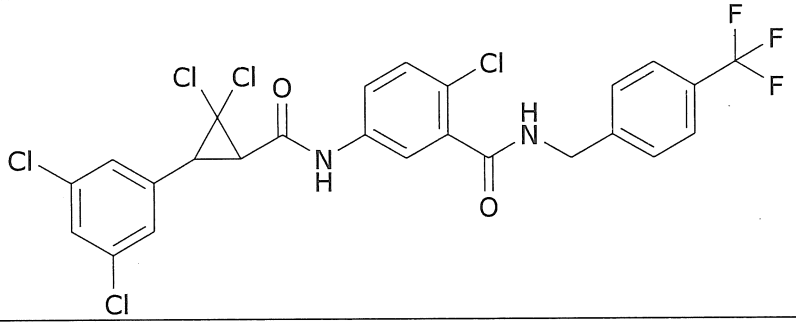
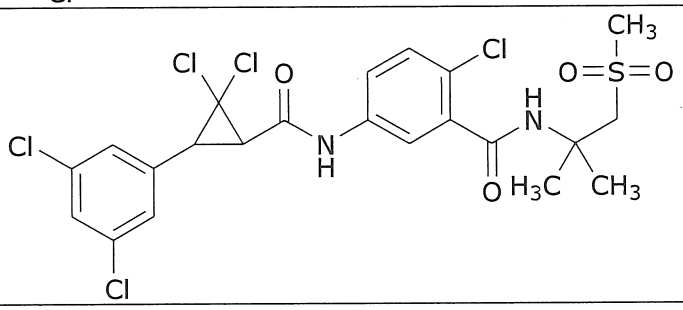
F3		13
F4		13
F5		13
F6		13
F7		13
F8		13
F9		13

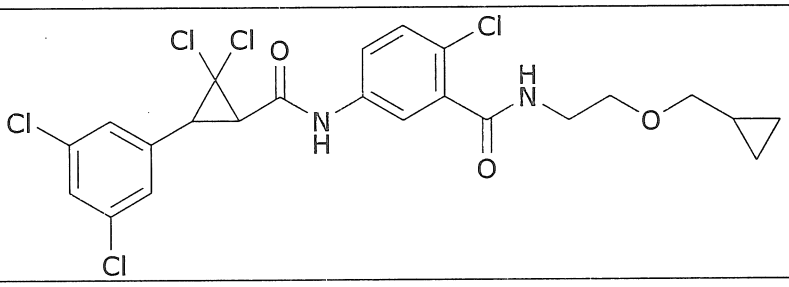
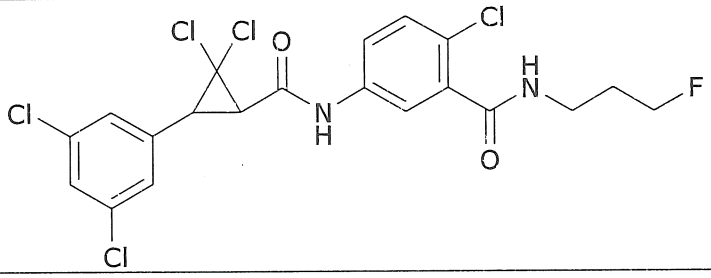
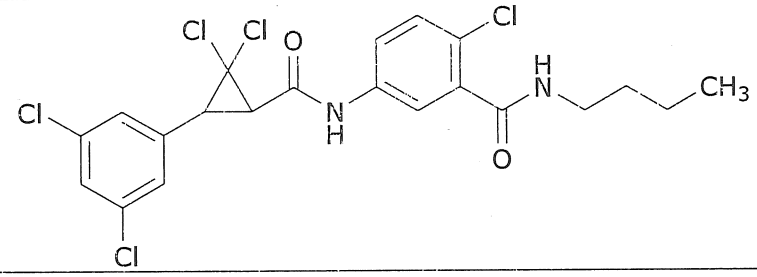
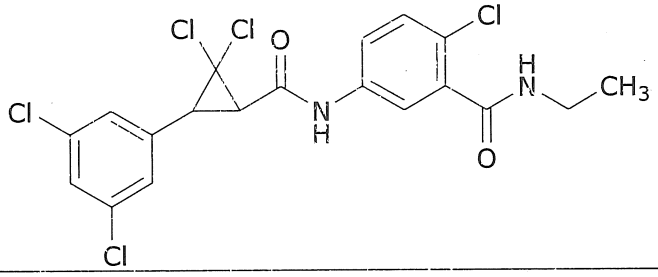
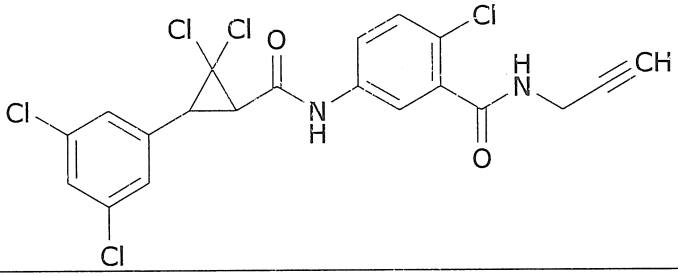
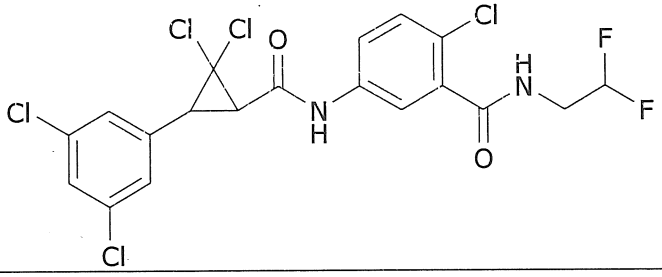
F10		13
F11		13
F12		13
F13		13
F14		13
F15		13
F16		13

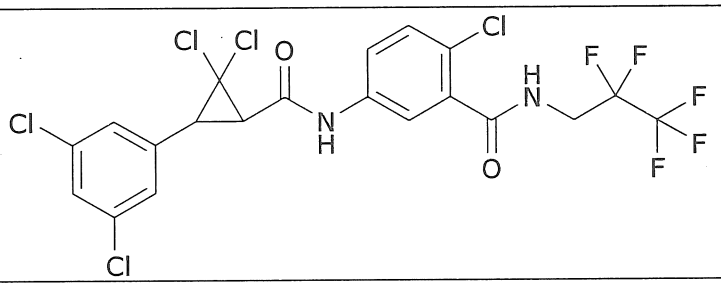
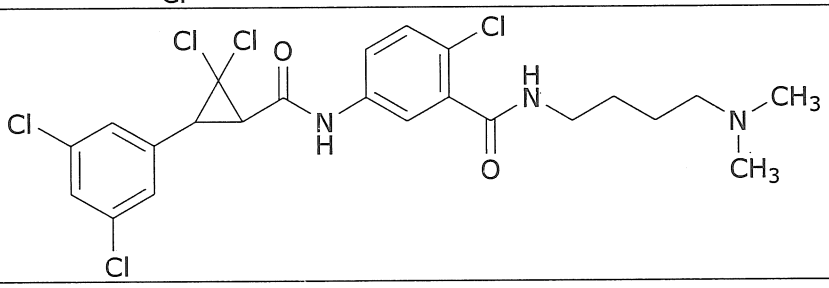
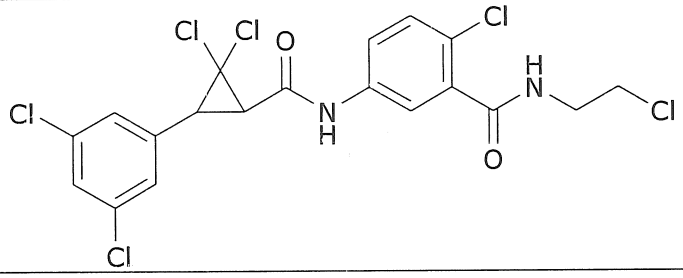
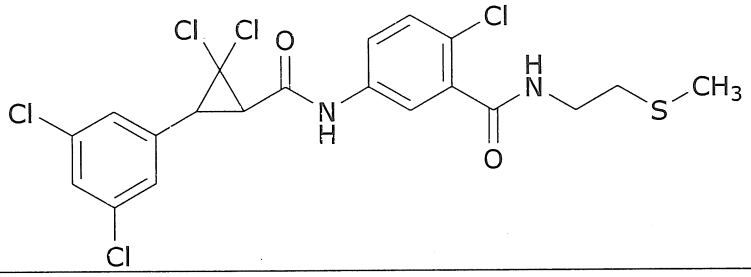
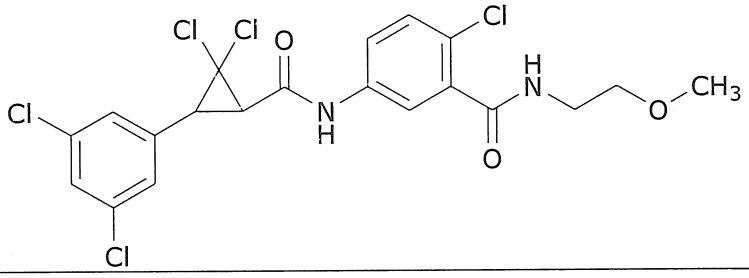
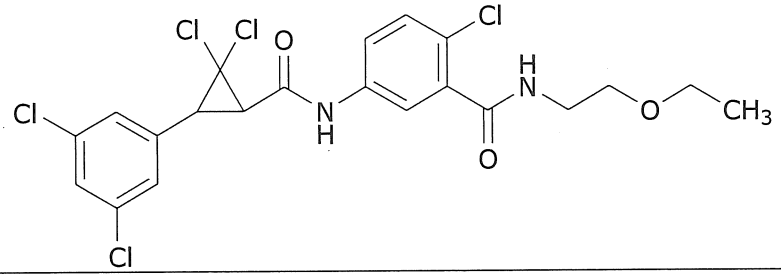
F17		13
F18		13
F19		13
F20		13
F21		13
F22		13
F23		13

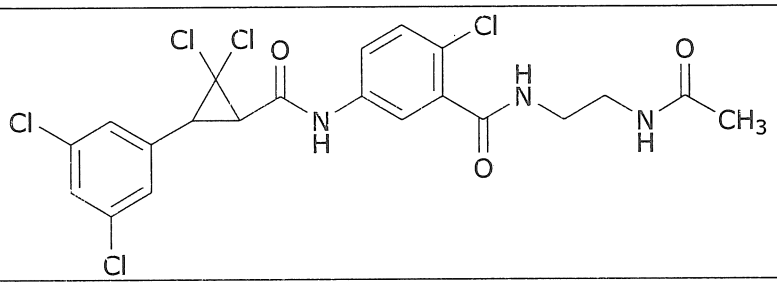
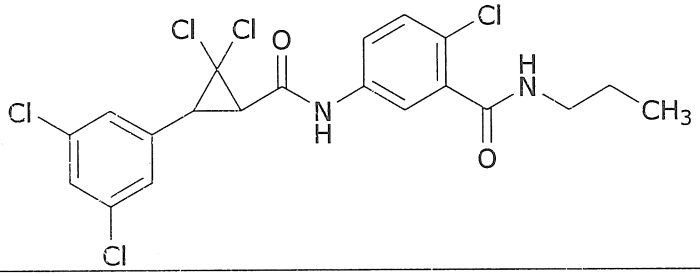
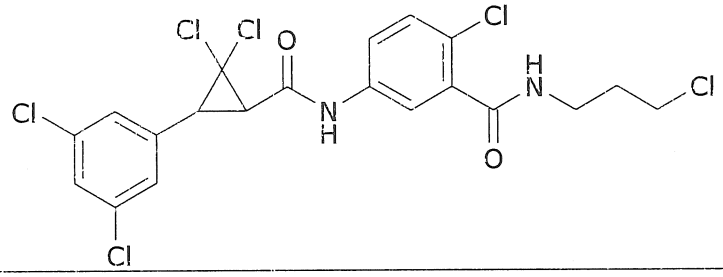
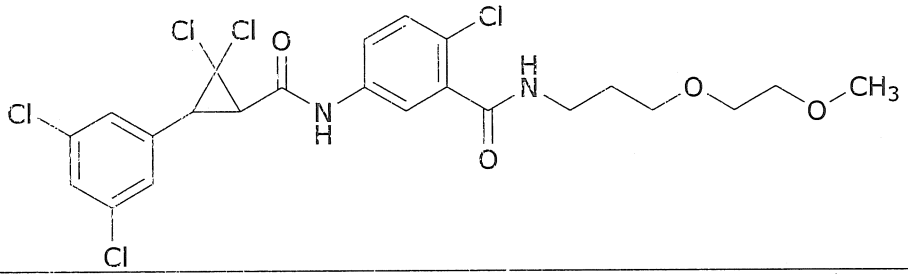
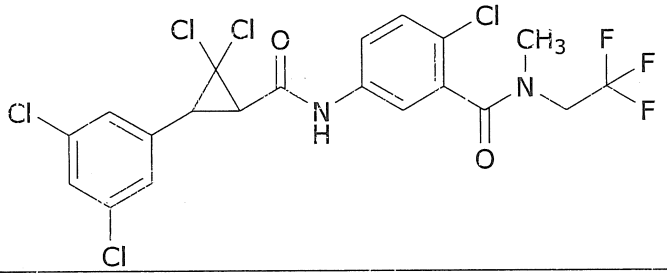
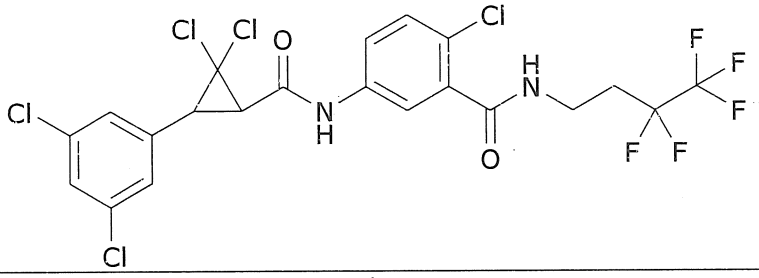
F24		13
F25		13
F26		13
F27		14
F28		14
F29		15
F30		16

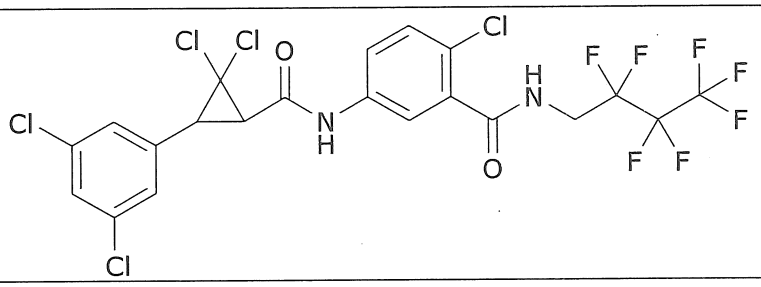
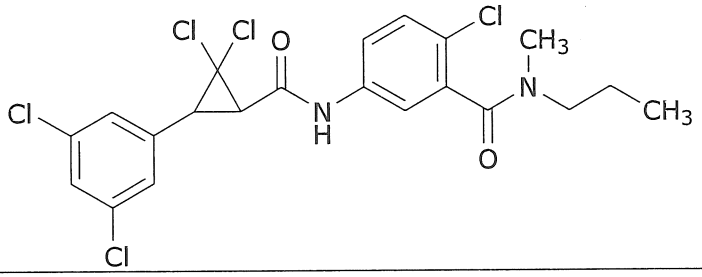
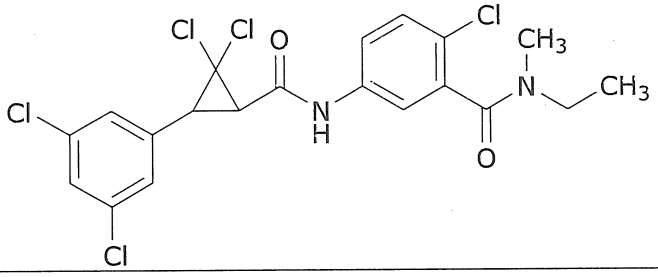
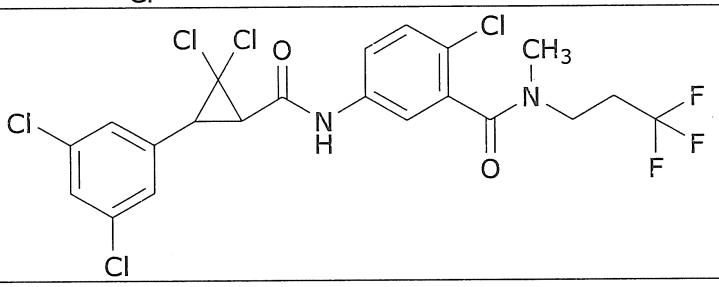
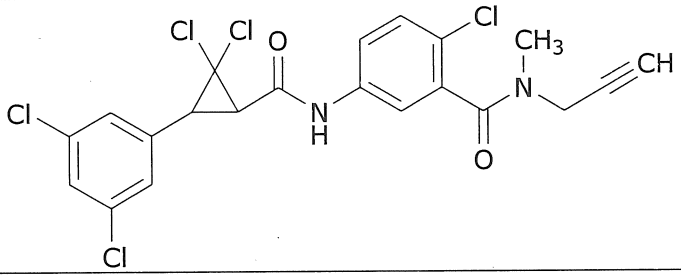
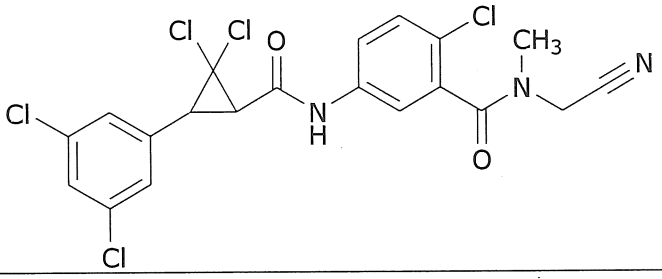
F31		16
F32		16
F33		16
F34		16
F35		16
F36		16

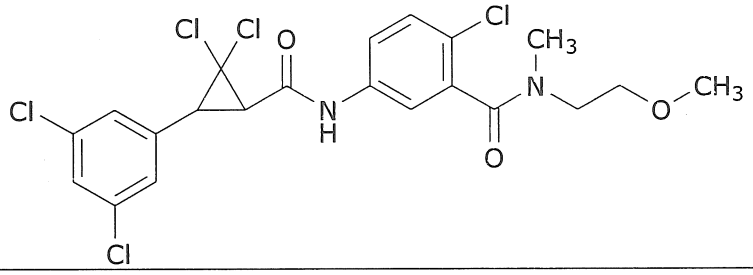
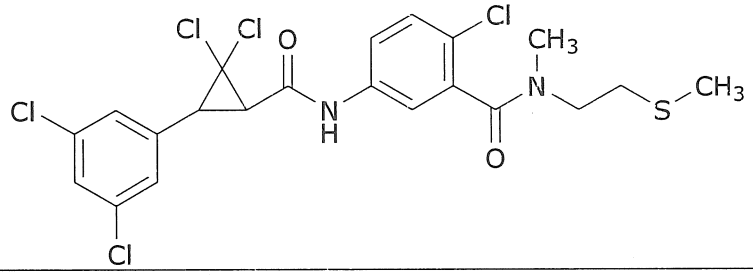
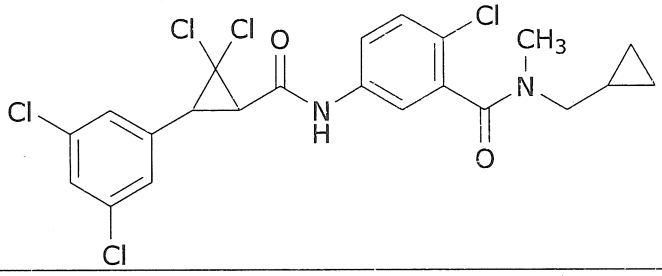
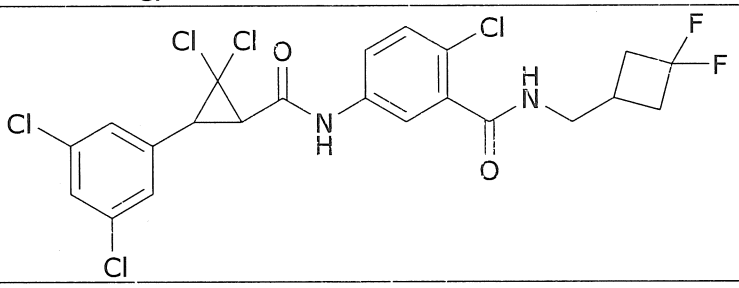
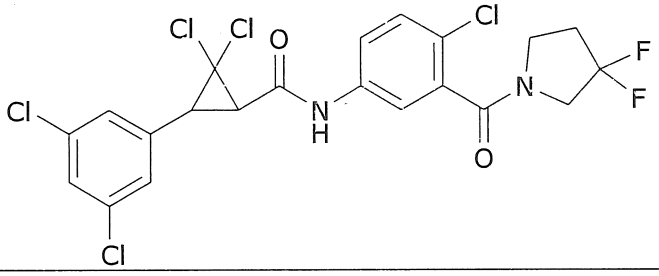
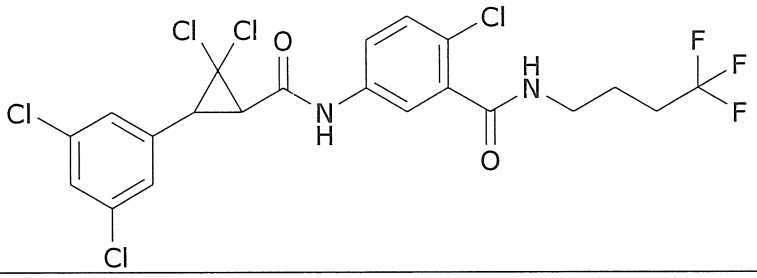
F37		16
F38		16
F39		16
F40		16
F41		16
F42		16

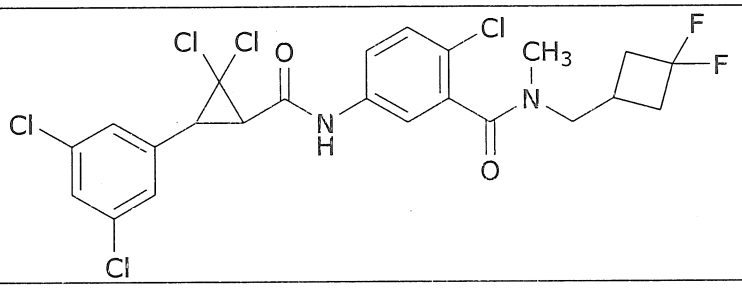
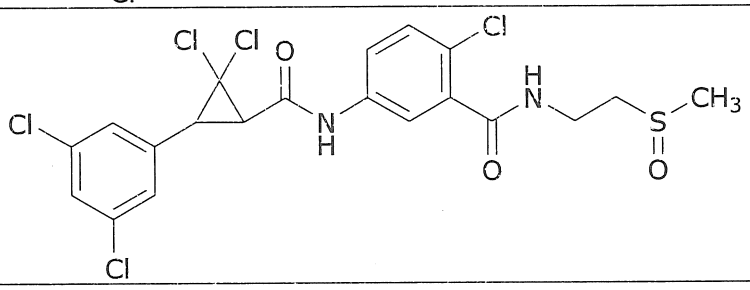
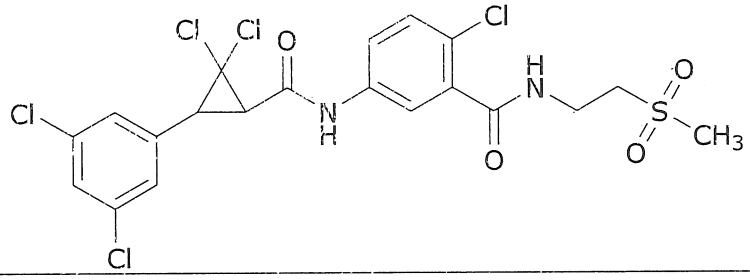
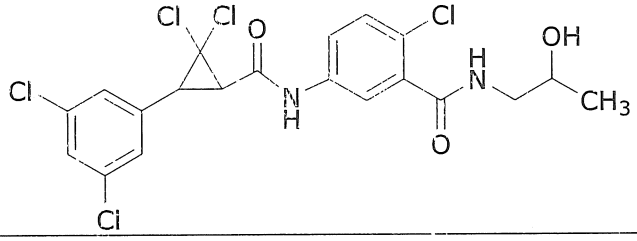
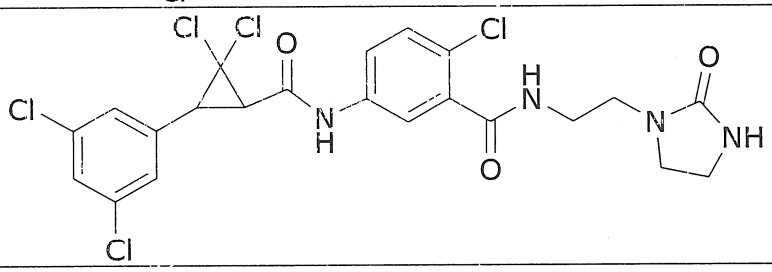
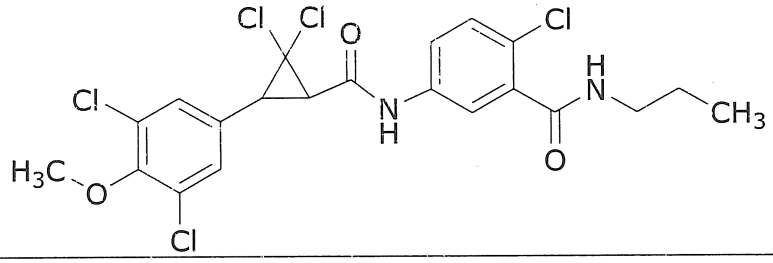
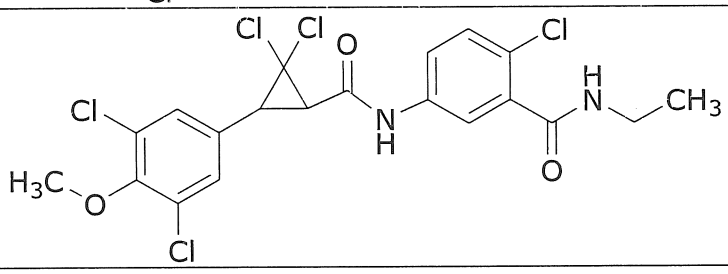
F43		16
F44		16
F45		16
F46		16
F47		16
F48		16

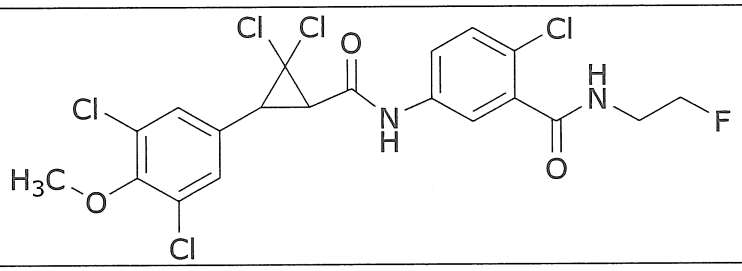
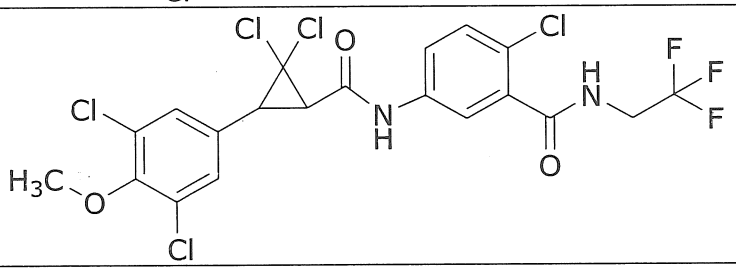
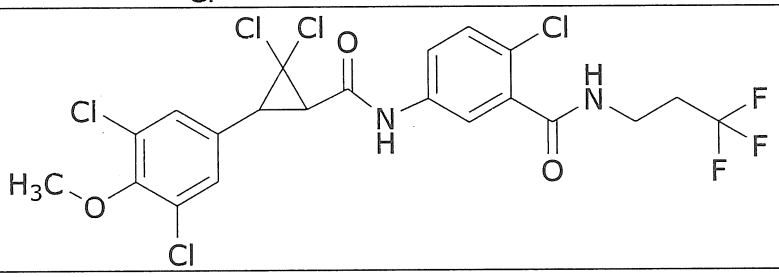
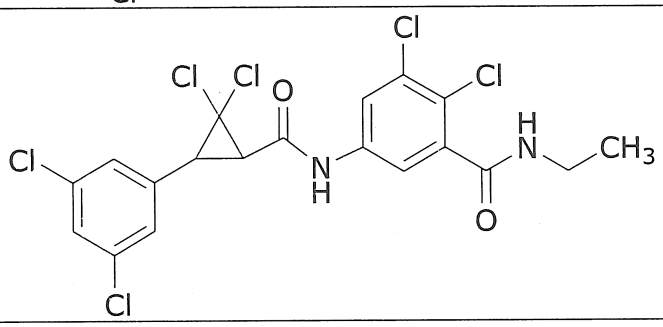
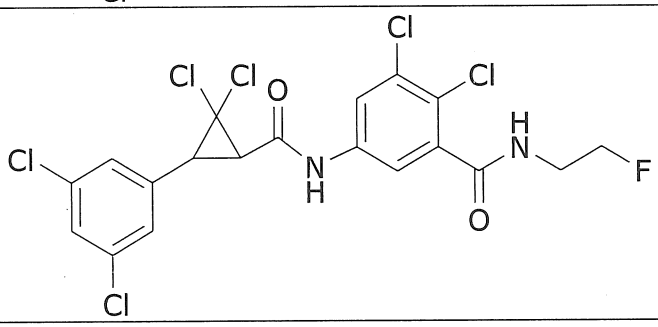
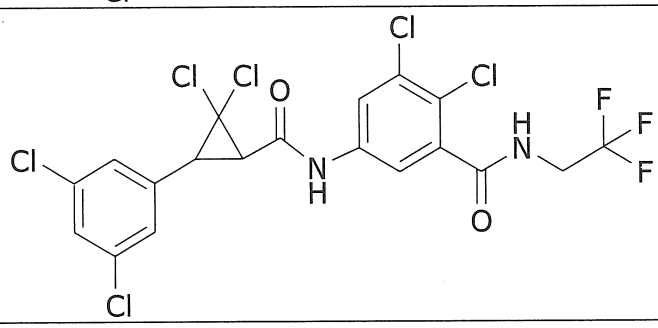
F49		16
F50		16
F51		16
F52		16
F53		16
F54		16

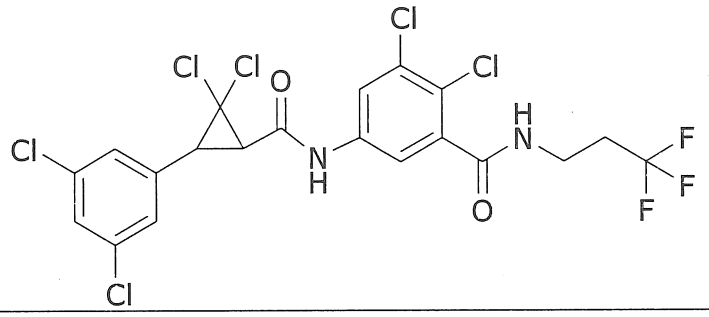
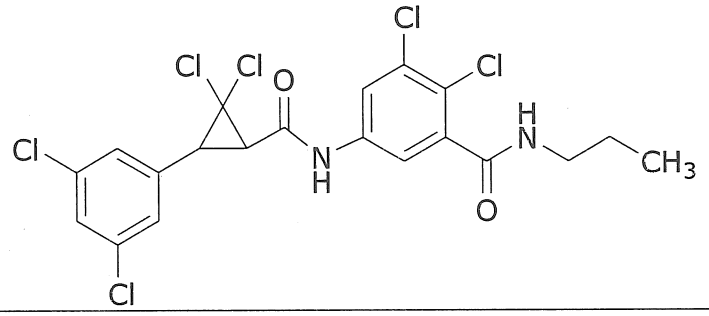
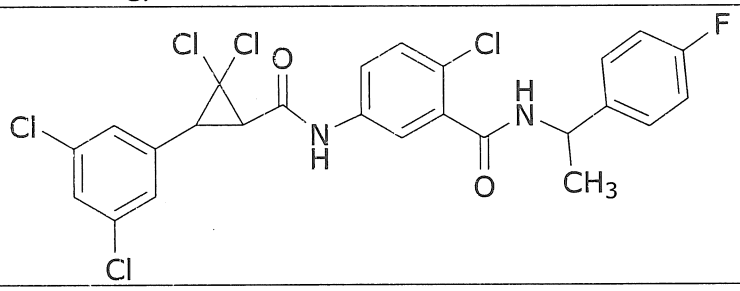
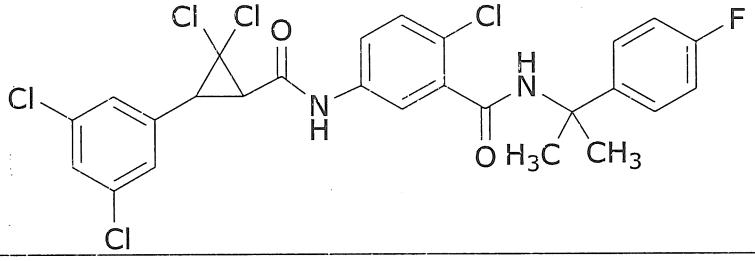
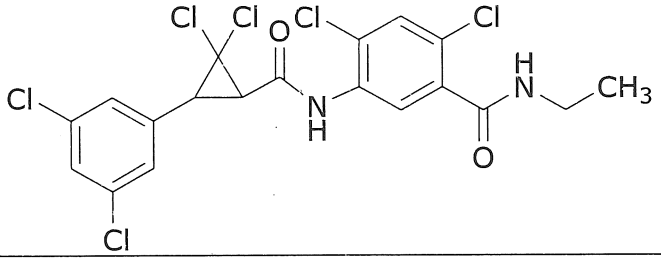
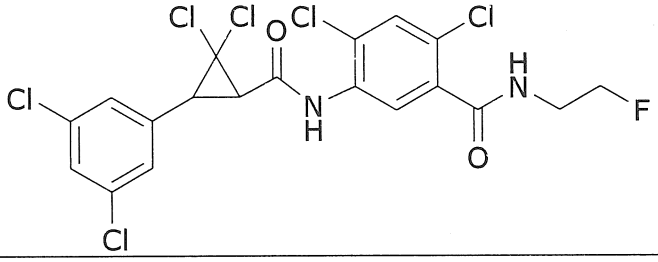
F55		16
F56		16
F57		16
F58		16
F59		16
F60		16

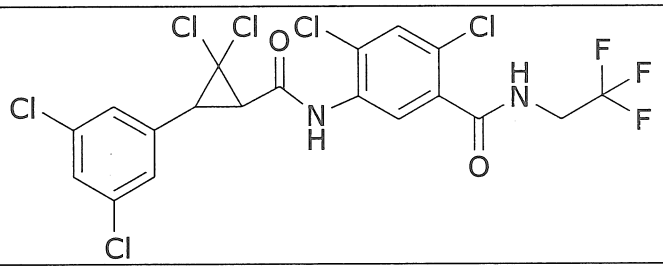
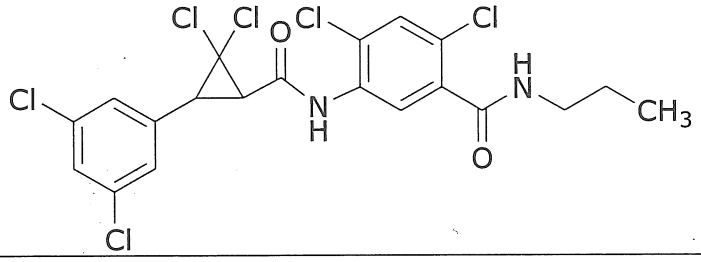
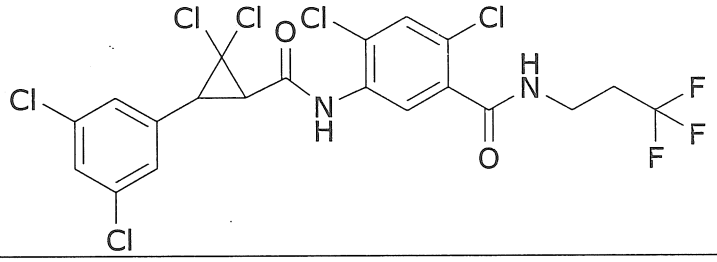
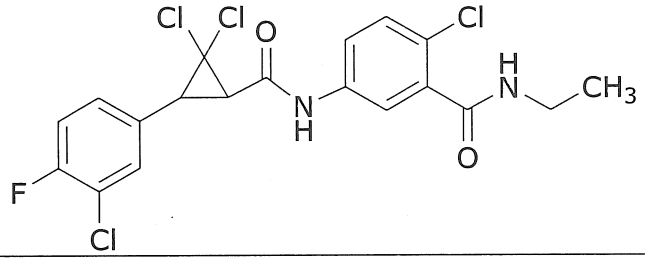
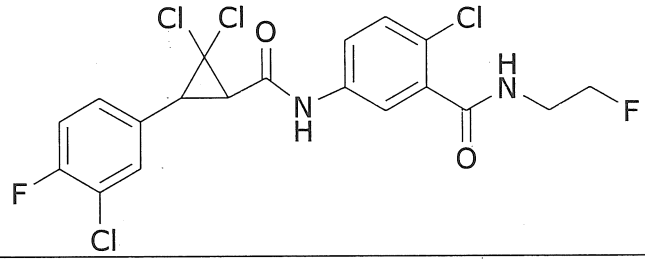
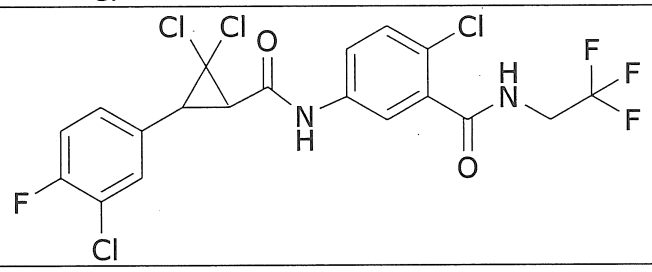
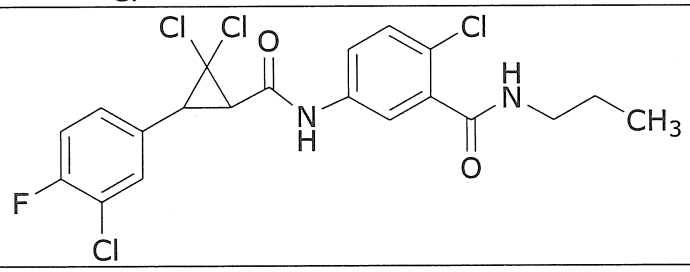
F61		16
F62		16
F63		16
F64		16
F65		16
F66		16

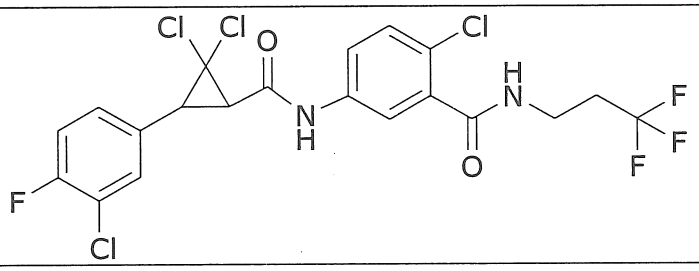
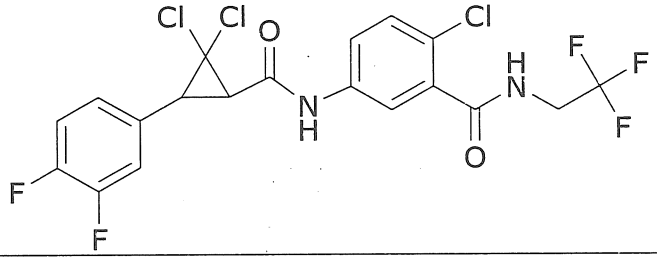
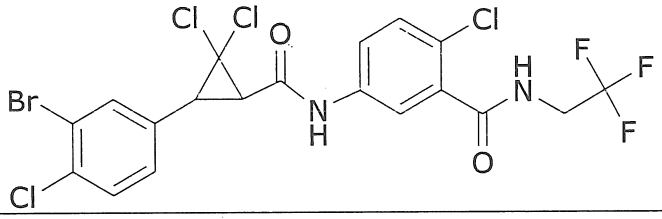
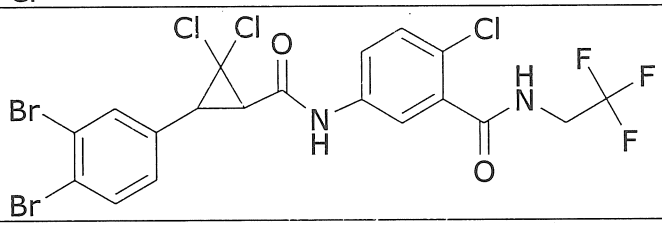
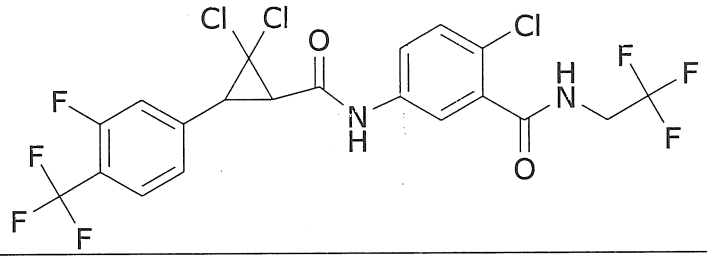
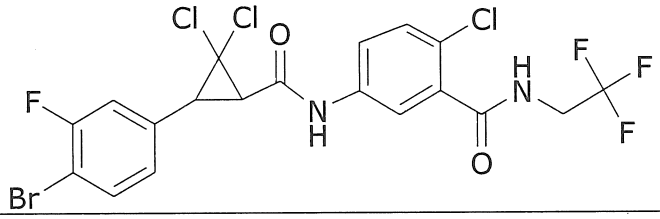
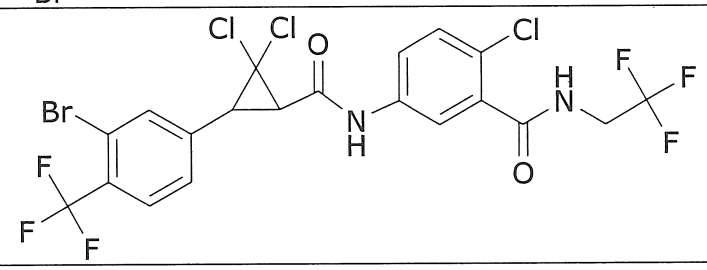
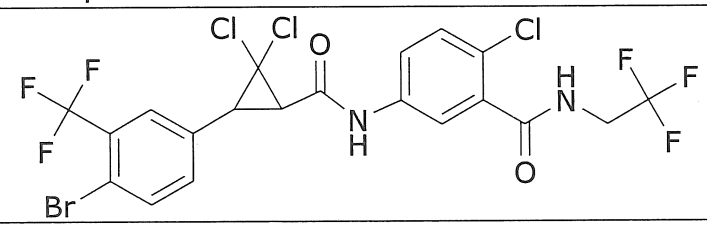
F67		16
F68		16
F69		16
F70		16
F71		16
F72		16

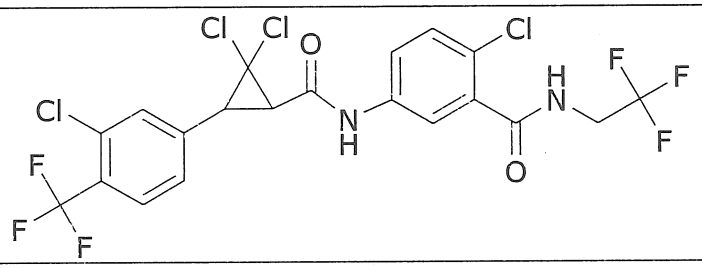
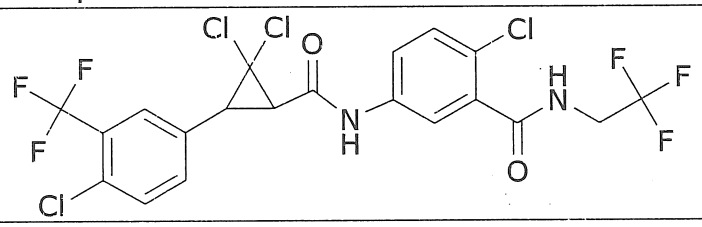
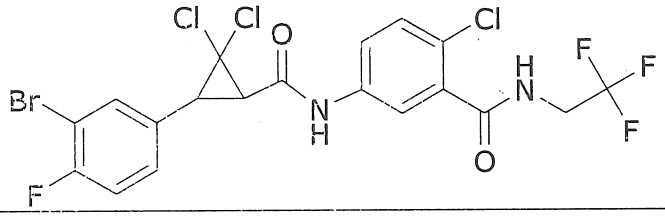
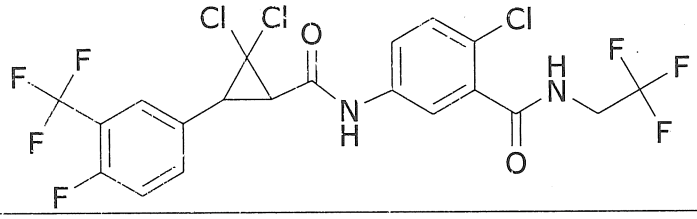
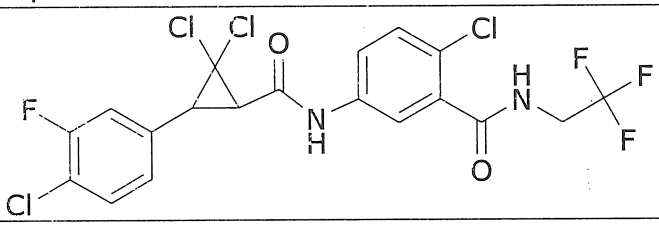
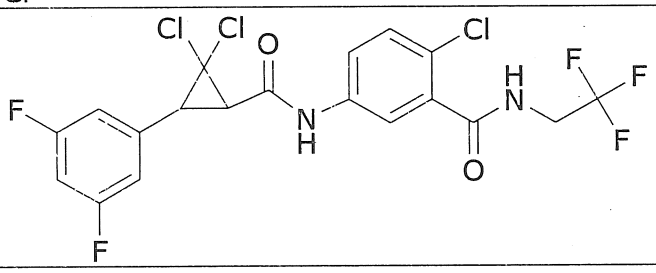
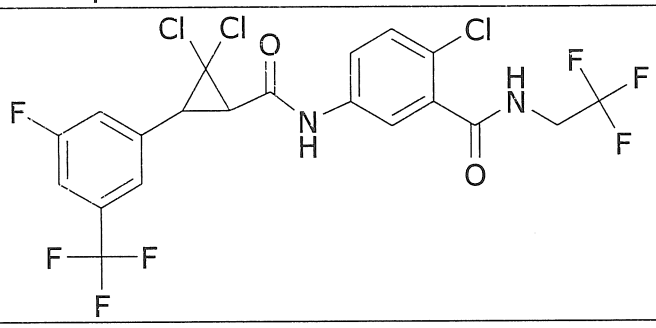
F73		16
F74		17
F75		17
F78		16
F79		16
F84		16
F85		16

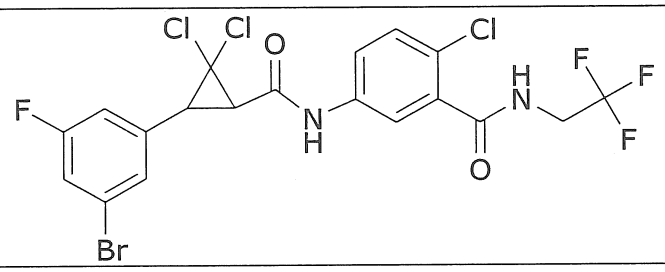
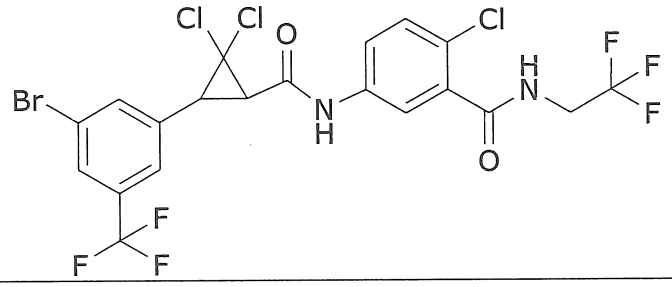
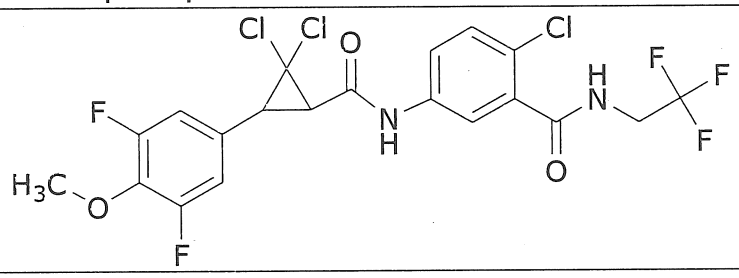
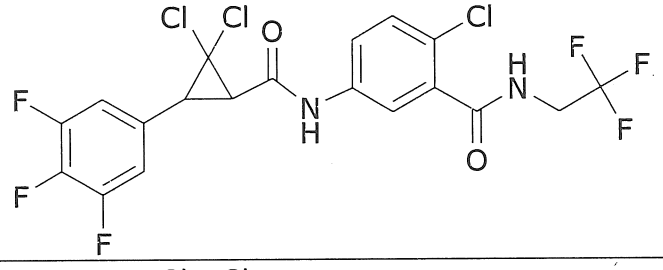
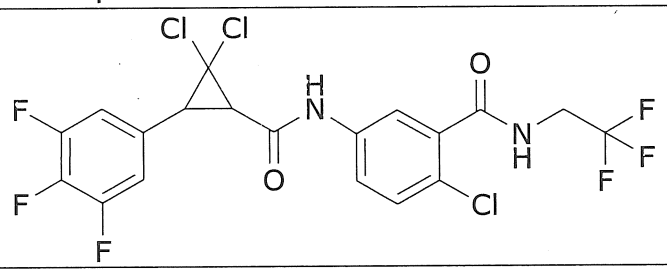
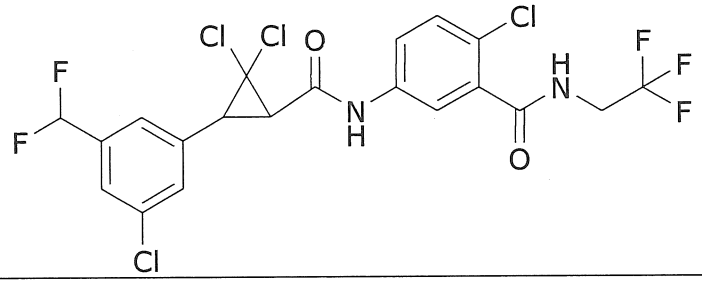
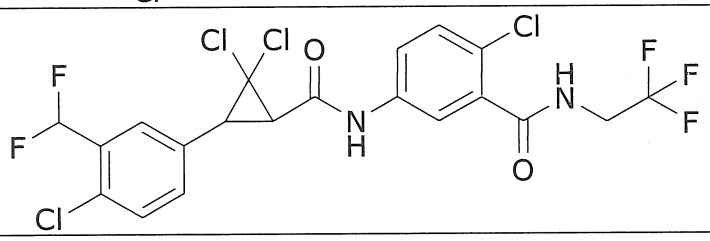
F86		16
F87		16
F88		16
F91		16
F92		16
F93		16

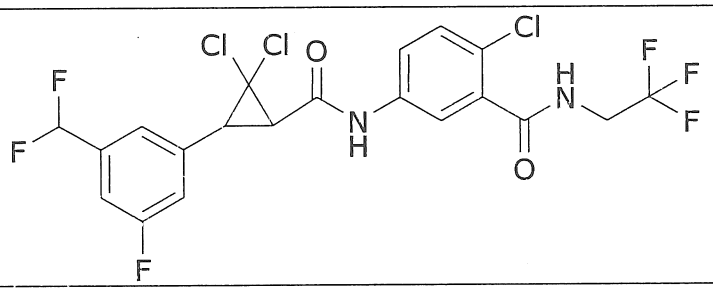
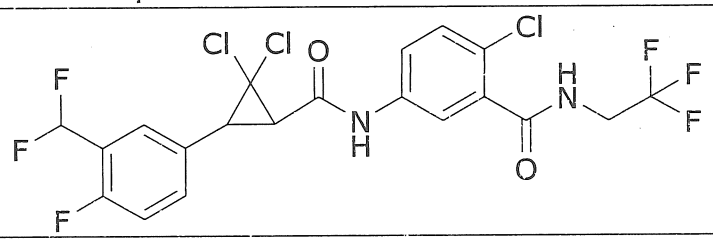
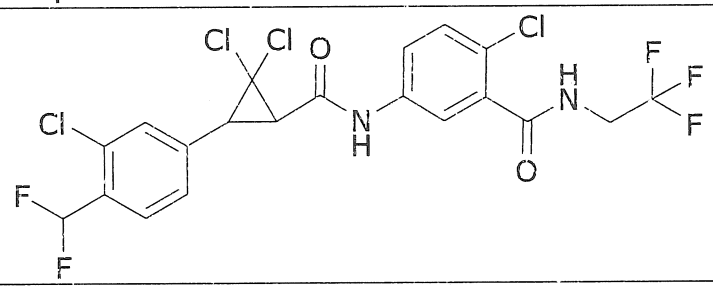
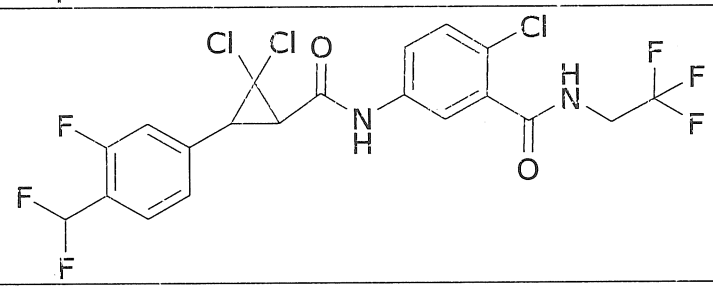
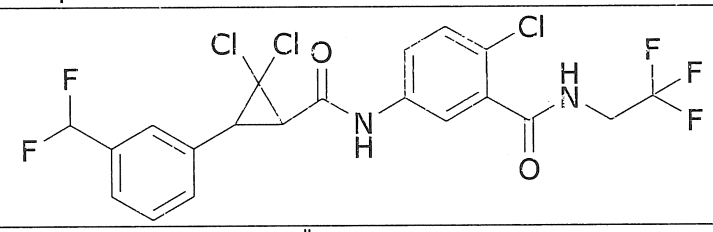
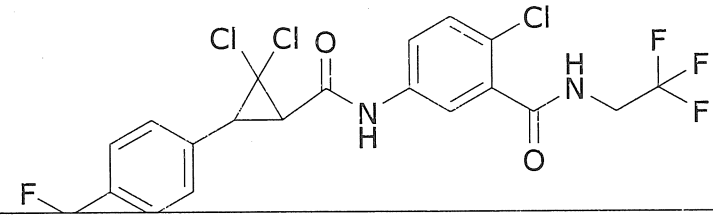
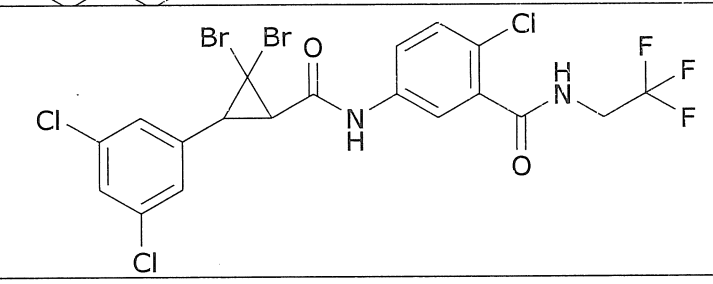
F94		16
F95		16
F96		23
F97		15
F98		16
F99		16

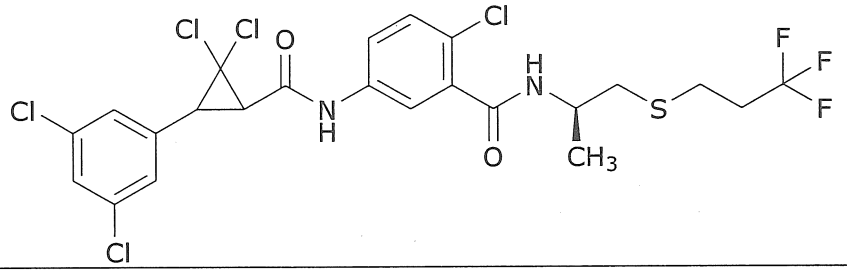
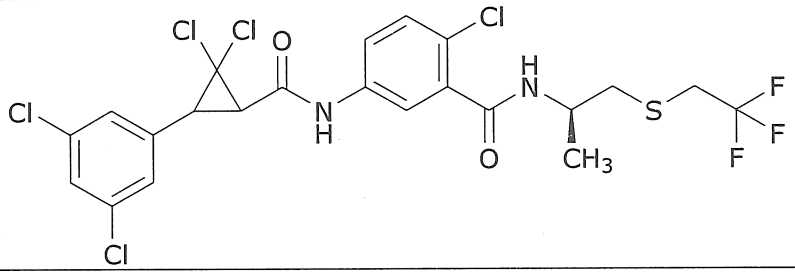
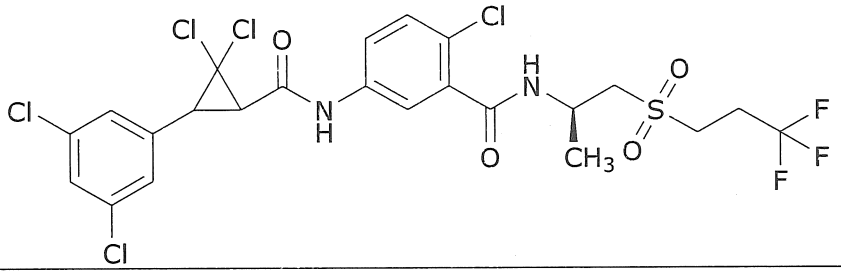
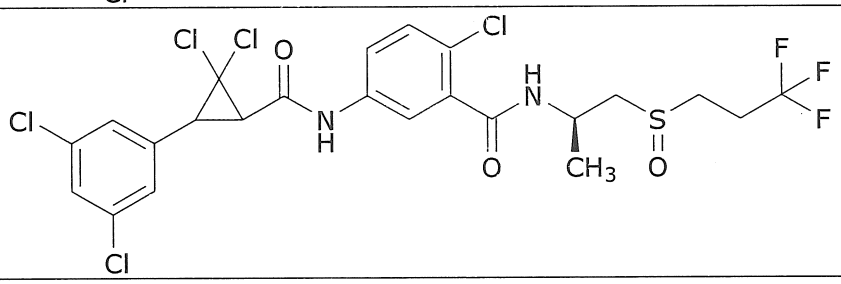
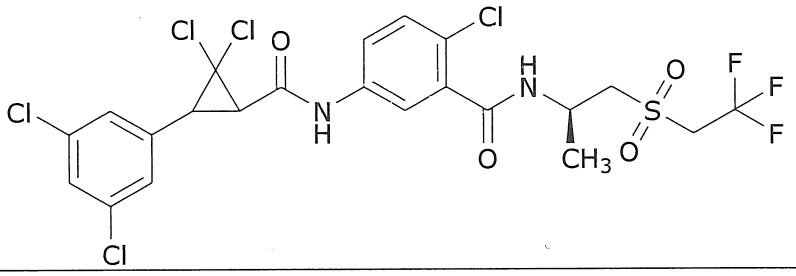
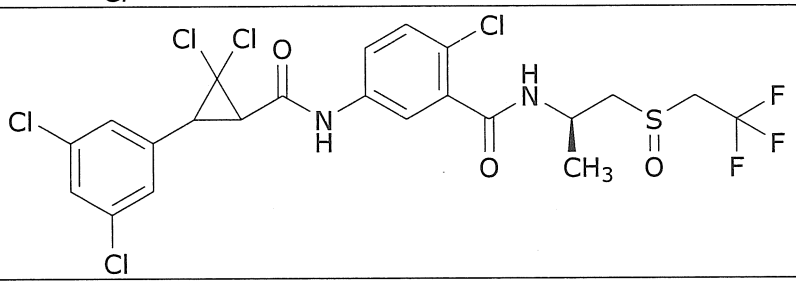
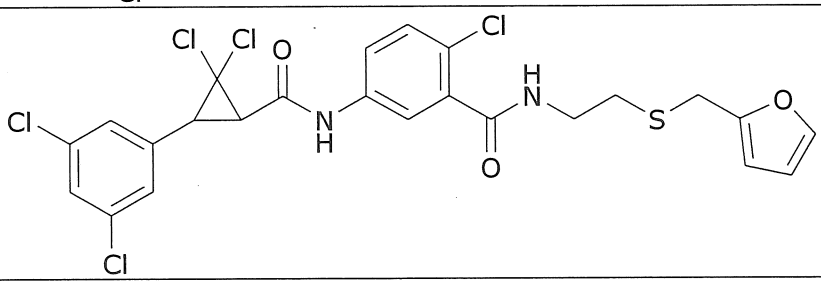
F100		16
F101		16
F102		16
F103		16
F104		16
F105		16
F106		16

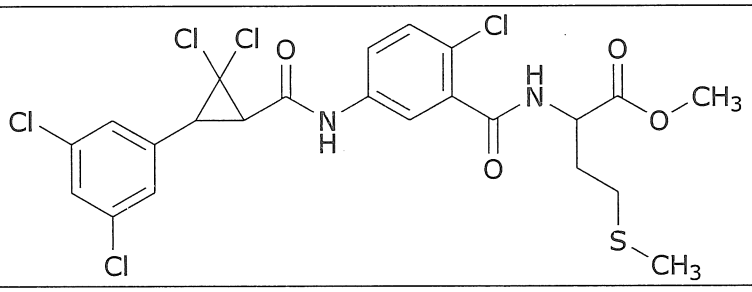
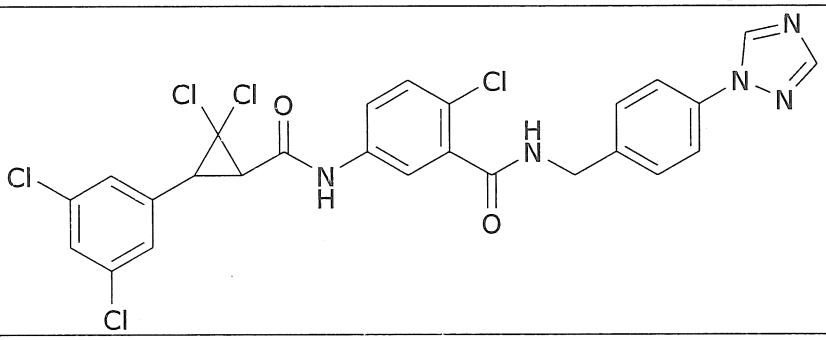
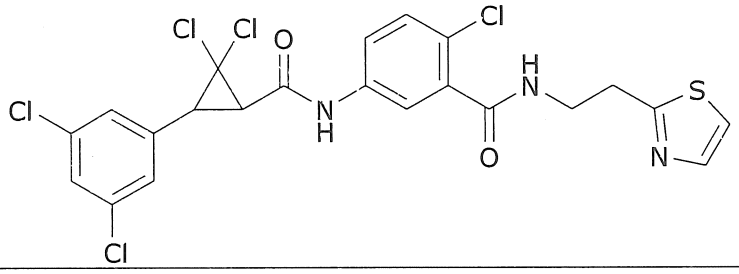
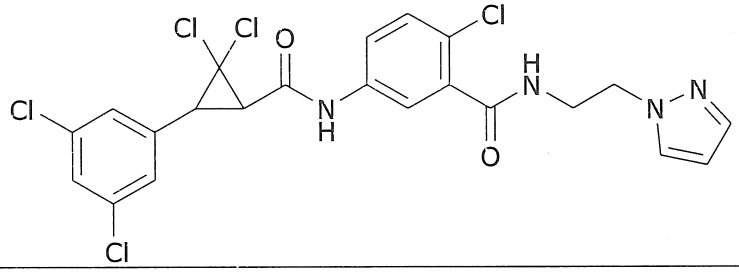
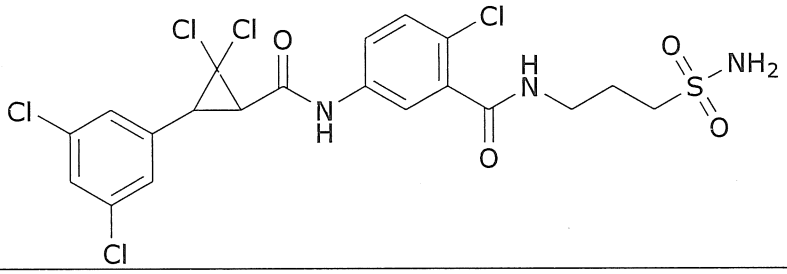
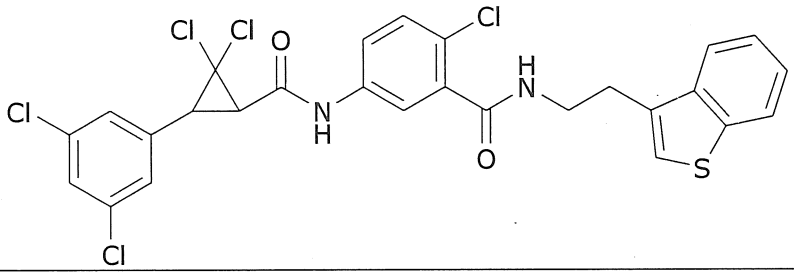
F107		16
F108		24
F109		24
F111		24
F112		24
F113		24
F114		24
F115		24

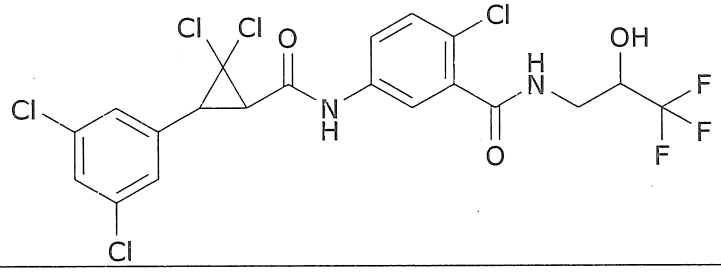
F116		24
F117		24
F118		24
F119		24
F120		24
F121		24
F122		24

F123		24
F124		24
F125		24
F126		24
F127		24
F128		24
F129		24

F130		24
F131		24
F132		24
F133		24
F134		24
F135	!! EMBED ChemDraw.Document.6.0 	24
PF1		13

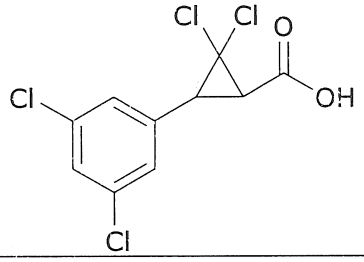
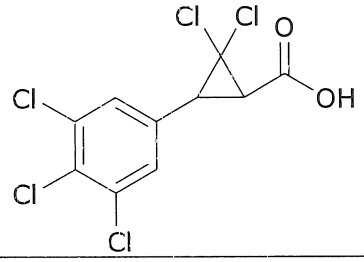
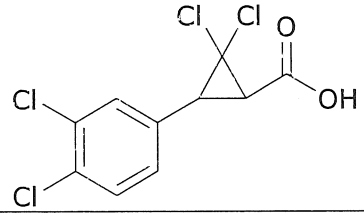
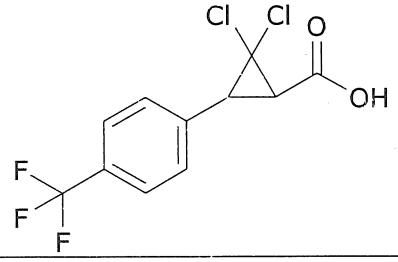
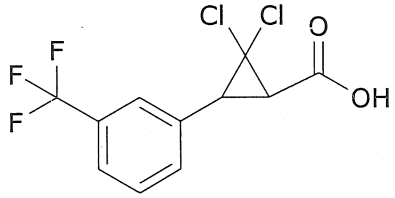
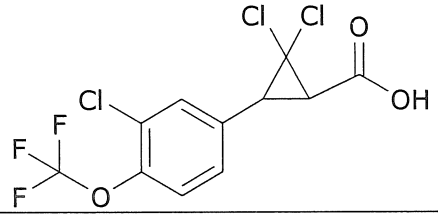
PF2		16
PF3		16
PF4		17a
PF5		17a
PF6		17a
PF7		17a
PF9		16

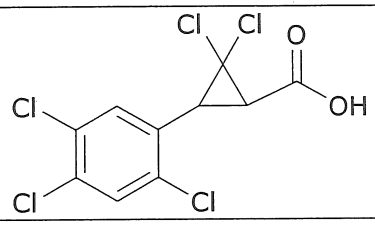
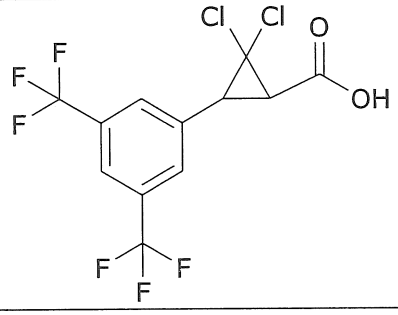
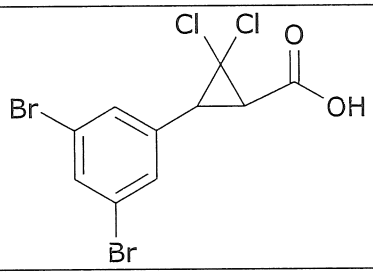
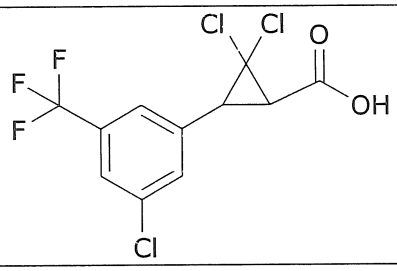
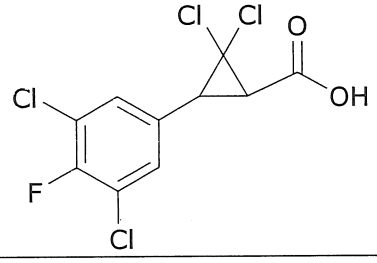
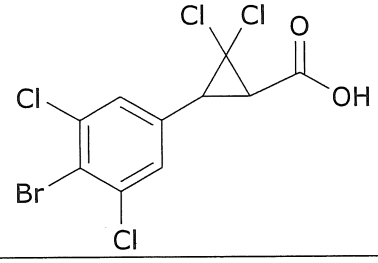
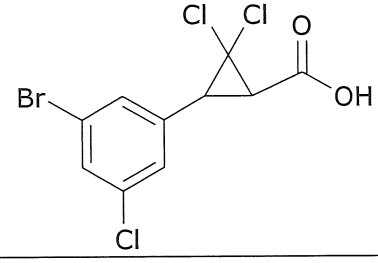
PF10		16
PF11		16
PF12		16
PF13		16
PF14		16
PF15		16

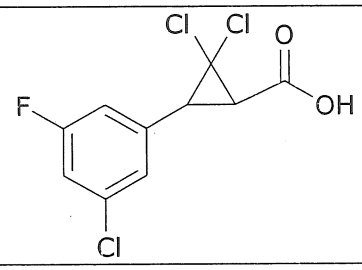
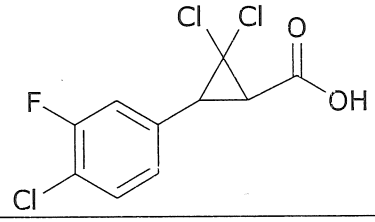
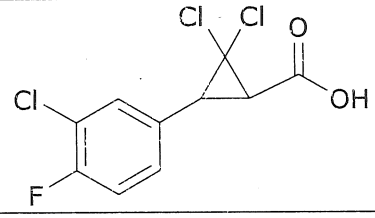
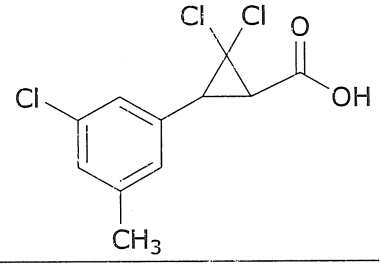
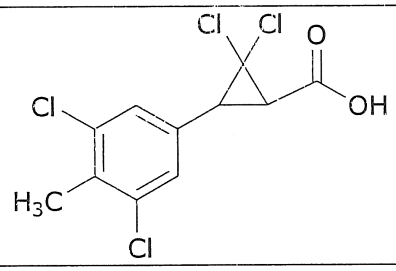
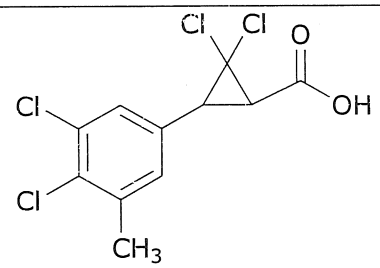
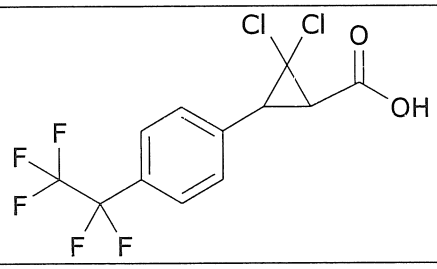
PF16		16

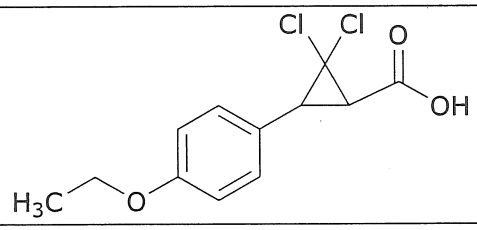
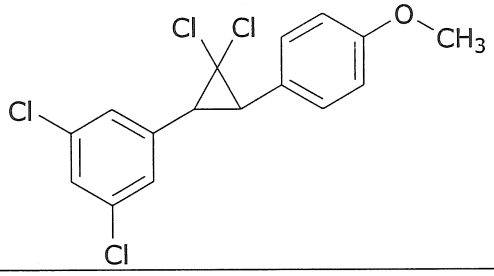
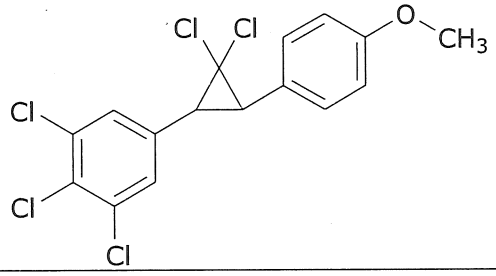
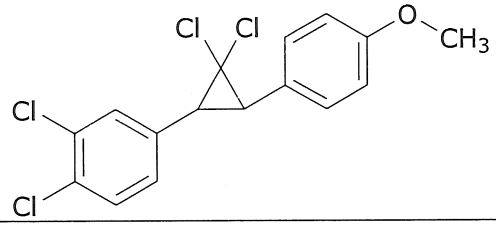
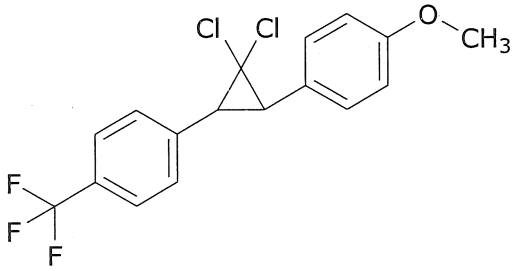
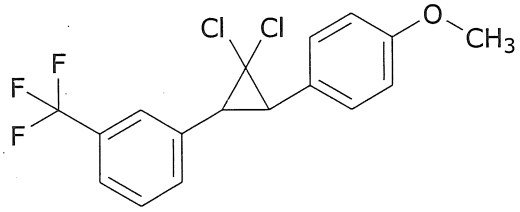
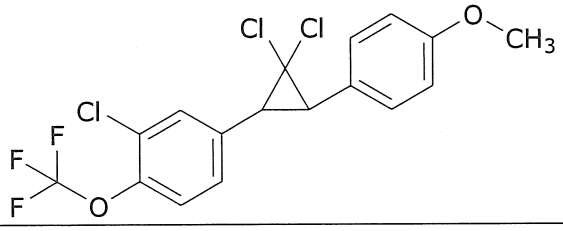
*được điều chế theo số ví dụ

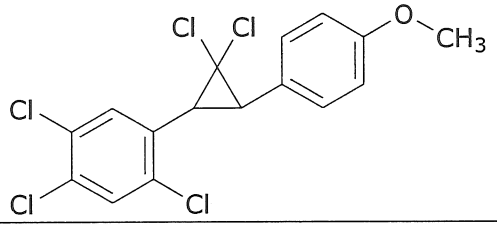
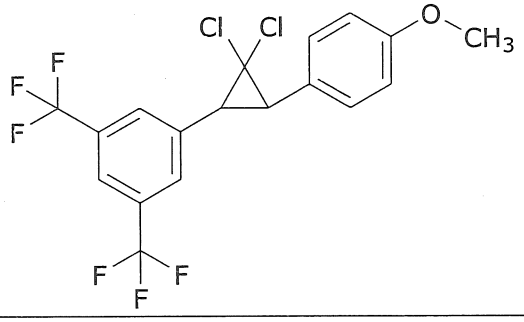
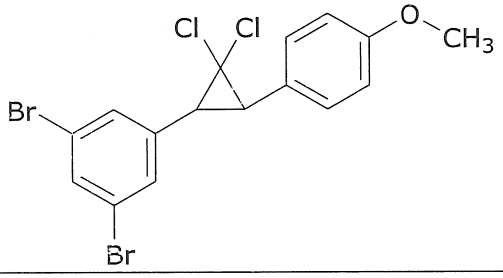
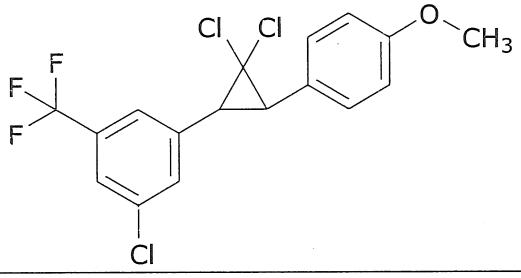
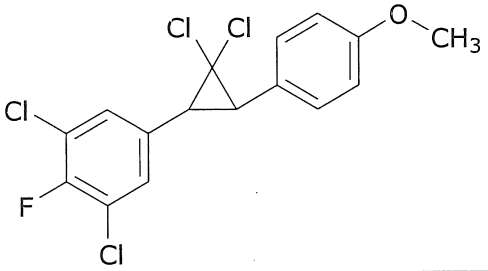
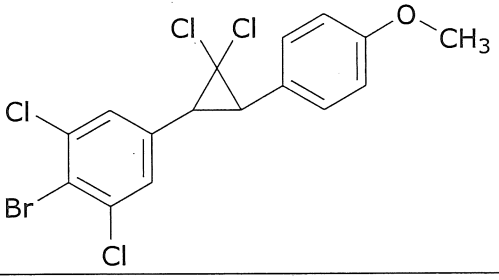
Bảng 3. Cấu tạo và phương pháp điều chế dùng cho các hợp chất chuỗi C

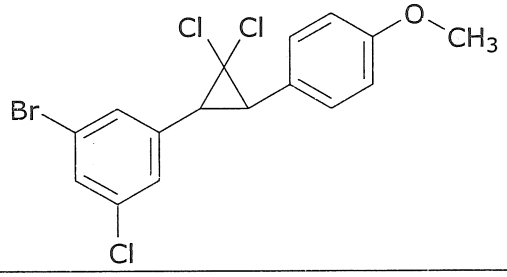
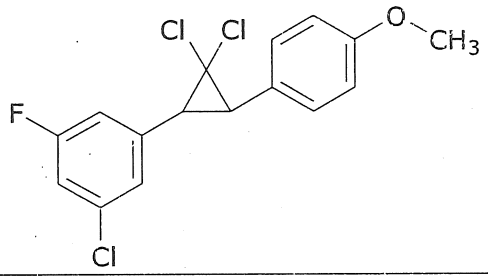
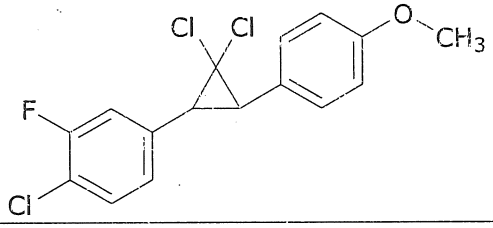
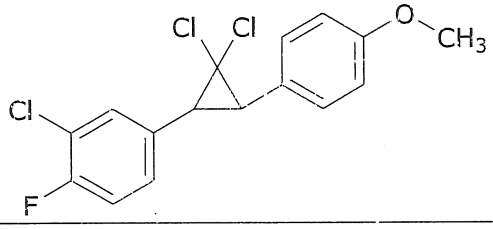
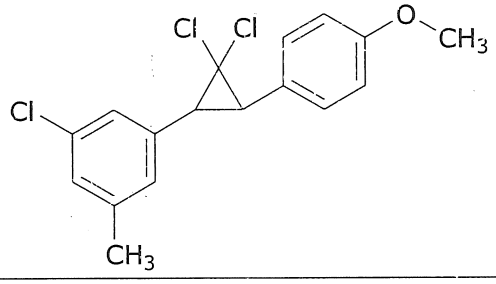
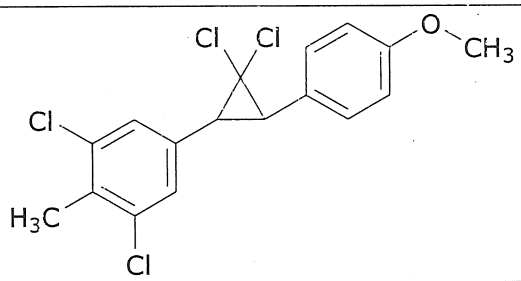
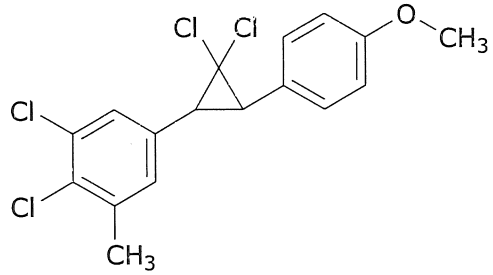
Số	Cấu trúc	Điều chế
C1		1
C2		1
C3		1
C4		2
C5		2
C6		2

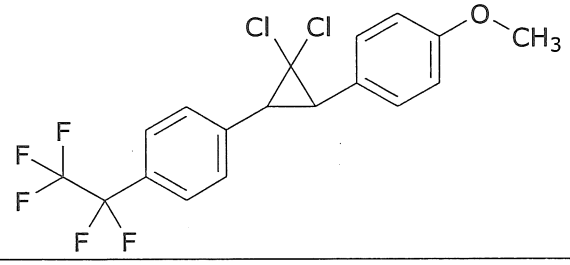
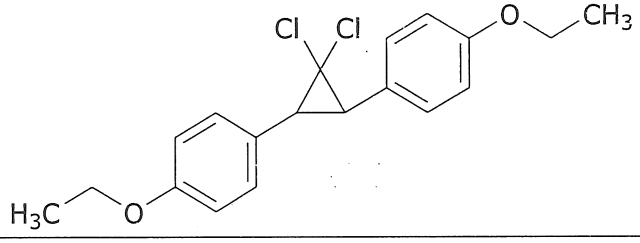
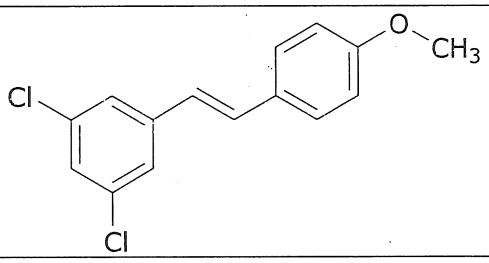
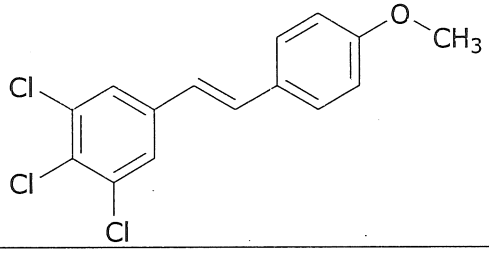
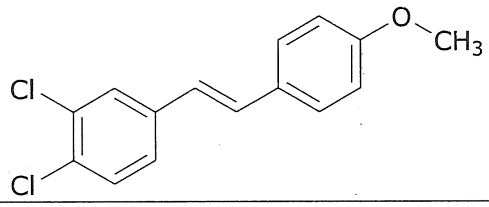
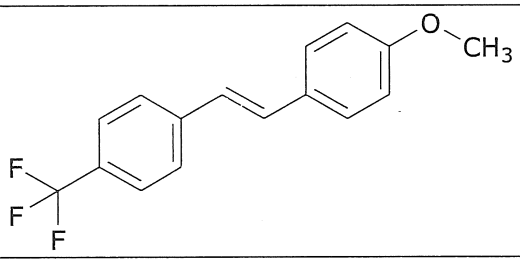
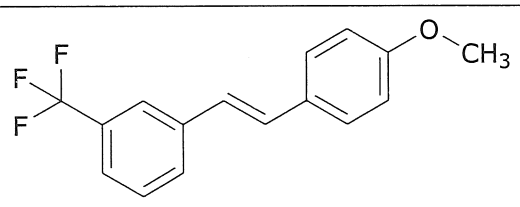
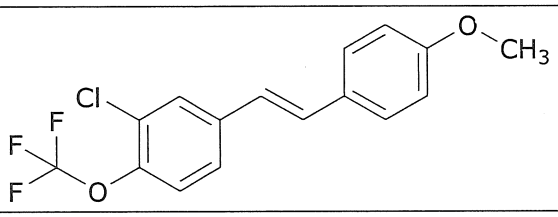
C7		2
C8		2
C9		2
C10		2
C11		2
C12		2
C13		2

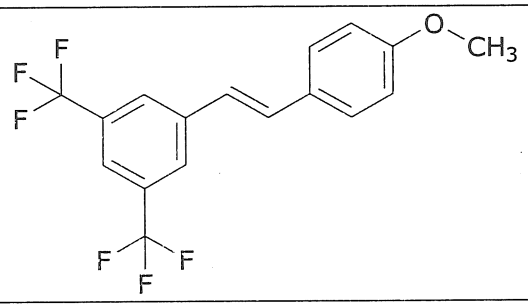
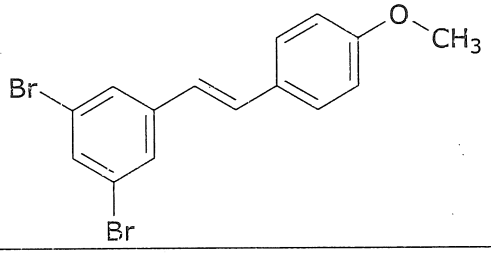
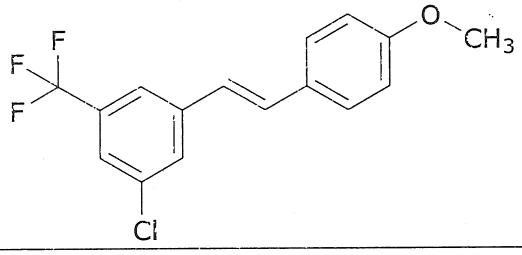
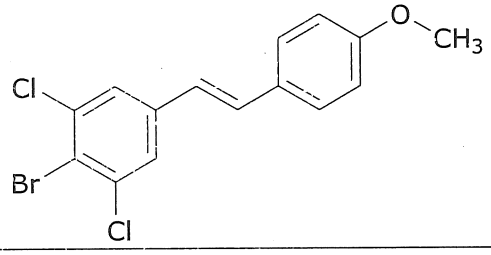
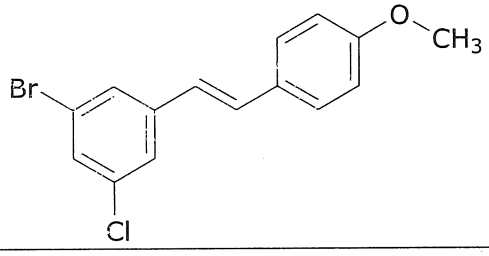
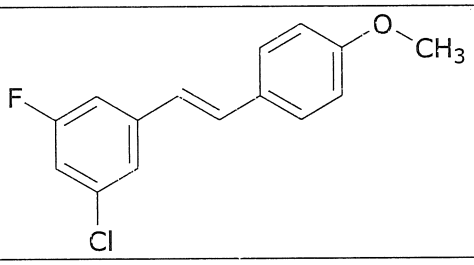
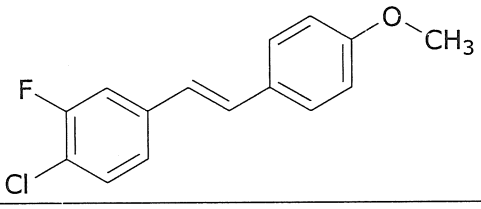
C14		2
C15		2
C16		2
C17		2
C18		2
C19		2
C20		2

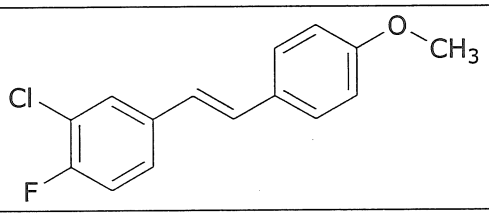
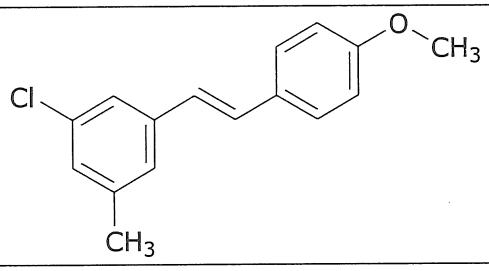
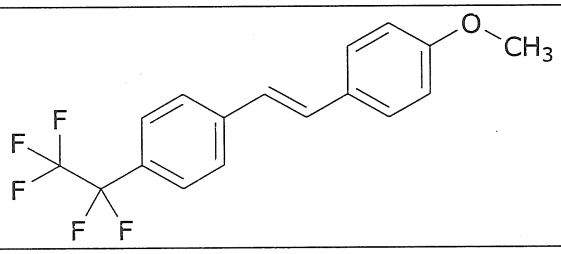
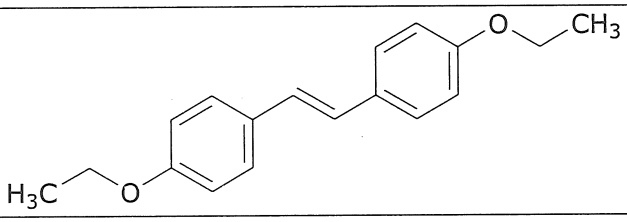
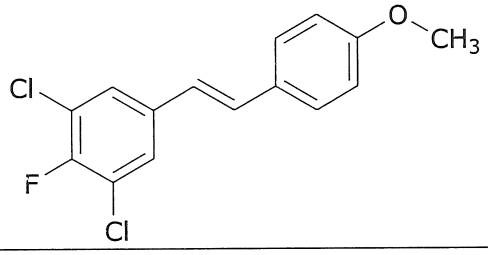
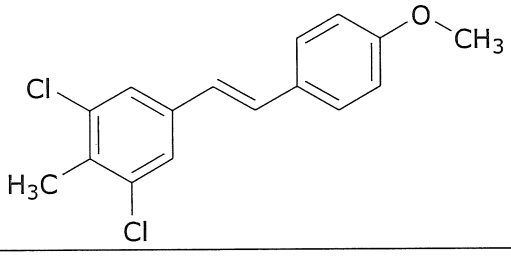
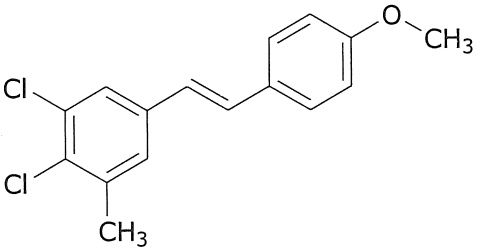
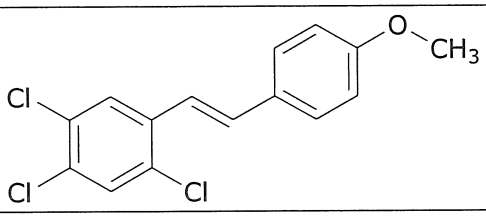
C21		2
C22		3
C23		3
C24		3
C25		4
C26		4
C27		4

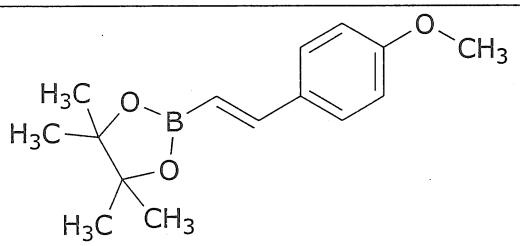
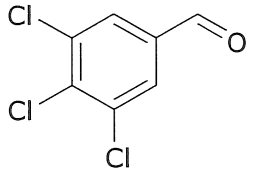
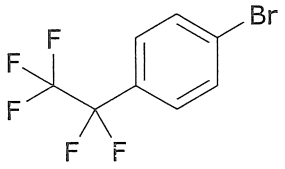
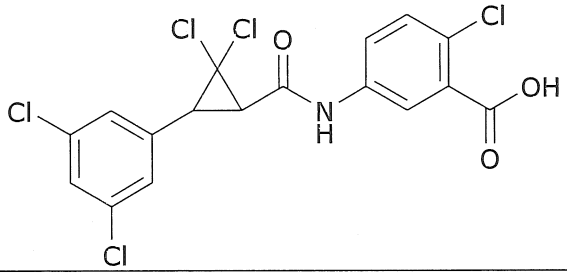
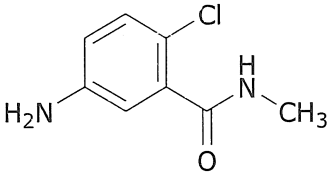
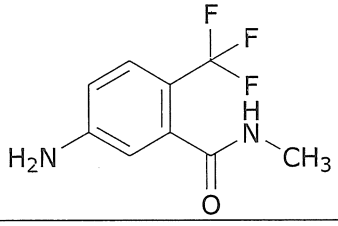
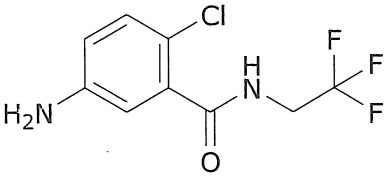
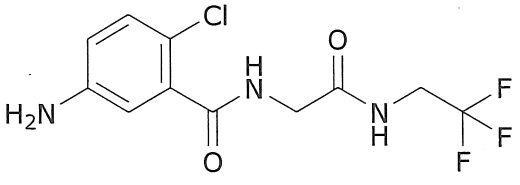
C28		4
C29		4
C30		4
C31		4
C32		4
C33		4

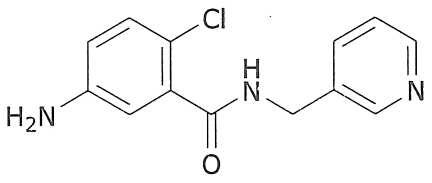
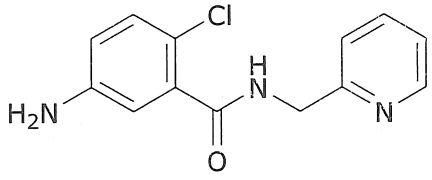
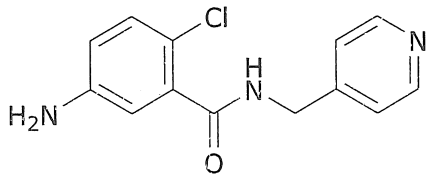
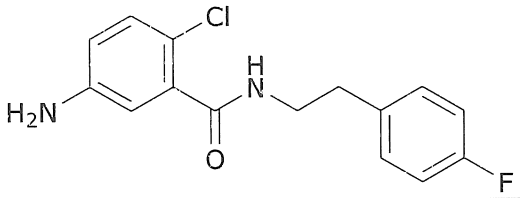
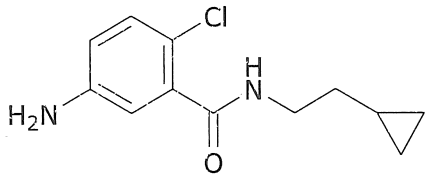
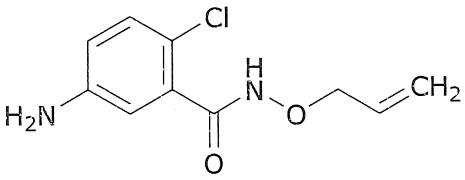
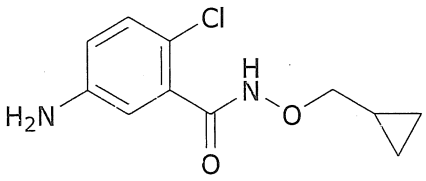
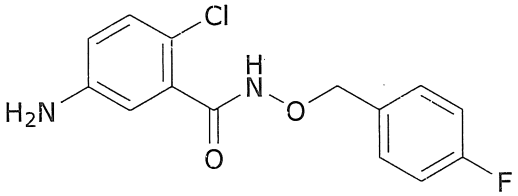
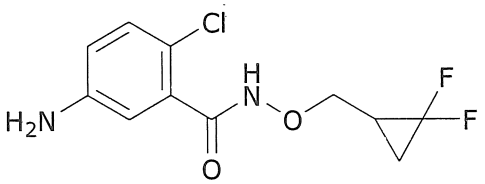
C34		4
C35		4
C36		4
C37		4
C38		4
C39		4
C40		4

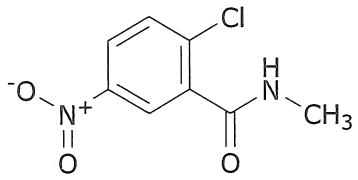
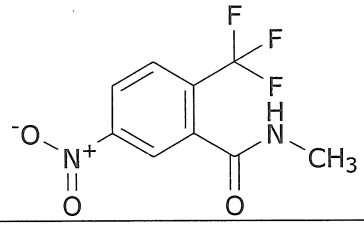
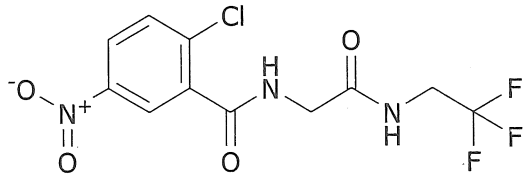
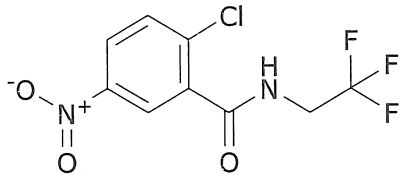
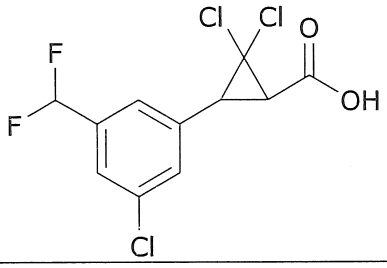
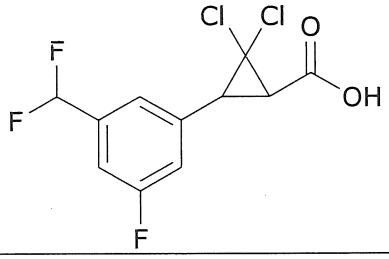
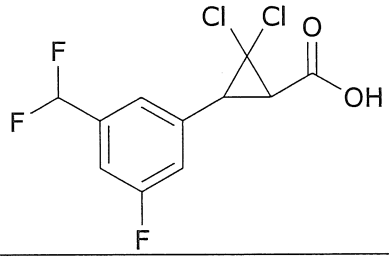
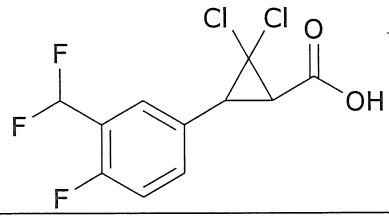
C41		4
C42		4
C43		5
C44		5
C45		5
C46		6
C47		6
C48		6

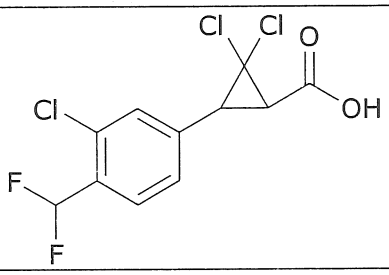
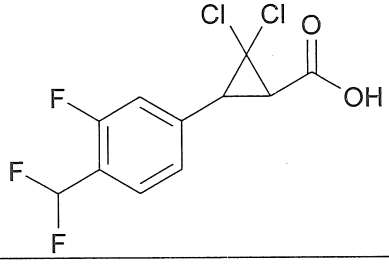
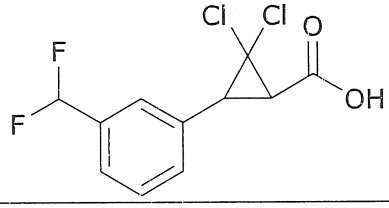
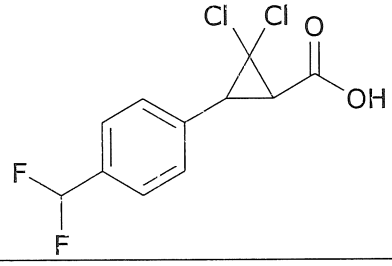
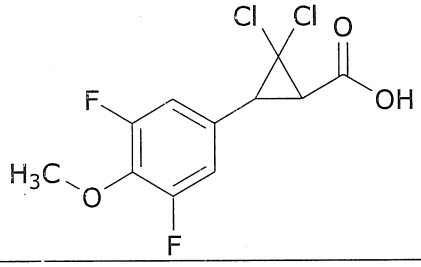
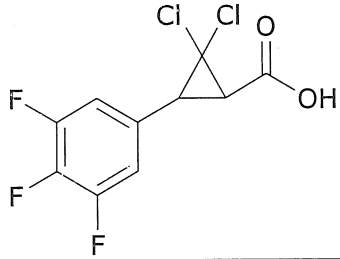
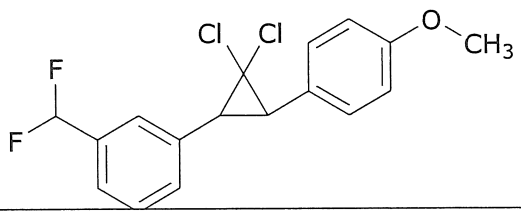
C49		6
C50		6
C51		6
C52		6
C53		6
C54		6
C55		6

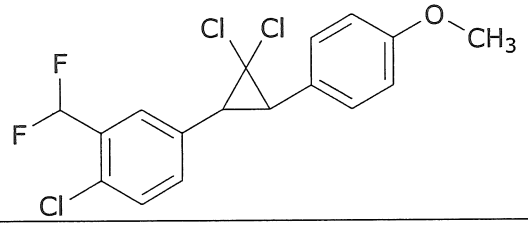
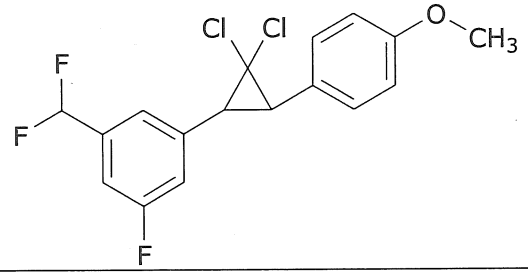
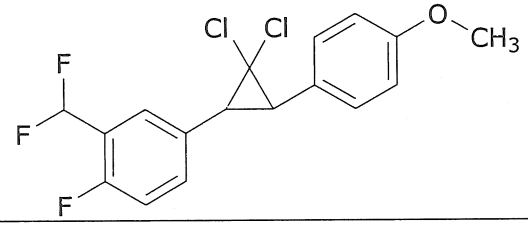
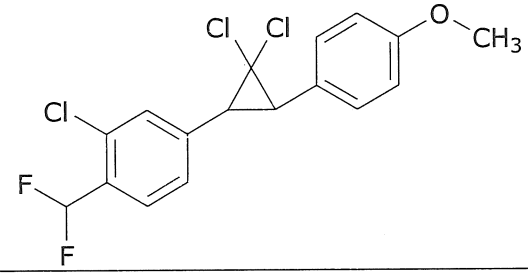
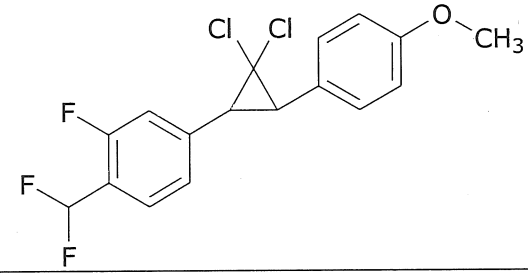
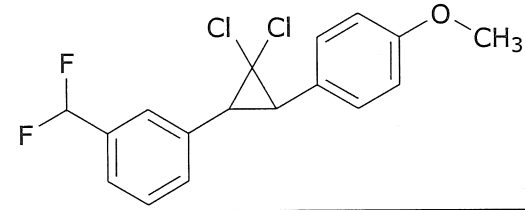
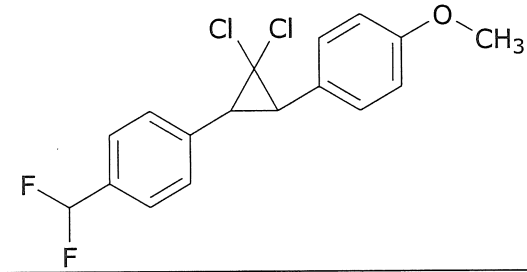
C56		6
C57		6
C58		6
C59		6
C60		7
C61		7
C62		7
C63		8

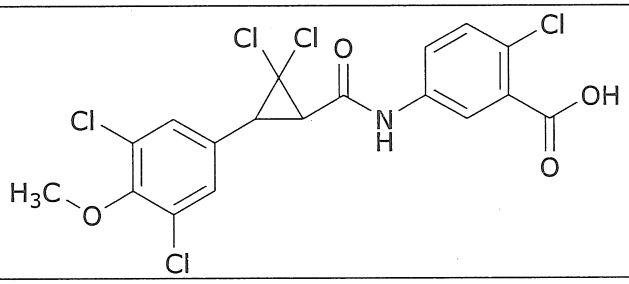
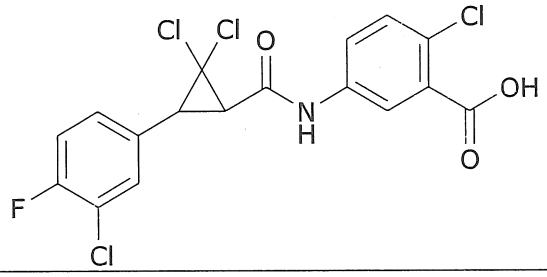
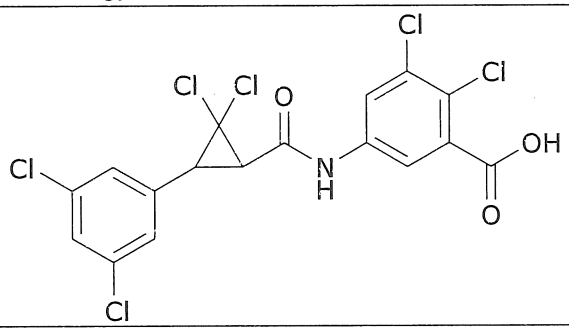
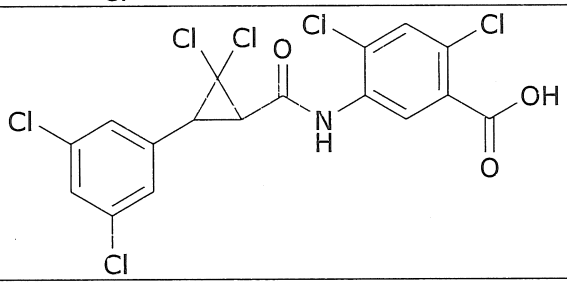
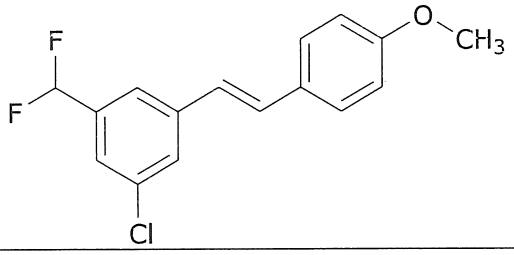
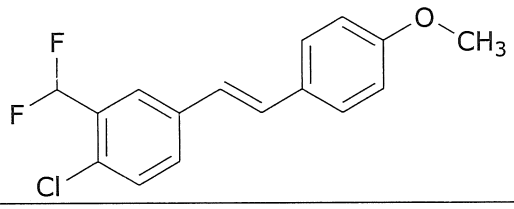
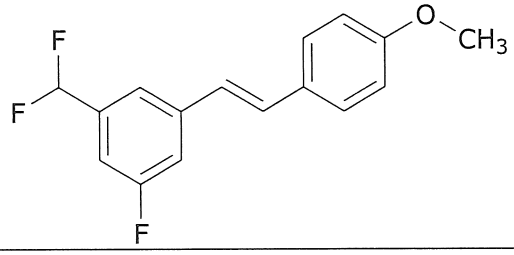
C64		9
C65		10
C66		11
C67		12
C68		17b
C69		17b
C70		17b
C71		17b

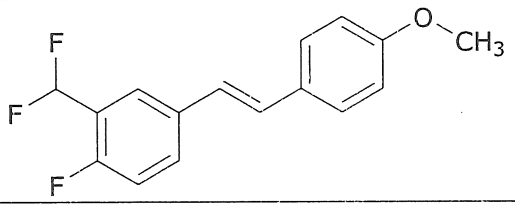
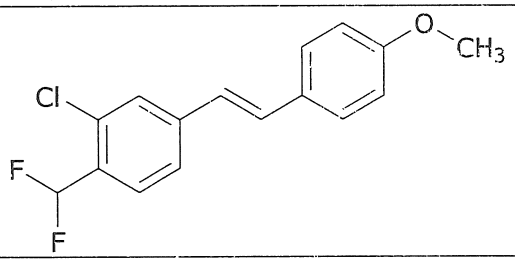
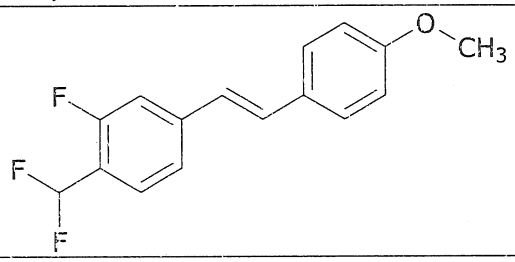
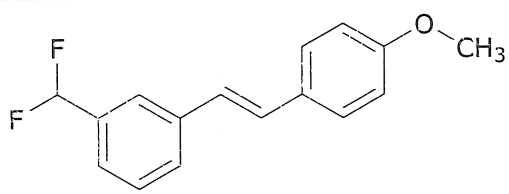
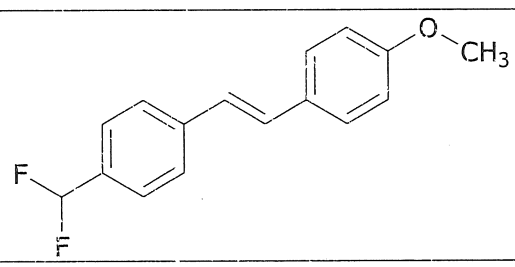
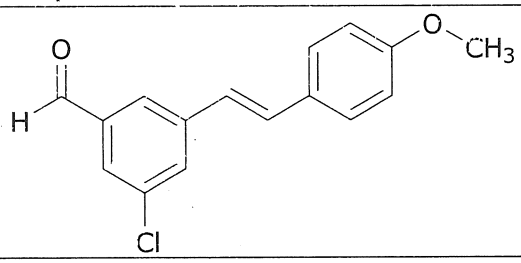
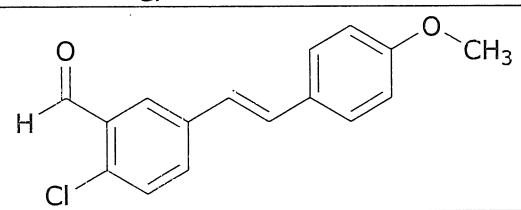
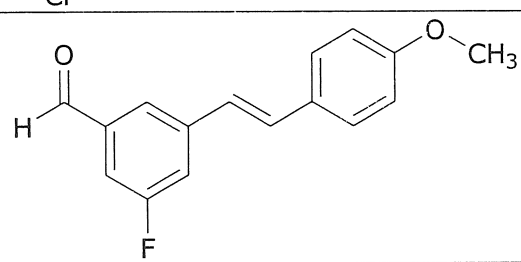
C72		18
C73		18
C74		18
C75		18
C76		18
C77		19
C78		19
C79		19
C80		20

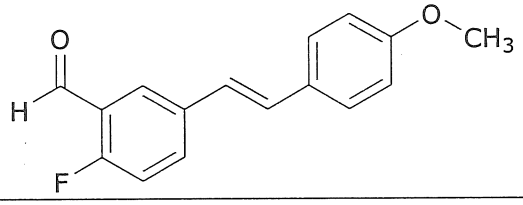
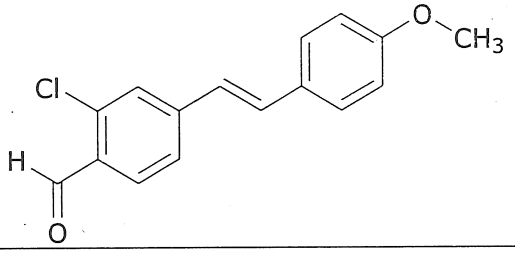
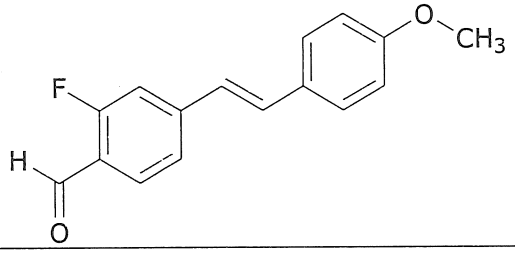
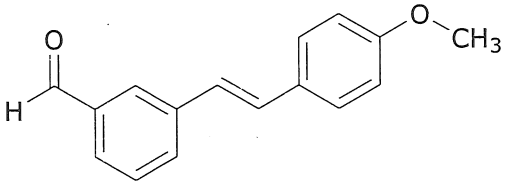
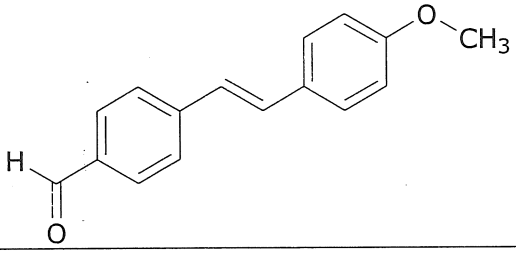
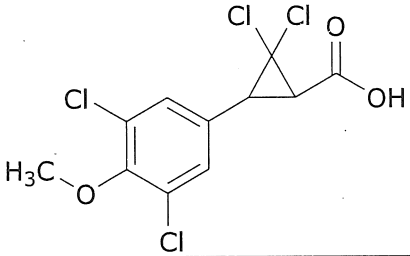
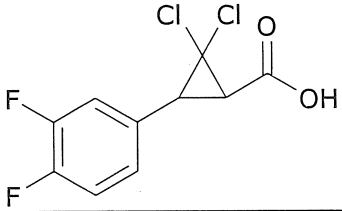
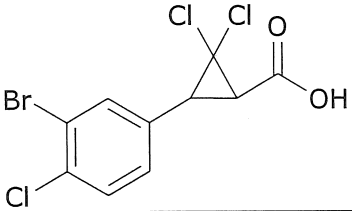
C81		21
C82		21
C83		21
C84		22
C85		2
C86		2
C87		2
C88		2

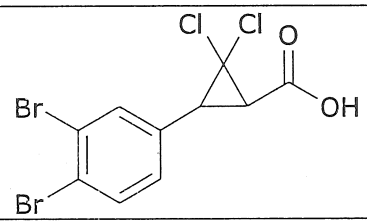
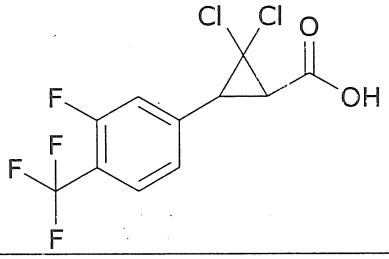
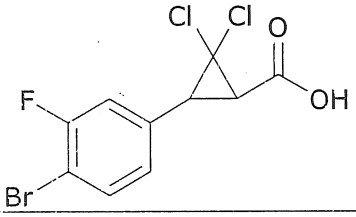
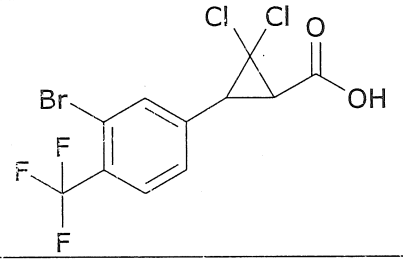
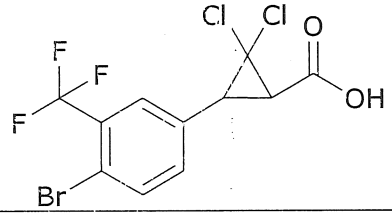
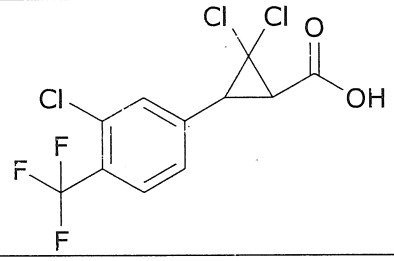
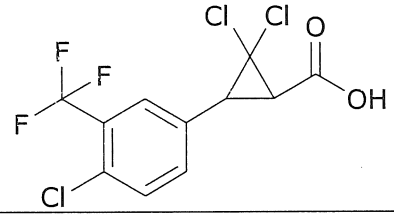
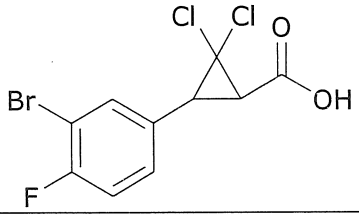
C89		2
C90		2
C91		2
C92		2
C93		2
C94		2
C95	‼ EMBED ChemDraw.Document.6.0 	4

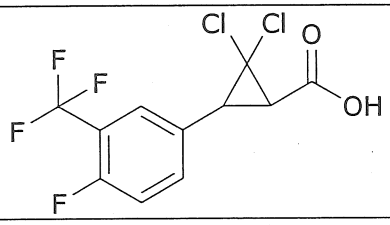
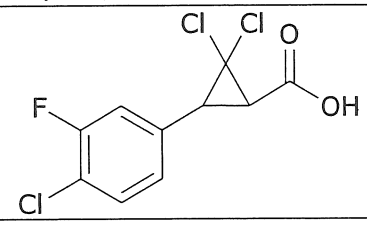
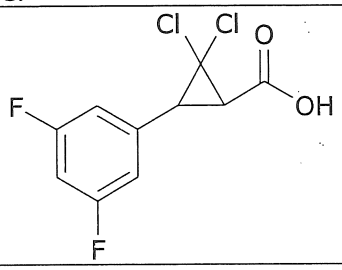
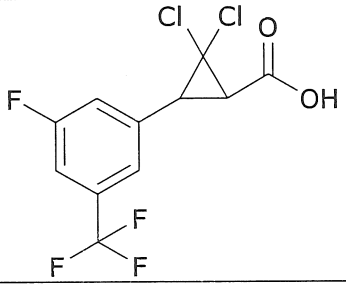
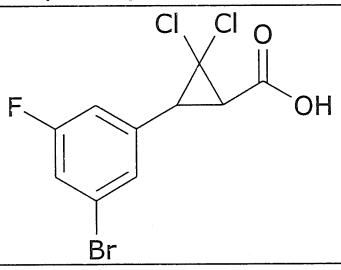
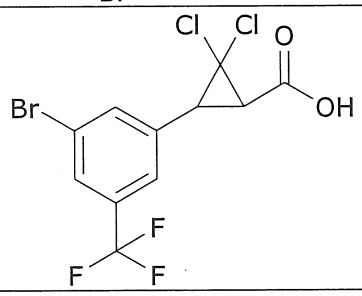
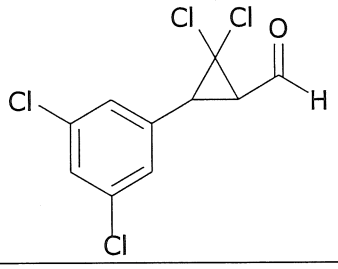
C96		4
C97		4
C98		4
C99		4
C100		4
C101		4
C102		4

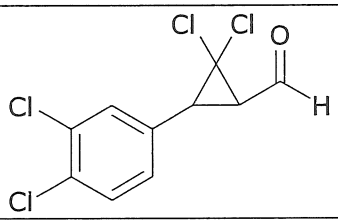
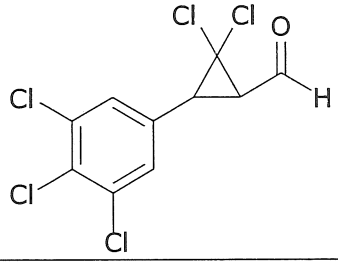
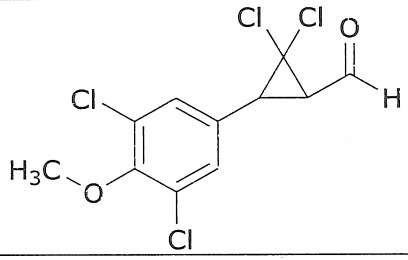
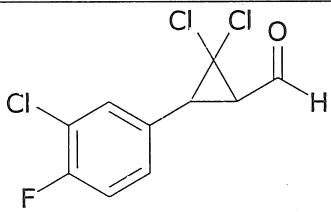
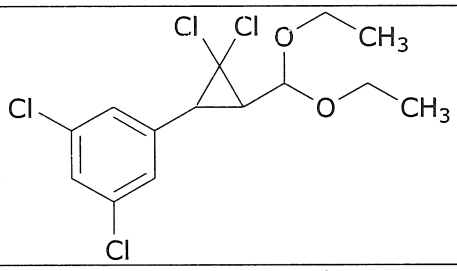
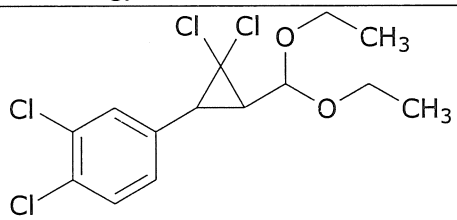
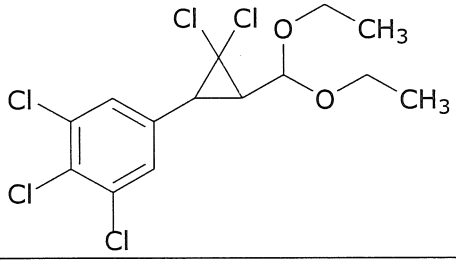
C103		12
C104		12
C105		12
C106		12
C107		25
C108		25
C109		25

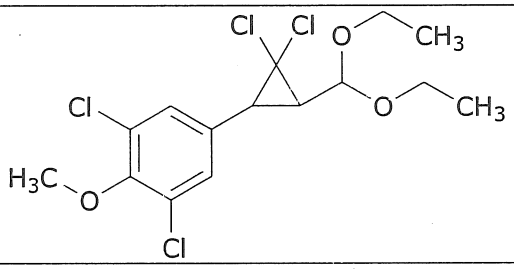
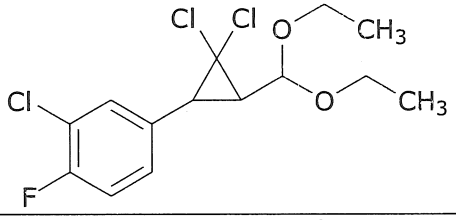
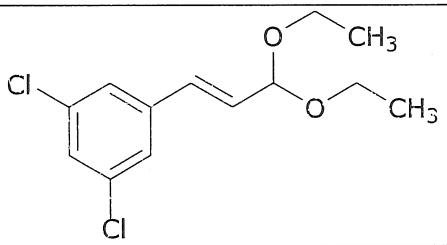
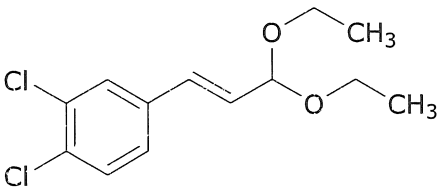
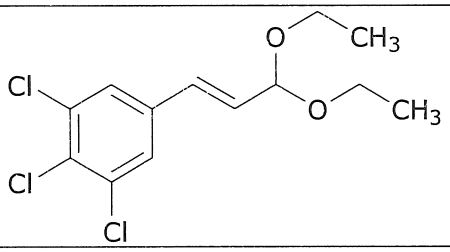
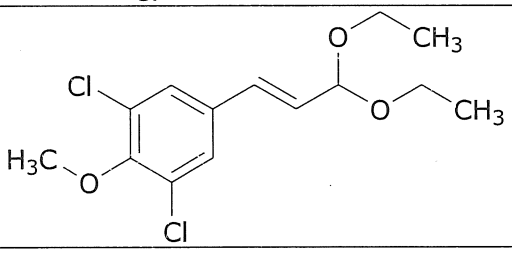
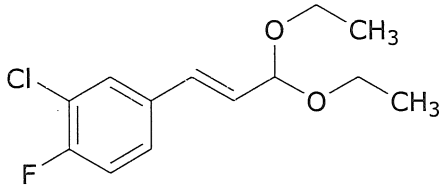
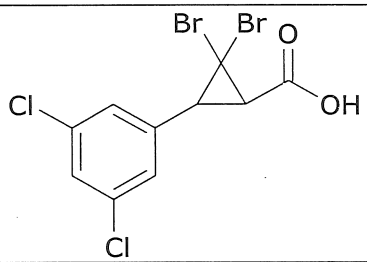
C110		25
C111		25
C112		25
C113		25
C114		25
C115		26
C116		26
C117		26

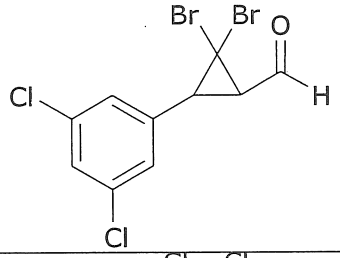
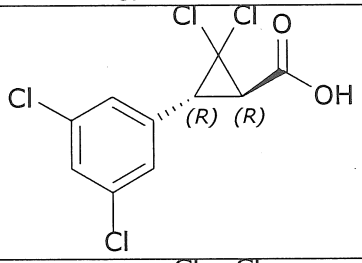
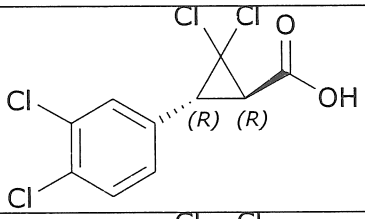
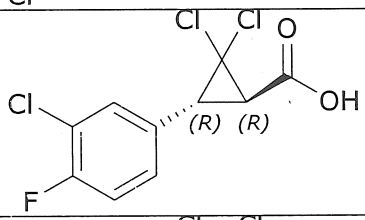
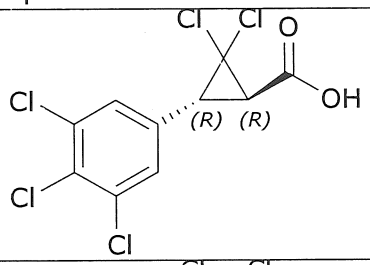
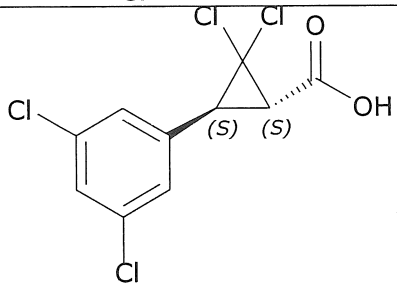
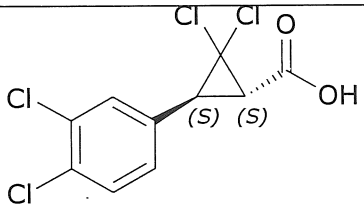
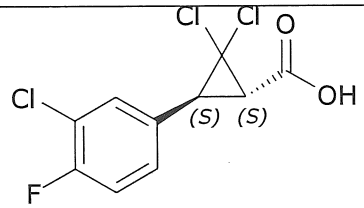
C118		26
C119		26
C120		26
C121		26
C122		26
C123		27
C124		27
C125		27

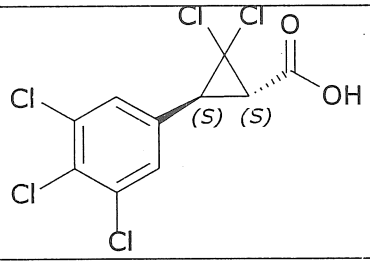
C126		27
C127		27
C128		27
C129		27
C130		27
C131		27
C132		27
C133		27

C134		27
C135		27
C136		27
C137		27
C138		27
C139		27
C140		28

C141		28
C142		28
C143		28
C144		28
C145		29
C146		29
C147		29

C148		29
C149		29
C150		30
C151		30
C152		30
C153		30
C154		30
C155		31

C156		32
C157		33
C158		33
C159		33
C160		33
C161		33
C162		33
C163		33

C164		33

*được điều chế theo số ví dụ

Bảng 4: Dữ liệu phân tích trong thời gian các hợp chất trên Bảng 2

Số	Mp (°C)	IR (cm^{-1})	Khối lượng (*m/z*)	NMR (^1H, ^{13}C, hoặc ^{19}F)
F1	185-187		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{18}H_{14}Cl_5N_2O_2$, 466,9464; được phát hiện là, 466,9472.	^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10,14 (s, 1H), 7,93 (dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,43 (d, *J* = 2,6 Hz, 1H), 7,33 (t, *J* = 1,7 Hz, 1H), 7,27 (d, *J* = 8,8 Hz, 1H), 7,18 (dd, *J* = 1,8, 0,6 Hz, 2H), 6,70 (q, *J* = 4,6 Hz, 1H), 3,50 (d, *J* = 8,2 Hz, 1H), 3,10 (d, *J* = 8,2 Hz, 1H), 3,05 (d, *J* = 4,9 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,32, 162,44, 137,45, 137,32, 137,18, 133,96, 130,01, 127,80, 127,59, 123,87, 120,85, 118,98, 62,04, 38,28, 36,67, 25,85
F2		(màng mỏng) 3274, 3069, 1641	ESIMS 501 ($[M+H]^+$)	^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,09 (s, 1H), 8,45 (q, *J* = 4,5 Hz, 1H), 7,89 - 7,73 (m, 3H), 7,64 (t, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,57 (dd, *J* = 1,9, 0,5 Hz, 2H), 3,64 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 3,55 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 2,76 (d, *J* = 4,6 Hz, 3H)
F3	244-245		ESIMS 499 ($[M-H]^-$)	^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,90 (s, 1H), 9,15 (t, *J* = 6,3 Hz, 1H), 8,16 (br s, 1H), 7,86 (br d, *J* = 8 Hz, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 2H), 7,57 (d, *J* = 2 Hz, 2H), 7,50 (t, *J* = 8 Hz, 1H), 4,16 - 4,04 (m, 2H), 3,62 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 3,55 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H)
F4		(màng mỏng) 3249, 3085, 1654	ESIMS 536 ($[M+H]^+$)	^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,90 (s, 1H), 9,22 (t, *J* = 6,3 Hz, 1H), 7,77 (d, *J* = 2,5 Hz, 1H), 7,73 (dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 1H), 7,59 - 7,53 (m, 2H), 7,52 (d, *J* = 8,7 Hz, 1H), 4,16 - 4,00 (m, 2H), 3,62 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H)
F5		(màng mỏng) 3299, 3076, 1657	ESIMS 593 ($[M+H]^+$)	^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,90 (s, 1H), 8,73 (t, *J* = 6,0 Hz, 1H), 8,63 (t, *J* = 6,3 Hz, 1H), 7,81 (d, *J* = 2,6 Hz, 1H), 7,74 (dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,57 - 7,54 (m, 2H), 7,48 (d, *J* = 8,7 Hz, 1H), 4,02 - 3,94 (m, 2H), 3,93 (d, *J* = 6,2 Hz, 2H), 3,61 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H)
F6	220-223	(màng mỏng) 3270 (w), 3061 (w), 1674 (s), 1591 (m), 1538 (m), 1414 (m), 1367 (m)	ESIMS 543 ($[M+H]^+$)	^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (br s, 1H), 9,11 (br t, *J* = 6 Hz, 1H), 8,58 (d, *J* = 1,7 Hz, 1H), 8,48 (dd, *J* = 4,8, 1,4 Hz, 1H), 7,69-7,79 (m, 3H), 7,63 (t, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,53-7,56 (m, 2H), 7,49 (d, *J* = 8,6 Hz, 1H), 7,39 (ddd, *J* = 8,1, 4,8, 1 Hz, 1H), 4,48 (br d, *J* = 6,7 Hz, 2H), 3,62 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H)

F7	230-232	(màng mỏng) 3280 (w), 3054 (w), 1672 (s), 1593 (m), 1535 (m), 1472 (m), 1414 (m)	ESIMS 578 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,87 (br s, 1H), 9,11 (br t, J = 6 Hz, 1H), 8,58 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,48 (dd, J = 5, 1,5 Hz, 1H), 7,79 (s, 2H), 7,78 - 7,69 (m, 3H), 7,50 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,39 (ddd, J = 7,8, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 4,48 (br d, J = 6 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,52 (d, J = 8,6 Hz, 1H)
F8		(màng mỏng) 3269 (w), 3058 (w), 1703 (w), 1642 (s), 1591 (s), 1554 (s), 1475 (s)	ESIMS 544 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (br s, 1H), 9,11 (br t, J = 6 Hz, 1H), 8,53 (m, 1H), 7,84 - 7,78 (m, 2H), 7,72 (dd, J = 9, 2,5 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,57 - 7,54 (m, 2H), 7,50 (d, J = 9 Hz, 1H), 7,41 (d, J = 8 Hz, 1H), 7,29 (m, 1H), 4,54 (br d, J = 6 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F9		(màng mỏng) 3188 (w), 3053 (w), 1695 (w), 1637 (s), 1609 (w), 1589 (m), 1548 (s), 1473 (s), 1405 (s), 1320 (s)	ESIMS 578 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,89 (br s, 1H), 9,11 (br t, J = 6 Hz, 1H), 8,53 (m, 1H), 7,84 - 7,78 (m, 4H), 7,73 (dd, J = 9, 2,5 Hz, 1H), 7,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,41 (d, J = 8 Hz, 1H), 7,29 (m, 1H), 4,54 (br d, J = 6 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F10		(màng mỏng) 3189 (w), 1659 (s), 1588 (s), 1567 (m), 1544 (s), 1473 (s), 1404 (m), 1323 (m)	ESIMS 511 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,16 - 9,04 (m, 2H), 8,02 (m, 1H), 7,68 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 9 Hz, 1H), 7,35 (t, J = 1,5 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 6,03 (m, 1H), 5,47 - 5,35 (m, 2H), 4,54 (br d, J = 6,7 Hz, 2H), 3,54 (d, J = 8 Hz, 1H), 3,04 (d, J = 8 Hz, 1H)
F11		(màng mỏng) 3195 (w), 1657 (s), 1609 (m), 1587 (m), 1547 (s), 1472 (s), 1404 (s), 1323 (m)	ESIMS 544 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,12 (br s, 2H), 8,03 (m, 1H), 7,70 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 9 Hz, 1H), 7,35 (s, 2H), 6,03 (m, 1H), 5,46 - 5,36 (m, 2H), 4,54 (br d, J = 6,5 Hz, 2H), 3,52 (d, J = 8 Hz, 1H), 3,04 (d, J = 8 Hz, 1H)
F12	57-62	(màng mỏng) 3267 (w), 3062 (w), 1648 (s), 1607 (s), 1588 (s), 1566 (s), 1544 (s), 1473 (s), 1406 (s), 1323 (s)	ESIMS 544 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,90 (br s, 1H), 9,14 (br t, J = 6 Hz, 1H), 8,58 - 8,51 (m, 2H), 7,81 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 2 Hz, 1H), 7,58 - 7,48 (m, 3H), 7,39 - 7,32 (m, 2H), 4,48 (d, J = 6 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F13	136-139	(màng mỏng) 3268 (w), 3032 (w), 1658 (s), 1606 (m), 1590 (s), 1547 (s), 1472 (s), 1413 (s)	ESIMS 578 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,90 (br s, 1H), 9,14 (t, J = 6 Hz, 1H), 8,58 - 8,51 (m, 2H), 7,83 - 7,77 (m, 3H), 7,73 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 2H), 4,48 (d, J = 6 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,54 (d, J = 8,5 Hz, 1H)

F14		(màng mỏng) 3237 (w), 3002 (w), 1650 (s), 1532 (m), 1473 (m)	ESIMS 509 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,60 (br s, 1H), 10,91 (br s, 1H), 7,77 - 7,66 (m, 4H), 7,51 (d, J = 9 Hz, 1H), 7,43 (dd, J = 9, 2 Hz, 1H), 5,99 (m, 1H), 5,38 (m, 1H), 5,30 (d, J = 10,4 Hz, 1H), 4,42 (br d, J = 6 Hz, 2H), 3,60 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,2 Hz, 1H)
F15		(màng mỏng) 3256 (w), 3004 (w), 1660 (s), 1609 (m), 1588 (m), 1548 (s), 1473 (m), 1404 (m), 1325 (m)	ESIMS 557 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11,57 (br s, 1H), 10,89 (br s, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,77 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9, 2,2 Hz, 1H), 7,51 (d, J = 9 Hz, 1H), 3,72 (d, J = 7 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 1,11 (m, 1H), 0,58 - 0,52 (m, 2H), 0,32 - 0,26 (m, 2H)
F16		(màng mỏng) 3252 (w), 3077 (w), 1654 (s), 1609 (m), 1588 (s), 1542 (s), 1473 (s), 1404 (s)	ESIMS 523 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,57 (br s, 1H), 10,89 (br s, 1H), 7,77 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9, 2,5 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,5 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 9 Hz, 1H), 3,72 (d, J = 7 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 1,10 (m, 1H), 0,58 - 0,52 (m, 2H). 0,31 - 0,27 (m. 2H)
F17		(màng mỏng) 3190 (w), 1661 (s), 1605 (m), 1588 (s), 1567 (m), 1544 (s), 1510 (s), 1472 (s), 1403 (s)	ESIMS 577 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,68 (br s, 1H), 10,90 (s, 1H), 7,77 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9, 2,3 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1 Hz, 2H), 7,53 - 7,48 (m, 3H), 7,26 - 7,19 (m, 2H), 4,92 (s, 2H), 3,62 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,6 Hz, 1H)
F18		(màng mỏng) 3186 (w), 1659 (s), 1606 (m), 1587 (m), 1547 (s), 1510 (s), 1472 (m), 1403 (m)	ESIMS 611 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,68 (s, 1H), 10,89 (s, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,77 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9, 2,4 Hz, 1H), 7,54 - 7,48 (m, 3H), 7,26 - 7,20 (m, 2H), 4,92 (s, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F19		(màng mỏng) 3268 (w), 3070 (w), 1639 (m), 1587 (m), 1540 (s), 1509 (s), 1472 (s), 1404 (m), 1320 (m), 1220 (m), 1184 (m)	ESIMS 575 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (br s, 1H), 8,55 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,65 - 7,59 (m, 2H), 7,56 (d, J = 1,3 Hz, 2H), 7,46 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,30 (m, 2H), 7,12 (m, 2H), 3,62 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,44 (m, 2H), 2,81 (t, J = 7 Hz, 2H)
F20		(màng mỏng) 3424 (w), 3275 (w), 3065 (w), 1644 (m), 1588 (m), 1548 (s), 1509 (s), 1472 (m), 1407 (m), 1322 (m), 1222 (m)	ESIMS 609 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (br s, 1H), 8,55 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,30 (m, 2H), 7,12 (m, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,45 (m, 2H), 2,82 (t, J = 7,2 Hz, 2H)

F21		(màng mỏng) 3186 (w), 1658 (m), 1588 (m), 1544 (m), 1473 (s), 1402 (m)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{16}Cl_5F_2N_2O_3$ 558,9538; được tìm thấy 558,9538,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,77 (br s, 1H), 10,99 (s, 1H), 7,80 - 7,69 (m, 2H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,8 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 9 Hz, 1H), 4,03 (m, 1H), 3,89 (m, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,54 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,10 (m, 1H), 1,69 (m, 1H), 1,41 (m, 1H)
F22		(màng mỏng) 3016 (w), 1651 (m), 1588 (m), 1545 (m), 1473 (s), 1401 (m)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{16}Cl_5F_2N_2O_3$ 558,9538; được tìm thấy 558,9540,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,74 (br s, 1H), 11,04 (s, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 3H), 7,68 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,42 (dd, J = 8,8, 2 Hz, 1H), 4,02 (m, 1H), 3,88 (m, 1H), 3,59 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,09 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,40 (m, 1H)
F23	131-133	(màng mỏng) 3016 (w), 1642 (m), 1587 (m), 1548 (m), 1472 (s), 1403 (m)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{15}Cl_6F_2N_2O_3$ 592,9148; được tìm thấy 592,9151,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11,64 (br s, 1H), 11,00 (s, 1H), 7,83 - 7,67 (m, 4H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,01 (m, 1H), 3,88 (m, 1H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,57 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,09 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,40 (m, 1H)
F24	166-168	(màng mỏng) 3247 (w), 3077 (w), 1636 (s), 1588 (s), 1536 (s), 1472 (s), 1404 (s), 1320 (s)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{20}Cl_5N_2O_2$ 520,9934; được tìm thấy 520,9936,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (br s, 1H), 8,47 (br t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,8 Hz, 2H), 7,46 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,29 (m, 2H), 1,41 (q, J = 7 Hz, 2H), 0,76 (m, 1H), 0,45 - 0,39 (m, 2H), 0,10 - 0,05 (m, 2H)
F25	163-165	(màng mỏng) 3248 (m), 3080 (w), 2914 (w), 1648 (s), 1524 (s), 1471 (s)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{20}Cl_5N_2O_2$ 520,9934; được tìm thấy 520,9941,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (br s, 1H), 8,47 (br t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,77 - 7,64 (m, 4H), 7,46 (d, J = 9 Hz, 1H), 7,42 (dd, J = 9, 2 Hz, 1H), 3,59 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,29 (m, 2H), 1,41 (q, J = 7 Hz, 2H), 0,76 (m, 1H), 0,45 - 0,39 (m, 2H), 0,10 - 0,05 (m, 2H)
F26	122-125	(màng mỏng) 3427 (w), 3259 (w), 3069 (w), 3003 (w), 1682 (s), 1659 (s), 1612 (m), 1592 (s), 1549 (s), 1526 (s), 1471 (s), 1412 (s)	HRMS-ESI (TOF) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{19}Cl_6N_2O_2$ 554,9544; được tìm thấy 554,9553,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (br s, 1H), 8,47 (br t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,79 (s, 2H), 7,74 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,7, 2,8 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,29 (m, 2H), 1,41 (q, J = 7 Hz, 2H), 0,75 (m, 1H), 0,45 - 0,39 (m, 2H), 0,10 - 0,05 (m, 2H)
F27	189-190		ESIMS 543 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,07 (s, 1H), 8,01 (t, J = 6,2 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,76 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,48 (s, 3H), 7,42 (t, J = 8,0 Hz, 3H), 7,34 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 7,29 - 7,23 (m, 1H), 4,61 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 3,64 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,40 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, Axeton-d_6) δ 166,95, 163,27, 140,11, 138,68, 138,59, 138,31, 135,60, 131,13, 129,22, 128,73, 128,48, 127,85, 125,82, 122,25, 122,17, 120,62, 120,54, 62,81, 44,01, 40,10, 38,39

F28	126-127			^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,07 (s, 1H), 8,05 (t, J = 6,1 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,52 - 7,44 (m, 5H), 7,41 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,10 (t, J = 8,7 Hz, 2H), 4,60 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 3,64 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,40 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -117,46
F29	197		ESIMS 545 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 12,51 (s, 1H), 10,95 (s, 1H), 7,92 (dd, J = 4,1, 2,5 Hz, 1H), 7,81 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,66 - 7,53 (m, 4H), 7,43 - 7,35 (m, 2H), 7,17 - 7,12 (m, 2H), 7,08 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 3,65 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 163,43, 162,70, 159,33, 137,79, 137,25, 134,05, 133,53, 130,52, 129,56, 127,88, 127,68, 124,57, 122,66, 122,05, 119,53, 112,87, 62,12, 38,44, 36,81
F30	185-187		HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_2$, 508,9934; được phát hiện là, 508,9935,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,48 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,05 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 1,82 (dp, J = 13,2, 6,6 Hz, 1H), 0,92 (d, J = 6,7 Hz, 6H)
F31	158-160		HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{24}Cl_5N_2O_2$, 537,0247; được phát hiện là, 537,0249,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,83 (s, 1H), 8,44 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,46 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,21 (q, J = 6,7 Hz, 2H), 1,49 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,30 (m, 6H), 0,87 (m, 3H)
F32	159-162		HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{24}H_{16}Cl_5F_2N_2O_2$, 578,9590; được phát hiện là, 578,9596,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 9,08 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,41 (m, 2H), 7,21 (s, 1H), 4,44 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F33	158-160		HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{22}Cl_5N_2O_2$, 523,0091; được phát hiện là, 523,0092,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,83 (s, 1H), 8,44 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (d, J = 1,4 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,21 (q, J = 6,6 Hz, 2H), 1,50 (m, 2H), 1,31 (m, 4H), 0,89 (m, 3H)
F34	167-170		HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{26}H_{22}Cl_5N_2O_4$, 602,9990; được phát hiện là, 602,9958,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,75 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,20 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,56 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 6,51 (dd, J = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 4,33 (d, J = 5,8 Hz, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H)

F35	188-191		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{18}Cl_5N_2O_2$, 506,9778; được phát hiện là, 506,9780,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,55 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,14 (t, J = 6,2 Hz, 2H), 1,01 (m, 1H), 0,44 (m, 2H), 0,24 (m, 2H)
F36	222-225		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{28}H_{26}Cl_5N_2O_2$, 599,0405; được phát hiện là, 599,0416,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,98 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 7,73 (m, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,37 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,28 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 4,41 (d, J = 4,4 Hz, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,49 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 1,28 (s, 9H)
F37	192-194		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_5N_3O_2$, 503,9601; được phát hiện là, 503,9606,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (s, 1H), 8,86 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,48 (m, 3H), 2,77 (t, J = 6,4 Hz, 2H)
F38	114-118		HRMS-ESI $[M+NH_4]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_3O_2$, 536,9996; được phát hiện là, 536,9997,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,58 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,30 (m, 2H), 2,57 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 1,81 (p, J = 7,0 Hz, 2H),
F39	72-78		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{19}Cl_5F_3N_2O_3$, 592,9757; được phát hiện là, 592,9766,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,50 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,04 (q, J = 9,4 Hz, 2H), 3,66 (t, J = 6,3 Hz, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,29 (m, 2H), 1,78 (p, J = 6,5 Hz, 2H)
F40	170-172		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_5F_3N_2O_2$, 548,9495; được phát hiện là, 548,9501,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 8,71 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,48 (m, 3H), 2,54 (m, 2H)
F41	199-202		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{25}H_{17}Cl_5F_3N_2O_2$, 610,9652; được phát hiện là, 610,9654,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 9,14 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,72 (m, 3H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,54 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F42	120-128		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{22}Cl_5N_2O_4S$, 586,9710; được phát hiện là, 586,9713,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,76 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,66 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,54 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,82 (s, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,01 (s, 3H), 1,52 (s, 6H)

F43	201-203		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{22}Cl_5N_2O_3$, 551,0040; được phát hiện là, 551,0043,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,53 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (m, 3H), 3,38 (q, J = 5,8 Hz, 2H), 3,26 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 0,99 (m, 1H), 0,45 (m, 2H), 0,18 (m, 2H)
F44	180-183		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{17}Cl_5FN_2O_2$, 512,9683; được phát hiện là, 512,9686,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,56 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,59 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 4,47 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,34 (d, J = 6,1 Hz, 2H), 1,89 (dt, J = 26,0, 6,3 Hz, 2H)
F45	163-165		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_2$, 508,9934; được phát hiện là, 508,9936,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,83 (s, 1H), 8,44 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,4 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,22 (q, J = 6,5 Hz, 2H), 1,49 (p, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (dt, J = 14,7, 7,1 Hz, 2H), 0,91 (t, J = 7,3 Hz, 3H)
F46	194-196		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{16}Cl_5N_2O_2$, 480,9621; được phát hiện là, 480,9628,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,46 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,4 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,25 (p, J = 7,0 Hz, 2H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,59, 162,43, 137,47, 137,45, 137,19, 133,95, 129,97, 127,80, 127,59, 123,86, 120,75, 118,88, 62,04, 38,29, 36,67, 33,74, 14,45
F47	194-196		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_5N_2O_2$, 490,9464; được phát hiện là, 490,9469,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,86 (s, 1H), 8,95 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 2,3 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,03 (m, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,16 (s, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,62, 162,47, 137,48, 137,19, 136,53, 133,95, 130,10, 127,80, 127,59, 123,91, 121,05, 118,93, 80,59, 73,04, 62,03, 38,31, 36,67, 28,19
F48	208-210		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{14}Cl_5F_2N_2O_2$,516,9432; được phát hiện là, 516,9438,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,88 (s, 1H), 8,91 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 8,8, 2,4 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,50 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,13 (tt, J = 55,8, 3,7 Hz, 1H), 3,65 (m, 3H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,61, 162,48, 137,49, 137,18, 136,52, 133,96, 130,11, 127,80, 127,60, 123,84, 121,14, 118,93, 116,10, 114,19, 112,28, 62,03, 41,30, 41,09, 40,89, 38,30, 36,67

F49	96-102		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{13}Cl_5F_5N_2O_2$, 584,9306; được phát hiện là, 584,9323,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,89 (s, 1H), 9,22 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 8,8, 2,4 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,52 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,13 (td, J = 15,5, 6,2 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H)
F50	154-159		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{25}Cl_5N_3O_2$, 550,0384; được phát hiện là, 550,0391,	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,49 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,22 (q, J = 6,2 Hz, 2H), 2,21 (t, J = 6,7 Hz, 2H), 2,10 (s, 6H), 1,47 (m, 4H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,35, 163,01, 138,17, 138,04, 137,77, 134,54, 130,53, 128,39, 128,18, 124,38, 121,31, 119,46, 62,63, 59,21, 45,60, 39,29, 38,87, 37,24, 27,32, 24,87
F51	179-182		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{15}Cl_6N_2O_2$, 514,9231; được phát hiện là, 514,9228,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,87 (s, 1H), 8,75 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,73 (t, J = 6,1 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,56 (m, 2H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,21, 162,46, 137,48, 137,19, 136,92, 133,95, 130,06, 127,80, 127,59, 123,85, 121,01, 118,93, 62,05, 42,98, 40,97, 38,29, 36,66
F52	147-150		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_2S$, 526,9498; được phát hiện là, 526,9498,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,60 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,42 (q, J = 6,3 Hz, 2H), 2,64 (t, J = 7,0 Hz, 2H), 2,11 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,91, 162,44, 137,45, 137,19, 133,95, 130,02, 127,80, 127,59, 123,86, 120,90, 118,93, 62,05, 38,29, 38,20, 36,66, 32,41, 14,45
F53	165-167		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_3$, 510,9727; được phát hiện là, 510,9729,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 8,53 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,45 (t, J = 5,8 Hz, 2H), 3,38 (q, J = 5,4 Hz, 2H), 3,28 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,01, 162,43, 137,42, 137,25, 137,19, 133,95, 129,97, 127,80, 127,59, 123,86, 120,81, 118,91, 70,15, 62,04, 57,83, 38,69, 38,29, 36,66

F54	77-85		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_3$, 524,9883; được phát hiện là, 524,9890,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,52 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,48 (m, 5H), 3,38 (q, J = 5,9 Hz, 2H), 1,12 (t, J = 7,0 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,01, 162,42, 137,42, 137,27, 137,19, 133,95, 129,97, 127,80, 127,59, 123,86, 120,83, 118,94, 67,99, 65,27, 62,05, 38,29, 36,66, 15,02
F55	156-160		ESIMS 538 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 8,48 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,90 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,28 (m, 2H), 3,19 (q, J = 6,3 Hz, 2H), 1,81 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 169,26, 165,99, 162,45, 137,43, 137,18, 137,16, 133,96, 130,00, 127,80, 127,59, 123,89, 120,99, 119,04, 62,05, 38,72, 38,25, 38,05, 36,67, 22,55
F56	187-190		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_2$, 494,9778; được phát hiện là, 494,9779,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,84 (s, 1H), 8,45 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,19 (q, J = 6,7 Hz, 2H), 1,52 (h, J = 7,2 Hz, 2H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,83, 162,43, 137,59, 137,45, 137,19, 133,95, 129,95, 127,80, 127,59, 123,81, 120,70, 118,88, 62,04, 40,56, 38,30, 36,65, 22,13, 11,31
F57	94-99		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{17}Cl_6N_2O_2$, 528,9388; được phát hiện là, 528,9388,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,57 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,72 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,36 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 1,97 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,02, 162,46, 137,48, 137,28, 137,18, 133,95, 129,99, 127,80, 127,59, 123,79, 120,87, 118,88, 62,04, 42,76, 38,29, 36,66, 36,31, 31,85
F58	64-69		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{24}Cl_5N_2O_4$, 569,0146; được phát hiện là, 569,0155,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,84 (s, 1H), 8,45 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,47 (m, 7H), 3,28 (q, J = 6,5 Hz, 2H), 3,24 (s, 3H), 1,73 (p, J = 6,6 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,83, 162,44, 137,46, 137,45, 137,19, 133,96, 129,97, 127,80, 127,59, 123,83, 120,79, 118,90, 71,15, 69,29, 67,90, 62,05, 57,95, 38,29, 36,66, 36,17, 29,11

F59	205-208		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_5F_3N_2O_2$, 548,9504; được phát hiện là, 548,9495,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,90 (s, 1H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,2 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,56 (d, J = 10,7 Hz, 3H), 4,40 (d, J = 44,7 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,49 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,92 (s, 3H)
F60	97-103		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{15}Cl_5F_5N_2O_2$, 598,9463; được phát hiện là, 598,9469,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,86 (s, 1H), 8,73 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,54 (q, J = 6,6 Hz, 2H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,50 (dd, J = 3,7, 1,8 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,60, 163,05, 138,09, 137,76, 137,36, 134,54, 130,67, 128,38, 128,17, 124,44, 121,67, 119,43, 62,62, 38,87, 37,24, 31,99, 29,73, 29,57, 29,41
F61	109-112		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{13}Cl_5F_7N_2O_2$, 634,9275; được phát hiện là, 634,9278,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,89 (s, 1H), 9,23 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,17 (td, J = 16,4, 6,1 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,81, 162,52, 137,57, 137,19, 136,11, 133,96, 130,22, 127,81, 127,60, 123,79, 121,33, 118,85, 62,04, 38,33, 36,66
F62	108-112		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_2$, 508,9934; được phát hiện là, 508,9939,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 7,65 (m, 3H), 7,55 (t, J = 1,6 Hz, 2H), 7,51 (dd, J = 8,8, 2,9 Hz, 1H), 3,62 (dd, J = 8,5, 3,3 Hz, 1H), 3,48 (m, 2H), 3,05 (dt, J = 22,6, 7,0 Hz, 1H), 2,98 (s, 1,4H), 2,77 (s, 1,6H), 1,61 (h, J = 7,2 Hz, 1H), 1,48 (m, 1H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 1,6H), 0,70 (t, J = 7,4 Hz, 1,4H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,54, 162,51, 137,96, 137,70, 137,19, 136,86, 136,52, 133,95, 129,89, 127,81, 127,59, 123,16, 122,89, 120,57, 118,11, 117,64, 62,03, 59,64, 51,19, 47,50, 39,91, 38,31, 36,71, 36,66, 35,39, 31,52, 20,66, 20,49, 19,53, 13,98, 11,05, 10,71
F63	109-113		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_2$, 494,9778; được phát hiện là, 494,9781,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,62 (m, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,51 (dd, J = 8,8, 2,5 Hz, 1H), 3,61 (dd, J = 8,5, 3,2 Hz, 1H), 3,48 (m, 2H), 3,11 (m, 1H), 2,98 (s, 1,6H), 2,77 (s, 1,4H), 1,14 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H), 1,04 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,27, 166,09, 162,53, 137,94, 137,75, 137,19, 136,70, 136,58, 133,95, 129,93, 129,87, 127,81, 127,59, 123,08, 123,00, 120,60, 117,63, 62,03, 59,64, 44,55, 40,91, 38,28, 36,71, 34,83, 31,07, 20,66, 13,98, 13,04, 11,65

F64	95-99		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{17}Cl_5F_3N_2O_2$, 562,9651; được phát hiện là, 562,9652,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,65 (m, 3H), 7,54 (m, 3H), 3,73 (s, 1,4H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,49 (m, 1H), 3,36 (m, 0,6H), 3,02 (s, 0,9H), 2,82 (s, 2,1H), 2,64 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,79, 166,62, 162,52, 137,97, 137,83, 137,19, 136,16, 135,76, 133,96, 129,94, 127,80, 127,60, 125,58, 123,02, 122,96, 120,83, 118,19, 117,60, 62,03, 59,64, 38,29, 36,71, 35,61, 31,46, 29,98, 29,76, 20,66, 13,98
F65	88-95		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{16}Cl_5N_2O_2$, 504,9621; được phát hiện là, 504,9620,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,88 (s, 1H), 7,70 (m, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,54 (m, 3H), 4,34 (s, 1,1H), 3,94 (m, 0,9H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,49 (m, 1H), 3,34 (t, J = 2,3 Hz, 0,4H), 3,29 (t, J = 2,5 Hz, 0,6H), 3,05 (s, 1H), 2,84 (s, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,39, 166,35, 162,56, 162,51, 137,98, 137,87, 137,18, 135,67, 135,47, 133,95, 130,06, 130,03, 127,81, 127,59, 123,19, 123,09, 120,95, 117,65, 78,63, 78,11, 75,69, 74,50, 62,02, 38,29, 36,71, 35,08, 34,87, 31,49
F66	89-94		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_5N_3O_2$, 505,9574; được phát hiện là, 505,9584,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,91 (m, 1H), 7,76 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,56 (m, 3H), 4,63 (s, 1,4H), 4,36 (dd, J = 22,2, 5,5 Hz, 0,6H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (m, J = 8,0 Hz, 1H), 3,09 (s, 0,7H), 2,90 (s, 2,3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 167,24, 162,60, 138,04, 137,16, 134,71, 133,96, 130,12, 127,80, 127,60, 123,12, 121,33, 117,77, 116,08, 62,01, 38,28, 36,73, 35,97, 34,68
F67	224-226		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_3$, 524,9883; được phát hiện là, 524,9885,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,84 (m, 1H), 7,57 (m, 6H), 3,60 (m, 3H), 3,48 (m, 2H), 3,30 (s, 1,7H), 3,26 (m, 1H), 3,15 (s, 1,3H), 3,02 (s, 1,4H), 2,82 (s, 1,6H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,92, 166,66, 162,51, 162,45, 137,94, 137,65, 137,19, 136,59, 136,37, 133,95, 129,92, 129,69, 127,81, 127,59, 123,13, 122,95, 120,64, 120,59, 117,62, 69,27, 62,06, 62,03, 57,99, 57,96, 54,81, 49,02, 45,73, 38,29, 36,65, 36,61
F68	94-99		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{20}Cl_5N_2O_2S$, 540,9655; được phát hiện là, 540,9669,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,86 (m, 1H), 7,76 (m, 0,5H), 7,65 (m, 2,5H), 7,55 (m, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (m, 2H), 3,49 (m, 1H), 3,26 (m, 1H), 3,01 (s, 1,4H), 2,81 (s, 1,6H), 2,75 (t, J = 7,0 Hz, 1H), 2,63 (m, 1H), 2,14 (s, 1,5H), 1,75 (d, J = 6,4 Hz, 1,5H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,70, 162,51, 137,93, 137,76, 137,19, 136,53, 136,16, 133,95, 129,90, 129,81, 127,81, 127,59, 123,11, 122,94, 120,73, 120,68, 118,58, 117,70, 62,03, 44,98, 38,29, 36,70, 36,63, 35,74, 31,69, 30,89, 30,01, 14,44, 14,11

F69			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{20}Cl_5N_2O_2$, 520,9934; được phát hiện là, 520,9936,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,86 (s, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,55 (m, 2H), 7,51 (m, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 3,07 (s, 1,5H), 2,95 (m, 1H), 2,84 (s, 1,5H), 1,08 (m, 0,5H), 0,86 (m, 0,5H), 0,48 (m, 2H), 0,30 (m, 1H), 0,07 (m, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,48, 166,27, 162,52, 137,95, 137,74, 137,19, 136,74, 136,49, 133,95, 129,91, 127,81, 127,59, 123,14, 122,95, 120,58, 117,62, 62,03, 54,10, 49,91, 38,30, 36,68, 35,51, 31,85, 9,44, 8,89, 3,40, 3,30, 2,97, 2,84
F70	105-110		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{18}Cl_5F_2N_2O_2$, 556,9746; được phát hiện là, 556,9754	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 8,64 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,37 (t, J = 5,7 Hz, 2H), 2,63 (m, 2H), 2,40 (m, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,29, 162,46, 137,50, 137,30, 137,18, 133,96, 130,01, 127,80, 127,59, 123,75, 120,91, 118,82, 62,04, 42,34, 38,29, 37,82, 37,65, 37,47, 36,66, 22,56, 22,50, 22,46, 22,41
F71	114-121		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{16}Cl_5F_2N_2O_2$, 542,9589; được phát hiện là, 542,9591,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,88 (m, 1H), 7,79 (m, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 3,93 (t, J = 13,1 Hz, 1H), 3,74 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 3,61 (m, 2H), 3,49 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,40 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 2,50 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 170,22, 165,39, 165,23, 162,56, 137,96, 137,17, 135,96, 135,45, 133,96, 130,20, 130,12, 127,80, 127,61, 127,38, 123,01, 122,80, 121,30, 118,06, 117,91, 62,04, 59,64, 38,25, 36,73, 20,66, 13,98
F72	115-118		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{17}Cl_5F_3N_2O_2$, 562,9651; được phát hiện là, 562,9653,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,85 (s, 1H), 8,59 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,30 (m, 2H), 2,34 (ddt, J = 14,8, 9,1, 3,3 Hz, 2H), 1,74 (dt, J = 14,7, 6,9 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,05, 162,47, 137,52, 137,27, 137,18, 133,96, 130,02, 127,81, 127,60, 123,75, 120,90, 118,84, 62,04, 59,64, 38,30, 37,62, 36,66, 30,50, 30,28, 30,06, 29,84, 21,60, 20,66, 13,98
F73	103-108		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{20}Cl_5F_2N_2O_2$, 570,9903; được phát hiện là, 570,9908,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,86 (m, 1H), 7,74 (d, J = 2,3 Hz, 0,3H), 7,68 (d, J = 2,5 Hz, 0,7H), 7,63 (m, 2H), 7,55 (m, 2H), 7,52 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,83 (s, 0,6H), 3,62 (m,1H), 3,49 (m, 1,6H), 3,25 (m, 0,7H), 2,99 (s, 0,9H), 2,79 (s, 2H), 2,69 (m, 1,6H), 2,55 (m, 1,3H), 2,45 (m, 1,4H), 2,17 (m, 0,9H)

F74	108-111		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_3S$, 542,9447; được phát hiện là, 542,9444,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,88 (s, 1H), 8,76 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,76 (m, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,63 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,60 (m, 3H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,04 (dt, J = 13,9, 7,2 Hz, 1H), 2,89 (dt, J = 12,7, 6,2 Hz, 1H), 2,62 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,08, 162,46, 137,48, 137,18, 136,88, 133,95, 130,05, 127,80, 127,59, 123,87, 121,04, 118,92, 62,05, 52,82, 38,26, 38,06, 36,66, 33,07
F75	104-108		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{18}Cl_5N_2O_4S$, 558,9396; được phát hiện là, 558,9402,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ10,87 (s, 1H), 8,74 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,64 (m, 3H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,37 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,06 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,09, 162,47, 137,48, 137,18, 136,68, 133,96, 130,07, 127,80, 127,59, 123,89, 121,17, 118,99, 62,05, 52,60, 40,61, 38,25, 36,67, 33,05
F78	107-112		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{17}Cl_5N_2O_3$, 507,9682; được phát hiện là, 507,9679,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,41 (t, J = 5,8 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,4 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,70 (d, J = 4,8 Hz, 1H), 3,76 (dt, J = 11,5, 6,0 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,22 (m, 1H), 3,14 (m, 1H), 1,10 (d, J = 6,2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,96, 162,42, 137,42, 137,40, 137,19, 133,95, 129,95, 127,80, 127,59, 123,84, 120,78, 119,00, 64,97, 62,05, 46,63, 38,29, 36,66, 21,07
F79	233-236		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{19}Cl_5N_4O_3$, 561,9900; được phát hiện là, 561,9911,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,54 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,62 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,42 (m, 2H), 3,35 (d, J = 6,2 Hz, 2H), 3,22 (m, 4H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,95, 162,44, 162,11, 137,43, 137,25, 137,19, 133,95, 129,99, 127,80, 127,59, 123,88, 120,92, 118,95, 62,06, 44,69, 42,51, 38,26, 37,43, 36,67
F84	187-190		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{19}Cl_5N_2O_3$, 521,9839; được phát hiện là, 521,9838,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,83 (s, 1H), 8,45 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,61 (s, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,56 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,19 (q, J = 6,4 Hz, 2H), 1,52 (h, J = 7,3 Hz, 2H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,83, 162,47, 151,07, 137,59, 137,47, 131,36, 129,95, 129,65, 128,10, 123,79, 120,70, 118,87, 62,13, 60,57, 40,57, 38,40, 36,28, 22,14, 11,32

F85	206-208		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{17}Cl_5N_2O_3$, 507,9682; được phát hiện là, 507,9687,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,83 (s, 1H), 8,46 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,61 (s, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,56 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,25 (p, J = 6,9 Hz, 2H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,60, 162,48, 151,07, 137,47, 131,36, 129,97, 129,65, 128,11, 123,85, 120,74, 118,88, 62,12, 60,57, 38,40, 36,29, 33,74, 14,45
F86	185-188		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{16}Cl_5FN_2O_3$, 525,9588; được phát hiện là, 525,9602,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,73 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,7, 2,5 Hz, 1H), 7,61 (s, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,53 (dt, J = 47,5, 5,0 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,56 (m, 2H), 3,52 (m, 1H), 3,45 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,25, 162,50, 151,07, 137,47, 137,01, 131,36, 130,03, 129,65, 128,11, 123,85, 120,93, 118,92, 82,58, 81,26, 62,12, 60,57, 38,40, 36,29; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ 19,95, 19,89, 19,85, 19,83, 19,79, 19,75, 19,73, 19,69, 19,63
F87	193-196		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_5F_3N_2O_3$, 561,9399; được phát hiện là, 561,9403,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (s, 1H), 9,21 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 8,8, 2,1 Hz, 1H), 7,61 (s, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,08 (dt, J = 17,4, 9,5 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,57 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,46 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,62, 162,56, 151,07, 137,56, 136,15, 131,35, 130,19, 129,65, 128,11, 125,65, 123,77, 123,43, 121,28, 118,83, 62,11, 60,57, 38,42, 36,28; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -70,42, -70,44, -70,46
F88	181-185		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{21}H_{16}Cl_5F_3N_2O_3$, 575,9556; được phát hiện là, 575,9562,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,71 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 7,60 (s, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,56 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,46 (t, J = 8,2 Hz, 3H), 2,54 (dd, J = 11,5, 6,5 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,00, 162,50, 151,07, 137,51, 136,84, 131,36, 130,07, 129,99, 129,65, 128,11, 127,78, 125,58, 123,84, 123,37, 121,03, 118,83, 62,13, 60,57, 38,39, 36,28, 32,43, 32,30, 32,09, 31,87, 30,85, 28,37, 24,68, 21,96; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -63,75, -63,77, -63,79

F91	254-260		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{14}Cl_6N_2O_2$, 511,9186; được phát hiện là, 511,9189,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,99 (s, 1H), 8,57 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 8,01 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,26 (p, J = 6,3 Hz, 2H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 164,90, 162,85, 139,55, 138,13, 137,08, 133,97, 132,00, 127,82, 127,63, 122,06, 120,30, 117,36, 61,93, 38,36, 36,72, 33,81, 14,36
F92	235-237		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{13}Cl_6FN_2O_2$, 529,9092; được phát hiện là, 529,9093,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 11,01 (s, 1H), 8,86 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 8,04 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,62 (m, 2H), 7,56 (d, J = 1,4 Hz, 2H), 4,54 (dt, J = 47,5, 4,9 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,54 (m, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,56, 162,87, 139,11, 138,15, 137,08, 133,97, 132,05, 127,82, 127,63, 122,05, 120,46, 117,41, 82,58, 81,26, 61,93, 54,80, 38,37, 36,72; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -69,39, -70,90
F93	210-213		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{11}Cl_6F_3N_2O_2$, 565,8904; được phát hiện là, 565,8902,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO) δ 11,04 (s, 1H), 9,33 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 8,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,56 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 4,11 (dt, J = 16,4, 8,5 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -70,42, -70,44, -70,46
F94	185-189		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{13}Cl_6F_3N_2O_2$, 579,9060; được phát hiện là, 579,9043,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 11,01 (s, 1H), 8,83 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 8,04 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,60 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (m, 3H), 2,56 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,31, 162,88, 138,95, 138,19, 137,08, 133,97, 132,11, 129,99, 127,82, 127,78, 127,63, 125,58, 123,38, 122,04, 120,56, 117,32, 61,95, 38,36, 36,71, 32,56, 32,53, 32,50, 32,47, 32,45, 32,24, 32,02, 31,81; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -63,71, -63,74, -63,76
F95	224-227		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{16}Cl_6N_2O_2$, 525,9343; được phát hiện là, 525,9348,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 11,00 (s, 1H), 8,57 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 8,02 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,63 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,20 (q, J = 6,5 Hz, 2H), 1,52 (h, J = 7,2 Hz, 2H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,15, 162,86, 139,66, 138,14, 137,08, 133,97, 131,99, 127,82, 127,63, 122,00, 120,26, 117,36, 61,94, 40,61, 38,36, 36,71, 22,07, 11,30

F96			ESIMS 575 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,11 (s, 1H), 8,02 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,56 - 7,45 (m, 5H), 7,39 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,15 - 7,04 (m, 2H), 5,28 (p, J = 7,2 Hz, 1H), 3,64 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,40 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 1,56 (d, J = 7,0 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, Acetone) δ -117,60, -117,61, -117,63
F97			ESIMS 589 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,10 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 - 7,70 (m, 2H), 7,64 - 7,55 (m, 2H), 7,59 - 7,46 (m, 3H), 7,39 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,08 (t, J = 8,8 Hz, 2H), 3,65 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,41 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 1,78 (d, J = 2,0 Hz, 6H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -119,11
F98	158-163		HRMS-ESI [M+]$^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{14}Cl_6N_2O_2$, 511,9186; được phát hiện là, 511,9187,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,32 (s, 1H), 8,52 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 3,81 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,24 (p, J = 7,0 Hz, 2H), 1,10 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 164,72, 163,26, 137,15, 136,23, 133,96, 133,59, 129,95, 127,72, 127,61, 126,47, 126,20, 124,21, 62,38, 37,21, 37,07, 33,83, 14,36
F99	140-145		HRMS-ESI [M+]$^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{13}Cl_6FN_2O_2$, 529,9092; được phát hiện là, 529,9092,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,33 (s, 1H), 8,81 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,63 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 4,52 (dt, J = 47,4, 5,0 Hz, 2H), 3,81 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (dq, J = 27,1, 5,3 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,38, 163,27, 137,15, 135,78, 133,96, 133,61, 130,02, 127,72, 127,61, 126,69, 126,21, 124,25, 82,56, 81,24, 62,38, 37,21, 37,08; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ 20,05, 19,99, 19,95, 19,93, 19,89, 19,85, 19,83, 19,79, 19,73
F100	175-179		HRMS-ESI [M+]$^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{11}Cl_6F_3N_2O_2$, 565,8904; được phát hiện là, 565,8905,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,36 (s, 1H), 9,27 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,63 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 4,08 (m, 2H), 3,82 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,79, 163,34, 137,15, 134,92, 133,96, 133,74, 130,19, 127,81, 127,72, 127,61, 127,04, 126,12, 125,59, 124,09, 123,37, 121,15, 62,39, 37,23, 37,09; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -70,38, -70,40, -70,43

F101	186-190		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{16}Cl_6N_2O_2$, 525,9343; được phát hiện là, 525,9348,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,32 (s, 1H), 8,52 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 3,81 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,18 (q, J = 6,4 Hz, 2H), 1,51 (h, J = 7,3 Hz, 2H), 0,90 (t, J = 7,4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ164,95, 163,26, 137,16, 136,34, 133,95, 133,60, 129,93, 127,72, 127,60, 126,41, 126,13, 124,18, 62,39, 40,65, 37,21, 37,05, 22,06, 11,30
F102	190-195		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{13}Cl_6F_3N_2O_2$, 579,9060; được phát hiện là, 579,9060,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,34 (s, 1H), 8,78 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,63 (t, J = 1,6 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 3,82 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,46 (q, J = 6,6 Hz, 2H), 2,53 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,13, 163,27, 137,15, 135,58, 133,96, 133,65, 130,09, 129,95, 127,74, 127,72, 127,61, 126,84, 126,23, 125,54, 124,24, 123,34, 62,39, 37,20, 37,06, 32,54, 32,51, 32,47, 32,26, 32,04, 31,83; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -63,79, -63,82, -63,84
F103	162-165		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{15}Cl_4FN_2O_2$, 461,9872; được phát hiện là, 461,9873,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,87 (s, 1H), 8,46 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 7,1, 1,9 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,46 (m, 3H), 3,57 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,42 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,25 (p, J = 6,6 Hz, 2H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,60, 162,56, 157,73, 155,76, 137,46, 130,97, 130,93, 130,90, 129,97, 129,72, 129,66, 123,85, 120,75, 119,43, 119,29, 118,89, 116,89, 116,72, 62,20, 38,42, 36,48, 33,74, 14,45; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -117,27, -117,28, -117,29, -117,30, -117,31
F104	188-191		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{14}Cl_4F_2N_2O_2$, 479,9777; được phát hiện là, 479,9779,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,89 (s, 1H), 8,74 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (m, 2H), 7,47 (m, 3H), 4,53 (dt, J = 47,5, 5,0 Hz, 2H), 3,54 (dd, J = 31,2, 6,4 Hz, 3H), 3,42 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,26, 162,58, 157,73, 155,76, 137,48, 137,00, 130,97, 130,93, 130,90, 130,03, 129,73, 129,66, 123,86, 120,94, 119,44, 119,29, 118,93, 116,89, 116,72, 82,59, 81,27, 62,20, 38,43, 36,49; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ 19,95, 19,89, 19,85, 19,83, 19,79, 19,75, 19,73, 19,69, 19,63, -117,27, -117,28, -117,29, -117,30, -117,31

F105	190-193		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{19}H_{12}Cl_4F_4N_2O_2$, 515,9589; được phát hiện là, 515,9593,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,93 (s, 1H), 9,22 (t, J = 6,3 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 7,1, 1,8 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,46 (m, 2H), 4,09 (m, 2H), 3,58 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,42 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,63, 162,65, 157,74, 155,78, 137,58, 136,15, 130,98, 130,92, 130,90, 130,20, 129,73, 129,67, 127,89, 125,66, 123,80, 123,44, 121,31, 121,22, 119,45, 119,31, 118,85, 116,90, 116,73, 62,20, 38,46, 36,50; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -70,43, -70,45, -70,47, -117,25, -117,27, -117,28, -117,30
F106	171-174		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{17}Cl_4FN_2O_2$, 476,0028; được phát hiện là, 476,0026,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,87 (s, 1H), 8,45 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (m, 2H), 7,46 (m, 3H), 3,58 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,42 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,19 (m, 2H), 1,52 (h, J = 7,2 Hz, 2H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,84, 162,56, 157,73, 155,77, 137,59, 137,47, 130,97, 130,93, 130,90, 129,95, 129,73, 129,66, 123,81, 120,72, 119,44, 119,30, 118,89, 116,89, 116,72, 62,20, 40,57, 38,43, 36,48, 22,14, 11,32; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -117,26, -117,28, -117,29, -117,31
F107	86-92		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_4F_4N_2O_2$, 529,9749; được phát hiện là, 529,9746,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,89 (s, 1H), 8,71 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,69 (m, 2H), 7,47 (m, 3H), 3,58 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,47 (q, J = 6,4 Hz, 2H), 3,42 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,54 (m, 2H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -63,74, -63,77, -63,79, -117,27, -117,28, -117,30, -117,31
F108			ESIMS 503 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,82 - 7,74 (m, 1H), 7,49 - 7,36 (m, 2H), 7,40 - 7,25 (m, 2H), 4,27 - 4,14 (m, 2H), 3,65 - 3,58 (m, 1H), 3,33 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,58, -72,59, -139,57, -139,63, -140,84
F109			ESIMS 580 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,14 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,84 - 7,73 (m, 2H), 7,61 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,51 - 7,41 (m, 2H), 4,21 (qd, J = 9,4, 6,5 Hz, 2H), 3,63 (dt, J = 8,2, 0,7 Hz, 1H), 3,37 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,54, -72,54, -72,55, -72,55, -72,56
F111			ESIMS 624 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,14 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,83 - 7,72 (m, 3H), 7,50 - 7,35 (m, 2H), 4,20 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,61 (dt, J = 8,3, 0,8 Hz, 1H), 3,36 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,55

F112			ESIMS 552 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,21 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,85 - 7,74 (m, 2H), 7,58 - 7,48 (m, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,4, 6,5 Hz, 2H), 3,77 - 3,70 (m, 1H), 3,46 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -61,78, -61,79, -61,81, -61,82, -61,82, -72,57, -72,58, -72,58, -72,59, -72,60, -116,26, -116,30, -116,33, -116,36
F113			ESIMS 563 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,82 - 7,74 (m, 1H), 7,71 (dd, J = 8,3, 7,3 Hz, 1H), 7,51 - 7,35 (m, 2H), 7,30 - 7,22 (m, 1H), 4,20 (qd, J = 9,4, 6,5 Hz, 2H), 3,62 (dd, J = 8,3, 0,8 Hz, 1H), 3,36 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,59, -72,60, -108,83
F114			ESIMS 613 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,17 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,23 (d, J = 13,2 Hz, 0H), 8,01 - 7,84 (m, 3H), 7,78 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 7,68 (ddt, J = 8,2, 1,7, 0,8 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,20 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,73 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,47 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -62,89, -62,90, -72,60, -72,61
F115			ESIMS 613 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,95 - 7,85 (m, 3H), 7,82 - 7,72 (m, 1H), 7,67 (dd, J = 8,4, 2,2 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,27 - 4,13 (m, 2H), 3,71 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,44 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -63,00, -63,00, -63,00, -72,60, -72,61
F116			ESIMS 569 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,18 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,96 - 7,85 (m, 2H), 7,83 - 7,74 (m, 2H), 7,64 (ddt, J = 8,2, 1,7, 0,9 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,73 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,47 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -62,87, -62,88, -62,88, -62,89, -62,89, -62,90, -62,90, -62,91, -72,60, -72,61, -72,61, -72,63
F117			ESIMS 568 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (dd, J = 4,1, 2,2 Hz, 2H), 7,83 - 7,69 (m, 3H), 7,45 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,4, 6,5 Hz, 2H), 3,73 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,44 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -63,00, -72,59
F118			ESIMS 563 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,13 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,81 - 7,71 (m, 2H), 7,55 - 7,41 (m, 2H), 7,33 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,62 (dd, J = 8,3, 0,9 Hz, 1H), 3,34 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,55, -72,57, -110,10

F119			ESIMS 552 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,17 (s, 1H), 8,25 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 7,87 - 7,74 (m, 3H), 7,53 - 7,41 (m, 2H), 4,28 - 4,14 (m, 2H), 3,75 - 3,68 (m, 1H), 3,43 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -61,84, -61,87, -61,87, -72,58, -117,54, -117,58
F120			ESIMS 519 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,81 - 7,73 (m, 1H), 7,57 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,51 - 7,38 (m, 2H), 7,31 (ddt, J = 8,3, 1,9, 0,8 Hz, 1H), 4,20 (qd, J = 9,4, 6,5 Hz, 2H), 3,63 (dd, J = 8,3, 0,8 Hz, 1H), 3,35 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,57, -72,57, -72,58, -72,58, -116,92, -116,93
F121			ESIMS 502 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,20 - 7,09 (m, 2H), 7,05 (tt, J = 9,1, 2,4 Hz, 1H), 4,27 - 4,13 (m, 2H), 3,65 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,58, -72,59, -72,59, -72,60, -110,72, -110,98, -110,98, -110,99
F122			ESIMS 552 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,8, 2,7 Hz, 1H), 7,69 (dt, J = 1,8, 1,0 Hz, 1H), 7,58 (ddt, J = 24,9, 8,6, 2,0 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,77 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,49 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -63,21, -72,60, -72,60, -111,80
F123			ESIMS 563 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,13 (s, 1H), 8,24 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,50 - 7,37 (m, 2H), 7,30 (dt, J = 9,5, 1,9 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,66 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,40 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,54, -72,56, -111,81
F124			ESIMS 613 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,13 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 8,01 - 7,88 (m, 3H), 7,84 (s, 1H), 7,78 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,21 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,77 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -63,23, -63,24, -72,60, -72,61

F125			ESIMS 532 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,13 (s, 1H), 8,22 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,30 - 7,02 (m, 2H), 4,20 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,99 (d, J = 1,1 Hz, 3H), 3,58 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,31 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,61, -129,67
F126			ESIMS 520 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,41 - 7,27 (m, 2H), 4,20 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,74 - 3,48 (m, 1H), 3,37 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,61, -136,27, -163,62
F127			ESIMS m/z 520 ([M+H]+)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,05 (s, 1H), 8,43 - 8,04 (m, 1H), 7,79 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,8, 2,7 Hz, 1H), 7,41 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,36 - 7,22 (m, 2H), 4,35 - 4,11 (m, 2H), 3,54 (d, J = 11,3 Hz, 1H), 3,25 (d, J = 11,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,51, -137,68, -164,86
F128			HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_4F_5N_2O_2$, 548,9724; được phát hiện là, 548,9720,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,6, 1,2 Hz, 1H), 7,77 (ddd, J = 8,8, 2,7, 1,2 Hz, 1H), 7,68 (tt, J = 1,9, 0,9 Hz, 1H), 7,63 (p, J = 1,4 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,96 (t, J = 55,8 Hz, 1H), 4,27 - 4,09 (m, 2H), 3,71 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,45 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,57 (t, J = 9,6 Hz), -112,20 (dd, J = 55,8, 14,2 Hz)
F129			HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_4F_5N_2O_2$, 548,9724; được phát hiện là, 548,9719,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,22 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,7, 1,2 Hz, 1H), 7,77 (ddd, J = 8,7, 2,6, 1,1 Hz, 1H), 7,76 - 7,73 (m, 1H), 7,66 - 7,57 (m, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,14 (t, J = 54,5 Hz, 1H), 4,25 - 4,14 (m, 2H), 3,69 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,41 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -116,25 (d, J = 54,7 Hz)
F130			HRMS-ESI [M+H]$^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_3F_6N_2O_2$, 533,0020; được phát hiện là, 533,0013,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,6, 1,2 Hz, 1H), 7,78 (ddd, J = 8,8, 2,7, 1,2 Hz, 1H), 7,53 (q, J = 1,1 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,47 - 7,41 (m, 1H), 7,38 (ddd, J = 8,9, 2,6, 1,3 Hz, 1H), 6,97 (t, J = 55,8 Hz, 1H), 4,25 - 4,14 (m, 2H), 3,71 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,43 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,59 (t, J = 9,4 Hz), -112,06 (dd, J = 55,8, 14,3 Hz), -112,93 (t, J = 9,1 Hz)

F131			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_3F_6N_2O_2$, 533,0020; được phát hiện là, 533,0016,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,6, 1,2 Hz, 1H), 7,78 (ddd, J = 8,8, 2,7, 1,1 Hz, 1H), 7,68 (ddt, J = 9,6, 6,1, 1,7 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 1H), 7,12 (t, J = 54,6 Hz, 1H), 4,28 - 4,14 (m, 2H), 3,67 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,37 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,58 (t, J = 9,5 Hz), -114,91 (dd, J = 54,7, 3,6 Hz), -119,78 - -122,55 (m)
F132			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_4F_5N_2O_2$, 548,9724; được phát hiện là, 548,9723,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,6, 1,2 Hz, 1H), 7,80 - 7,72 (m, 2H), 7,65 (dd, J = 1,9, 1,0 Hz, 1H), 7,58 (dd, J = 8,1, 1,6 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,13 (t, J = 54,6 Hz, 1H), 4,30 - 4,12 (m, 2H), 3,72 - 3,65 (m, 1H), 3,43 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,56 (t, J = 9,5 Hz), -116,13 (d, J = 54,6 Hz)
F133			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_3F_6N_2O_2$, 533,0020; được phát hiện là, 533,0011,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,18 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,5 Hz, 1H), 7,92 (dd, J = 2,6, 1,1 Hz, 1H), 7,78 (ddd, J = 8,8, 2,7, 1,1 Hz, 1H), 7,70 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,44 (dd, J = 8,2, 1,5 Hz, 1H), 7,42 - 7,38 (m, 1H), 7,11 (t, J = 54,7 Hz, 1H), 4,29 - 4,11 (m, 2H), 3,69 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,41 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,58 (t, J = 9,4 Hz), -114,82 (dd, J = 54,7, 3,7 Hz), -119,99 (ddt, J = 11,4, 7,5, 3,6 Hz)
F134			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_3F_5N_2O_2$, 515,0114; được phát hiện là, 515,0108,	^{1}H NMR (500 MHz, Acetone-d_6) δ 10,16 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,6 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,7, 2,6 Hz, 1H), 7,65 - 7,56 (m, 4H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,93 (t, J = 56,1 Hz, 1H), 4,25 - 4,15 (m, 2H), 3,68 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,57 (t, J = 9,5 Hz), -111,22 (dd, J = 56,0, 14,1 Hz)
F135			HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{15}Cl_3F_5N_2O_2$, 515,0114; được phát hiện là, 515,0108,	^{1}H NMR (500 MHz, Axeton-d_6) δ 10,17 (s, 1H), 8,23 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 2,6, 1,2 Hz, 1H), 7,78 (ddd, J = 8,7, 2,6, 1,1 Hz, 1H), 7,64 (dt, J = 8,3, 1,2 Hz, 2H), 7,57 (dt, J = 8,0, 0,9 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,93 (t, J = 56,1 Hz, 1H), 4,20 (ttd, J = 9,5, 6,5, 3,2 Hz, 2H), 3,66 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 3,36 (d, J = 8,3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, Axeton-d_6) δ -72,57 (t, J = 9,4 Hz), -111,22 (d, J = 56,2 Hz)
PF1			ESIMS 622 ([M-H]-)	^{1}H NMR (400 MHz, Axeton-d_6) δ 10,15 (s, 1H), 8,22 (t, J = 6,4 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,53 - 7,42 (m, 4H), 4,20 (qd, J = 9,5, 6,5 Hz, 2H), 3,59 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,41 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 2,88 (d, J = 13,0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, Axeton-d_6) δ -72,58

PF2	87-93		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{20}Cl_5F_3N_2O_2S$, 619,9640; được phát hiện là, 619,9644,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 8,48 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,72 (m, 2H), 7,62 (s, 1H), 7,54 (m, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,08 (dt, J = 14,2, 6,9 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,75 (dt, J = 10,0, 4,7 Hz, 2H), 2,70 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,59 (m, 2H), 1,21 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,97, 163,01, 138,01, 137,93, 137,77, 134,54, 130,54, 130,46, 128,37, 128,25, 128,17, 126,04, 124,48, 123,84, 121,40, 119,48, 62,62, 45,10, 38,88, 37,60, 37,25, 34,32, 34,11, 33,89, 33,67, 23,92, 20,00; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -64,53, -64,56, -64,58
PF3	90-95		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{18}Cl_5F_3N_2O_2S$, 605,9484; được phát hiện là, 605,9485,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 8,51 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 7,72 (m, 2H), 7,62 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,12 (hept, J = 6,7 Hz, 1H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,53 (m, 3H), 2,80 (m, 2H), 1,21 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,41, 162,44, 137,46, 137,30, 137,20, 133,96, 129,98, 129,80, 127,80, 127,60, 125,41, 123,88, 123,22, 120,84, 118,85, 62,05, 44,73, 38,31, 38,09, 36,67, 33,33, 33,08, 32,83, 32,58, 19,40; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -65,06, -65,08, -65,08, -65,10, -65,11, -65,12
PF4	113-118		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{21}Cl_5F_3N_2O_4S$, 652,9611; được phát hiện là, 652,9620,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,87 (s, 1H), 8,69 (dd, J = 8,2, 2,7 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 5,5, 3,2 Hz, 2H), 7,62 (s, 1H), 7,54 (d, J = 1,4 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,52 (dt, J = 13,8, 6,9 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,48 (m, 5H), 2,78 (m, 2H), 1,31 (d, J = 6,1 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,68, 163,03, 163,01, 138,04, 137,77, 137,51, 134,54, 130,55, 128,36, 128,17, 127,88, 125,68, 124,48, 121,66, 119,49, 62,63, 57,20, 46,16, 38,83, 37,25, 34,66, 26,89, 26,65, 26,41, 26,17, 25,25, 22,54, 21,09, 14,44, 11,73; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -64,28, -64,30, -64,32
PF5	121-126		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{21}Cl_5F_3N_2O_3S$, 636,9662; được phát hiện là, 636,9665,	

PF6	102-107		HRMS-ESI $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{19}Cl_5F_3N_2O_4S$, 638,9455; được phát hiện là, 638,9465,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (s, 1H), 8,75 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,73 (m, 2H), 7,62 (s, 1H), 7,54 (d, J = 1,3 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 4,75 (q, J = 10,2 Hz, 2H), 4,55 (dq, J = 13,3, 6,6 Hz, 1H), 3,58 (m, 2H), 3,49 (m, 2H), 1,33 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,08, 162,47, 137,50, 137,20, 136,85, 133,96, 130,01, 127,79, 127,59, 125,53, 123,89, 123,32, 121,11, 118,84, 62,06, 58,66, 54,73, 54,50, 54,27, 54,06, 38,27, 36,67, 34,09, 30,85, 24,68, 21,96, 20,40, 13,86; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -59,40, -59,42, -59,44
PF7	123-128		HRMS-ESI (m/z) $[M+H]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{19}Cl_5F_3N_2O_3S$, 622,9506; được phát hiện là, 622,9508,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,87 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 8,81 (dd, J = 8,2, 2,0 Hz, 0,5H), 8,69 (d, J = 8,1 Hz, 0,5H), 7,72 (td, J = 6,4, 2,4 Hz, 2H), 7,62 (s, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,39 (dt, J = 13,8, 6,7 Hz, 1H), 4,07 (m, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,14 (m, 2H), 1,31 (m, 3H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -59,52, -59,53, -59,54, -59,55, -59,56, -59,58, -59,63, -59,65, -59,67, -59,69
PF9	73-79		HRMS-ESI (m/z) $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{24}H_{19}Cl_5N_2O_3S$, 589,9559; được phát hiện là, 589,9564,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (s, 1H), 8,62 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,75 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 1,8, 0,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,40 (dd, J = 3,1, 1,9 Hz, 1H), 6,32 (m, 1H), 3,84 (s, 2H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,40 (q, J = 6,3 Hz, 2H), 2,63 (t, J = 7,1 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,52, 163,03, 151,84, 142,95, 138,04, 137,78, 137,71, 134,54, 130,60, 128,38, 128,17, 124,45, 121,50, 119,52, 111,05, 108,21, 62,64, 38,88, 38,85, 37,25, 30,63, 27,36
PF10	93-99		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{23}H_{21}Cl_5N_2O_4S$, 595,9665; được phát hiện là, 595,9668,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,88 (d, J = 6,5 Hz, 1H), 8,95 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,75 (ddd, J = 18,2, 8,1, 2,6 Hz, 2H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (m, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,58 (ddt, J = 7,5, 5,2, 2,4 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 3,63 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (dd, J = 8,5, 3,0 Hz, 1H), 2,59 (m, 2H), 2,07 (s, 3H), 2,00 (m, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 171,82, 166,25, 162,46, 137,48, 137,19, 136,63, 136,61, 133,95, 130,04, 127,80, 127,59, 123,88, 121,03, 119,06, 62,04, 51,96, 51,16, 51,13, 38,32, 36,65, 30,05, 29,52, 14,46, 14,45

PF11	129-135		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{26}H_{18}Cl_5N_5O_2$, 606,9903; được phát hiện là, 606,9916,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 9,11 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,85 (m, 2H), 7,80 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,62 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,54 (m, 4H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 4,51 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 3,62 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,07, 162,47, 152,24, 142,12, 138,76, 137,53, 137,18, 137,03, 135,49, 133,95, 130,10, 128,45, 127,80, 127,59, 123,86, 120,98, 119,28, 118,91, 62,03, 41,86, 38,31, 36,66
PF12	94-99		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{16}Cl_5N_3O_2S$, 560,9406; được phát hiện là, 560,9399,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,85 (s, 1H), 8,66 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,76 (dd, J = 11,8, 3,0 Hz, 2H), 7,67 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,61 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,62 (m, 3H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,24 (t, J = 7,1 Hz, 2H) ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,90, 165,95, 162,42, 142,21, 137,43, 137,19, 137,11, 133,95, 129,99, 127,80, 127,59, 123,89, 120,95, 119,49, 118,97, 62,06, 38,28, 36,66, 32,15
PF13	187-189		HRMS-ESI $[M]^+$ được tính toán đối với $C_{22}H_{17}Cl_5N_4O_2$, 543,9794; được phát hiện là, 543,9800,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,60 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 8,8, 2,3 Hz, 2H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,6 Hz, 2H), 7,47 (m, 2H), 6,24 (t, J = 2,0 Hz, 1H), 4,29 (t, J = 6,3 Hz, 2H), 3,62 (q, J = 5,6 Hz, 3H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 166,11, 162,43, 138,77, 137,42, 137,19, 137,00, 133,96, 130,04, 129,98, 127,81, 127,59, 123,87, 121,02, 119,01, 104,93, 62,06, 49,94, 38,26, 36,67
PF14	150-155		ESIMS 596 ($[M-H+Na]^-$)	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,72 (s, 1H), 7,74 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,61 (m, 3H), 7,55 (d, J = 1,5 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,60 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,46 (m, 3H), 3,12 (m, 2H), 1,90 (p, J = 7,1 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 171,09, 162,70, 142,03, 137,90, 137,43, 134,50, 130,20, 128,39, 128,10, 124,76, 120,37, 119,81, 62,68, 50,22, 49,01, 38,90, 37,21, 24,24
PF15	115-119		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{27}H_{19}Cl_5N_2O_2S$, 609,9610; được phát hiện là, 609,9618,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,84 (s, 1H), 8,68 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 37,3, 7,9 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,8, 2,6 Hz, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,53 (s, 1H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,44 (m, 1H), 7,38 (t, J = 7,1 Hz, 1H), 3,61 (m, 3H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 165,96, 162,44, 139,56, 138,61, 137,44, 137,25, 137,19, 133,96, 133,39, 130,02, 127,80, 127,59, 124,19, 124,00, 123,92, 122,82, 122,74, 121,55, 120,92, 119,00, 62,05, 38,62, 38,28, 36,67, 27,86

PF16	108-112		HRMS-ESI $[M+]^+$ được tính toán đối với $C_{20}H_{14}Cl_5F_3N_2O_3$, 561,9399; được phát hiện là, 561,9402,	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 10,86 (s, 1H), 8,73 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 7,78 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,63 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 1,7 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,53 (dd, J = 6,5, 2,2 Hz, 1H), 4,17 (m, 1H), 3,61 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,57 (m, 1H), 3,50 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 3,30 (m, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -76,93, -76,95

Bảng tỷ lệ BAW & CL	
% Kiểm soát (hoặc tỷ lệ mắc bệnh)	Tỷ lệ
50-100	A
Lớn hơn 0 - Nhỏ hơn 50	B
Không được thử nghiệm	C
Không có hoạt tính được báo cáo trong thử nghiệm sinh học này	D

Bảng tỷ lệ GPA & YFM	
% Kiểm soát (hoặc tỷ lệ mắc bệnh)	Tỷ lệ
80-100	A
Lớn hơn 0 - Nhỏ hơn 80	B
Không được thử nghiệm	C
Không có hoạt tính được báo cáo trong thử nghiệm sinh học này	D

Bảng ABC: Các kết quả sinh học

Số	Loài			
	BAW	CL	GPA	YFM
F1	A	A	C	A
F2	A	A	B	A
F3	A	A	C	A
F4	A	A	A	A
F5	A	A	C	C
F6	A	A	B	A
F7	A	A	C	A
F8	A	A	C	C
F9	A	A	C	C
F10	A	A	C	C
F11	A	A	C	C
F12	A	A	B	A
F13	A	A	B	A
F14	A	A	B	A
F15	A	A	A	A
F16	A	A	B	A
F17	A	A	B	A
F18	A	A	B	C
F19	A	A	B	A
F20	A	A	B	A
F21	A	A	B	B

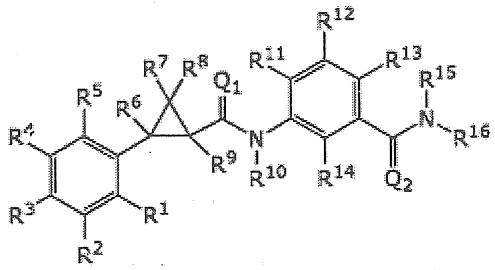
F22	A	A	A	B
F23	A	A	A	B
F24	A	A	C	A
F25	A	A	C	A
F26	A	A	C	A
F27	A	A	B	A
F28	A	A	A	A
F29	D	D	B	A
F30	A	A	A	A
F31	A	A	B	B
F32	A	A	B	A
F33	A	A	B	A
F34	A	A	D	A
F35	A	A	A	A
F36	D	D	D	B
F37	A	A	B	A
F38	A	A	A	A
F39	A	A	A	A
F40	A	A	A	A
F41	A	A	D	A
F42	A	A	B	A
F43	A	A	A	C
F44	A	A	A	A
F45	A	A	A	A
F46	A	A	A	A
F47	A	A	A	A
F48	A	A	A	B
F49	A	A	A	A
F50	D	A	C	C
F51	A	A	C	B
F52	A	A	C	B
F53	A	A	C	B
F54	A	A	C	B
F55	A	A	A	B
F56	A	A	A	A
F57	A	A	C	D
F58	A	A	C	A
F59	A	A	B	A
F60	A	A	C	D
F61	A	A	C	D
F62	A	A	C	D
F63	A	A	C	D
F64	A	A	C	D
F65	A	A	C	C
F66	A	A	C	C
F67	A	A	C	D
F68	A	A	C	D
F69	A	A	C	D
F70	A	A	C	D
F71	A	A	C	D
F72	A	A	C	A
F73	A	A	C	A
F74	A	A	C	C

F75	A	A	A	A
F78	A	A	C	A
F79	A	A	C	A
F84	A	A	C	D
F85	A	A	C	B
F86	A	A	C	B
F87	A	A	C	B
F88	A	A	C	B
F91	A	A	C	A
F92	A	A	C	A
F93	A	A	C	C
F94	A	A	C	A
F95	A	A	C	A
F96	A	A	C	A
F97	A	A	C	A
F98	B	D	C	A
F99	A	A	C	A
F100	A	D	C	A
F101	D	D	C	D
F102	B	D	C	A
F103	A	A	C	A
F104	A	A	C	A
F105	A	A	C	A
F106	A	A	C	A
F107	A	A	C	B
F108	A	A	C	A
F109	A	A	C	A
F111	A	A	C	A
F112	A	A	C	A
F113	A	A	C	A
F114	A	A	C	A
F115	A	A	C	A
F116	A	A	C	A
F117	A	A	C	A
F118	A	A	C	A
F119	A	A	C	A
F120	A	A	C	A
F121	A	A	C	A
F122	A	A	C	A
F123	A	A	C	A
F124	A	A	C	A
F125	A	A	C	A
F126	A	A	C	A
F127	A	A	C	A
F128	A	A	C	A
F129	A	A	C	A
F130	A	A	C	A
F131	A	A	C	A
F132	A	A	C	A
F133	A	A	C	A
F134	A	A	C	A
F135	D	A	C	A
PF1	A	A	C	D
PF2	A	A	C	A

PF3	A	A	A	B
PF4	A	A	C	A
PF5	A	A	C	A
PF6	A	A	B	A
PF7	A	A	C	A
PF9	A	A	C	A
PF10	A	A	C	B
PF11	A	A	C	A
PF12	A	A	C	A
PF13	A	A	C	A
PF14	B	A	C	D
PF15	A	A	C	A
PF16	A	A	A	A

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất phenyl-xyclopropylcarboxamido-benzamit có công thức (I):



(I)

trong đó:

(A) R^1 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, $(C_1$-$C_4)$alkyl, C_3-$C_6)$xycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$alkenyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkenyl, $(C_2$-$C_4)$alkynyl, $(C_1$-$C_4)$alkoxy, $(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$haloalkenyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkenyl, $(C_1$-$C_4)$haloalkoxy, $S(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_1$-$C_4)$alkyl-$S(O)_2NH_2$, và $(C_1$-$C_4)$haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(B) R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, $(C_1$-$C_4)$alkyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$alkenyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkenyl, $(C_2$-$C_4)$alkynyl, $(C_1$-$C_4)$alkoxy, $(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$haloalkenyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkenyl, $(C_1$-$C_4)$haloalkoxy, $S(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_1$-$C_4)$alkyl-$S(O)_2NH_2$, và $(C_1$-$C_4)$haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(C) R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, $(C_1$-$C_4)$alkyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$alkenyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkenyl, $(C_2$-$C_4)$alkynyl, $(C_1$-$C_4)$alkoxy, $(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$haloalkenyl, $(C_3$-$C_6)$haloxycloalkenyl, $(C_1$-$C_4)$haloalkoxy, $S(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$alkyl, $S(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1$-$C_4)$haloalkyl, $(C_1$-$C_4)$alkyl-$S(O)_2NH_2$, và $(C_1$-$C_4)$haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(D) R^4 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, $(C_1$-$C_4)$alkyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkyl, $(C_2$-$C_4)$alkenyl, $(C_3$-$C_6)$xycloalkenyl, $(C_2$-$C_4)$alkynyl, $(C_1$-$C_4)$alkoxy,

(C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(E) R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$; (F) R6 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl;

(G) R^7 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, và I;

(H) R^8 được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, và I;

(I) R^9 được chọn từ nhóm bao gồm H và (C_1-C_4)alkyl; (J) R10 được chọn từ nhóm bao gồm H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl(C_1-C_4)alkyl(C_1-C_4)alkoxy, C(=O)(C_1-C_4)alkyl, và (C_1-C_4)alkoxyC(=O)(C_1-C_4)alkyl;

(K) R^{11} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(L) R^{12} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, S(C_1-C_4)alkyl, S(O)(C_1-C_4)alkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)alkyl, S(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)(C_1-C_4)haloalkyl, S(O)$_2$(C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-S(O)$_2$NH$_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-S(O)$_2$NH$_2$;

(M) R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH$_2$, NO$_2$, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy,

(C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(N) R^{14} được chọn từ nhóm bao gồm H, F, Cl, Br, I, CN, NH_2, NO_2, (C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_6)xycloalkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_3-C_6)xycloalkenyl, (C_2-C_4)alkynyl, (C_1-C_4)alkoxy, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_3-C_6)haloxycloalkyl, (C_2-C_4)haloalkenyl, (C_3-C_6)haloxycloalkenyl, (C_1-C_4)haloalkoxy, $S(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)(C_1-C_4)$alkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$alkyl, $S(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)(C_1-C_4)$haloalkyl, $S(O)_2(C_1-C_4)$haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl-$S(O)_2NH_2$, và (C_1-C_4)haloalkyl-$S(O)_2NH_2$;

(O) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), H, (C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_4)alkenyl, (C_1-C_4)haloalkyl, (C_1-C_4)alkyl(C_1-C_4)alkoxy, $C(=O)(C_1-C_4)$alkyl, và (C_1-C_4)alkoxy-$C(=O)(C_1-C_4)$alkyl;

(P) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm (Q), (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkylphenyl, (C_2-C_8)alkenyl, (C_2-C_8)alkynyl, (C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-$S(O)_2$-(C_1-C_8)alkyl, O-phenyl, O-(C_2-C_8)alkenyl, O-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, O-(C_1-C_8)alkylphenyl, (C_1-C_8)alkylO-(C_1-C_8)alkyl(C_3-C_8)xycloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-O-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-C(=O) nH-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-NHC(O)-(C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkyl-S-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-S(O)-(C_1-C_8)haloalkyl, (C_1-C_8)alkyl-$S(O)_2$-(C_1-C_8)haloalkyl, và (C_1-C_8)alkyl-$S(O)_2$-NH_2, trong đó mỗi alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, và phenyl, có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN, OH, NH_2, NO_2, (C_1-C_8)alkyl, (C_1-C_8)alkoxy, (C_1-C_8)haloalkyl, $N((C_1-C_8)alkyl)_2$, $C(O)O(C_1-C_8)$alkyl, benzothioenyl, 2,3-dihydro-1H-imidazolonyl, furanyl, pyrazolyl, pyridinyl, thiazolyl, và triazolyl;

(Q) R^{15} và R^{16} có thể tùy ý cùng tạo ra liên kết hydrocarbyl no hoặc không nó có 2 đến 5 cạnh, mà có thể chứa một hoặc nhiều nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm nitơ, lưu huỳnh, và oxy, trong đó liên kết hydrocarbyl này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, Br, I, CN, NH_2, và NO_2;

(R) mỗi Q^1 và Q^2 độc lập được chọn từ nhóm bao gồm O và S; và N-oxit, muối cộng hợp axit nông dụng, dẫn xuất muối, solvat, dẫn xuất este, dạng tinh thể đa hình, chất đồng vị, chất đồng phân lập thể được hòa tan, và chất hỗ biến, của các hợp chất có công thức (I).

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, và R^5 được chọn từ nhóm bao gồm H, F, và Cl.

3. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^7 và R^8 được chọn từ nhóm bao gồm Cl và Br.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và CF_3.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và CH_3.

6. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_2$, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-CH_3, $CH_2CH(CH_3)_2$, CH_2xyclopropyl, CH_2CH_2xyclopropyl, CH_2xyclobutyl, CH_2phenyl, CH_2CH_2phenyl, $CH_2C{=}CH$, $CH_2C{=}CH$, CH_2CF_3, CH_2CHF_2, $CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2F$, $CH_2CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2S(O)CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $C(CH_3)_2CH_2S(O)_2CH_3$, Ophenyl, $OCH_2CH{=}CH_2$, OCH_2xyclopropyl, OCH_2phenyl, $CH_2CH_2OCH_2$xyclopropyl, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CF_3$, $CH_2C(=O)$ nHCH_2CF_3, hoặc $CH_2CH_2NHC(=O)CH_3$, trong đó mỗi CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, xyclopropyl, xyclobutyl, và phenyl, có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, $C(CH_3)_3$, CF_3, OCH_3, OCH_2CH_3, $N(CH_3)_2$, và pyridinyl.

7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^{15} và R^{16} đều là -$CH_2CH_2CF_2CH_2$-.

8. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó Q^1 và Q^2 là O.

9. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

(A) R^1 là H;

(B) R^2 được chọn từ nhóm bao gồm H và Cl;

(C) R^3 được chọn từ nhóm bao gồm H và Cl;

(D) R^4 là Cl;

(E) R^5 là H;

(F) R^6 là H;

(G) R^7 được chọn từ nhóm bao gồm Cl và Br;

(H) R^8 được chọn từ nhóm bao gồm Cl và Br;

(I) R^9 là H;

(J) R^{10} là H;

(K) R^{11} là H;

(L) R^{12} là H;

(M) R^{13} được chọn từ nhóm bao gồm H, Cl, và CF_3;

(N) R^{14} là H;

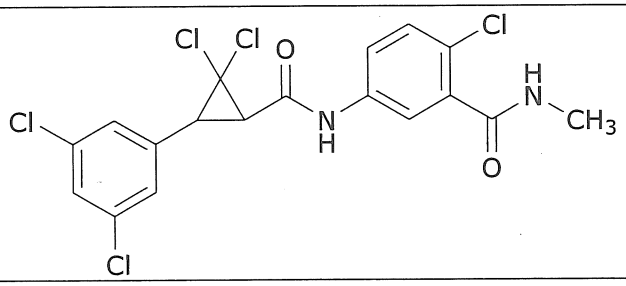
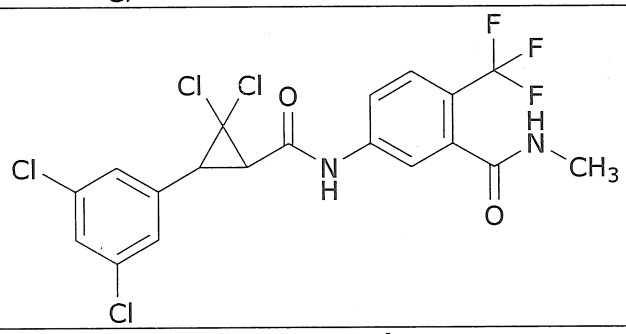
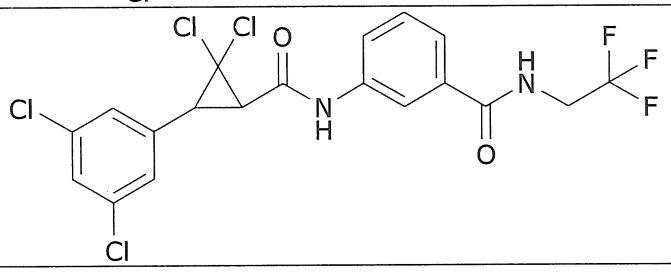
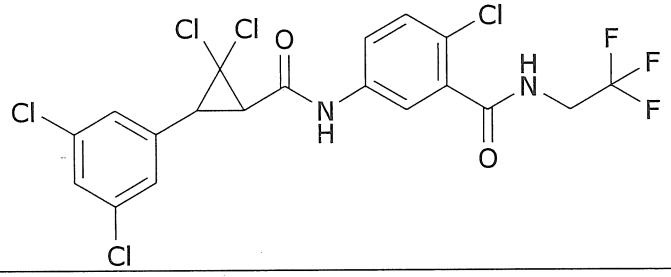
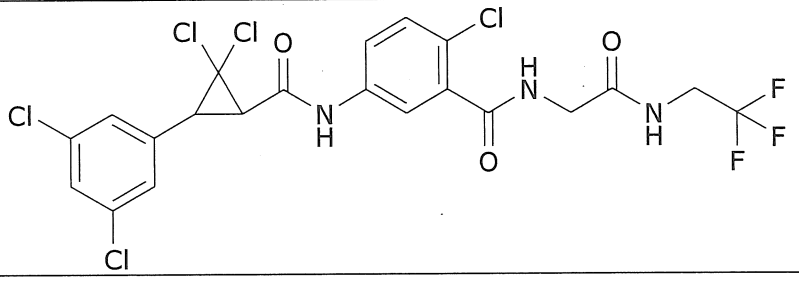
(O) R^{15} được chọn từ nhóm bao gồm H và CH_3;

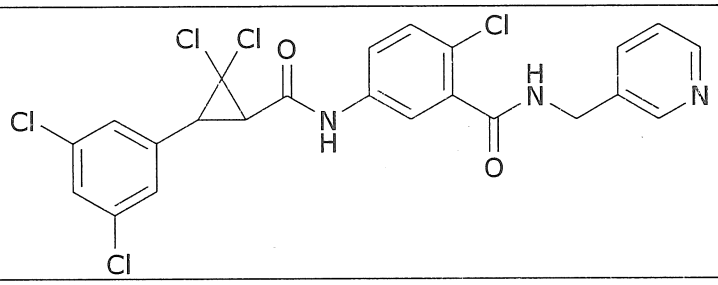
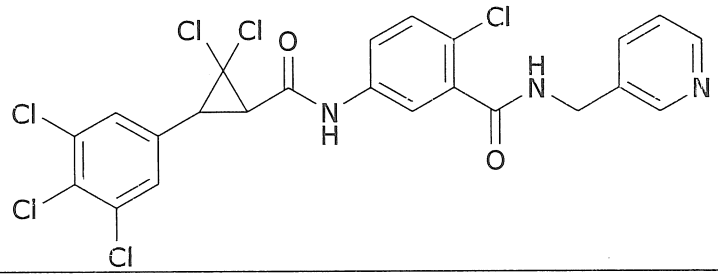
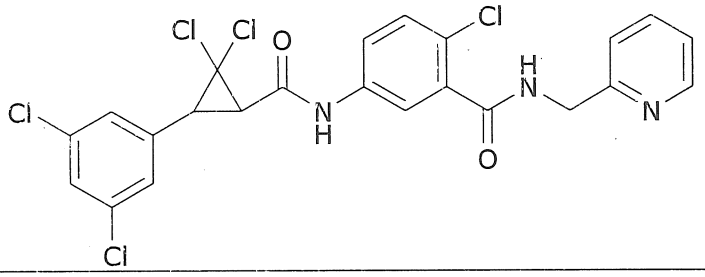
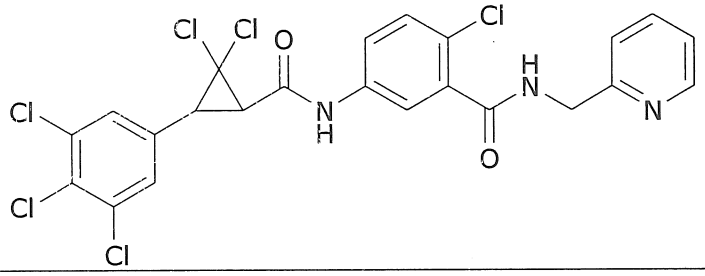
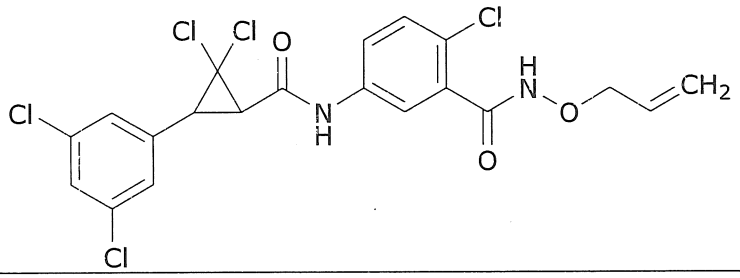
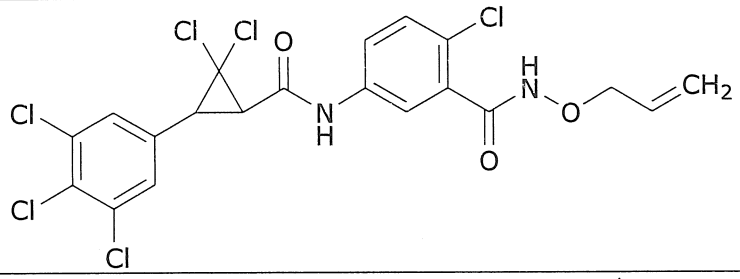
(P) R^{16} được chọn từ nhóm bao gồm CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_2$, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_2CH(CH_3)_2$, CH_2xyclopropyl, CH_2CH_2xyclopropyl, CH_2xyclobutyl, CH_2phenyl, CH_2CH_2phenyl, $CH_2C{=}CH$, $CH_2C{=}CH$, CH_2CF_3, CH_2CHF_2, $CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CF_2CF_3$, $CH_2CF_2CF_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2F$, $CH_2CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2S(O)CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $C(CH_3)_2CH_2S(O)_2CH_3$, Ophenyl, $OCH_2CH{=}CH_2$, OCH_2xyclopropyl, OCH_2phenyl, $CH_2CH_2OCH_2$xyclopropyl, $CH_2CH_2CH_2OCH_2CF_3$, $CH_2C(=O)$ $nHCH_2CF_3$, và $CH_2CH_2NHC(=O)CH_3$, trong đó mỗi CH_2, CH_2CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, xyclopropyl, xyclobutyl, và phenyl, có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm F, Cl, CN, $C(CH_3)_3$, CF_3, OCH_3, OCH_2CH_3, $N(CH_3)_2$, và pyridinyl; và

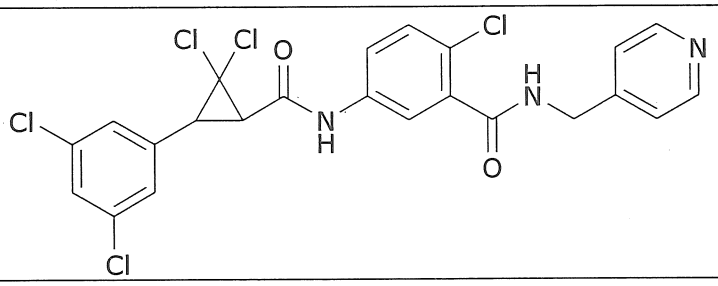
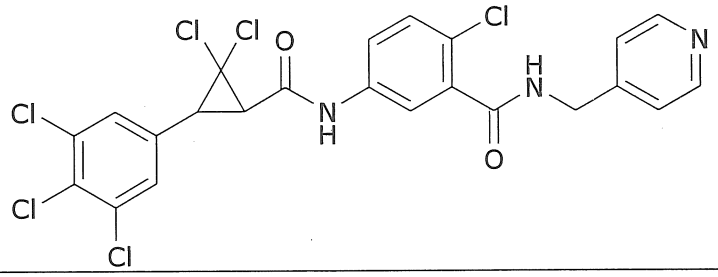
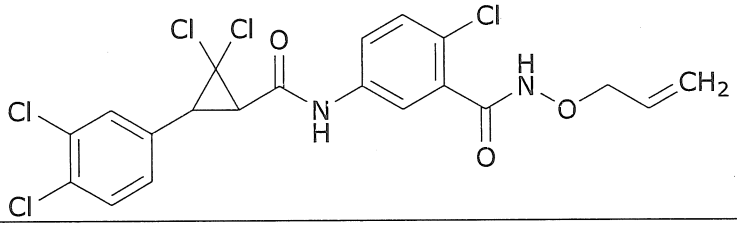
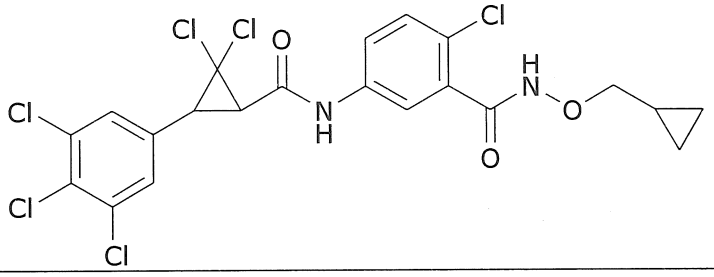
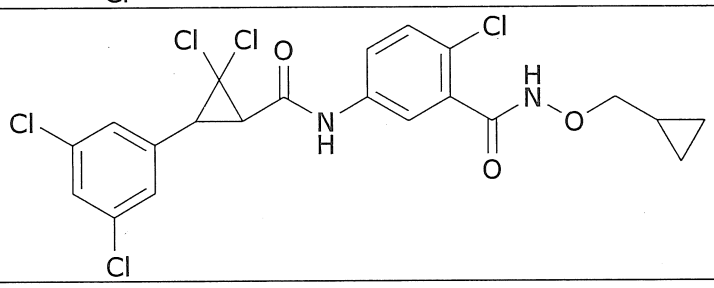
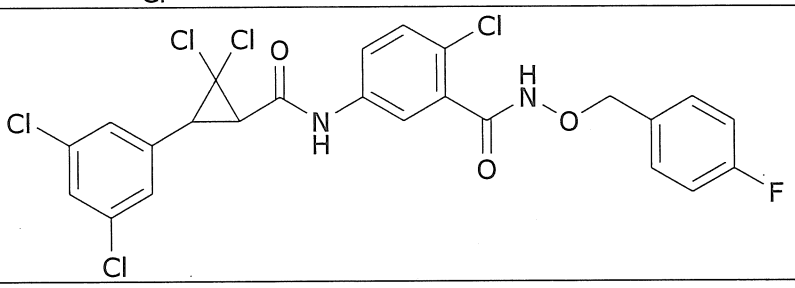
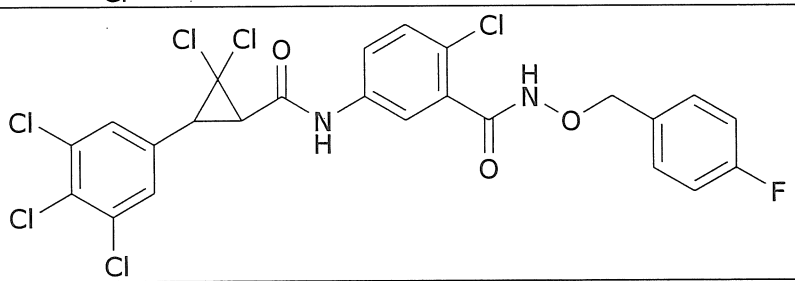
(Q) tốt hơn nếu R^{15} và R^{16} đều là liên kết hydrocarbyl no có 4 cạnh, trong đó liên kết hydrocarbyl này được thế bằng một hoặc nhiều F.

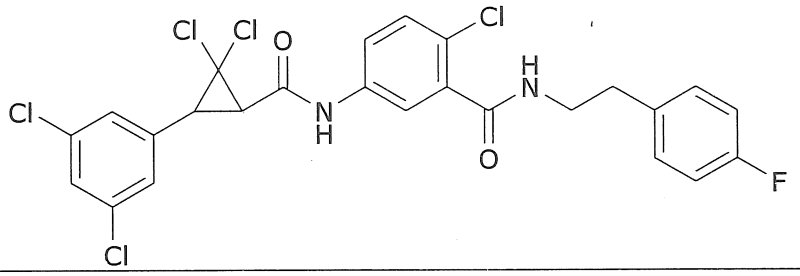
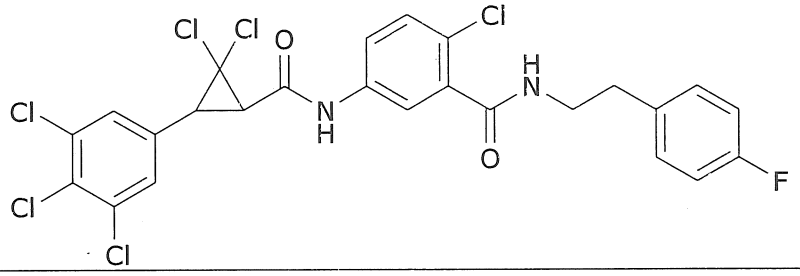
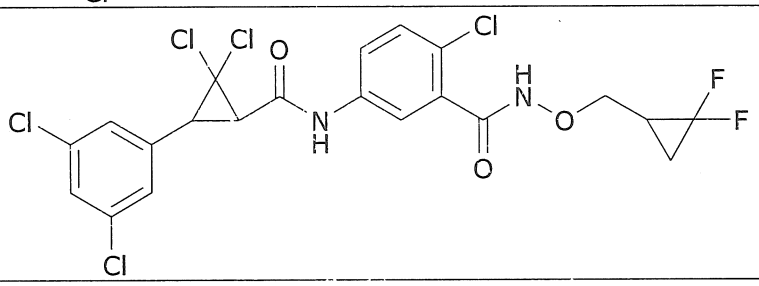
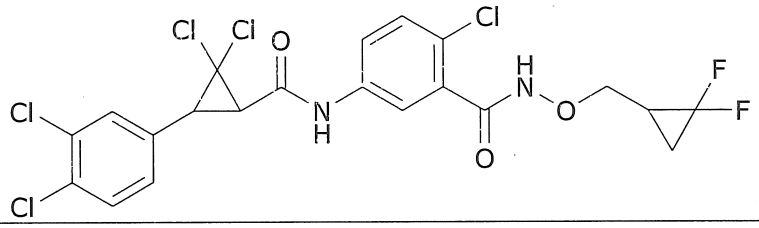
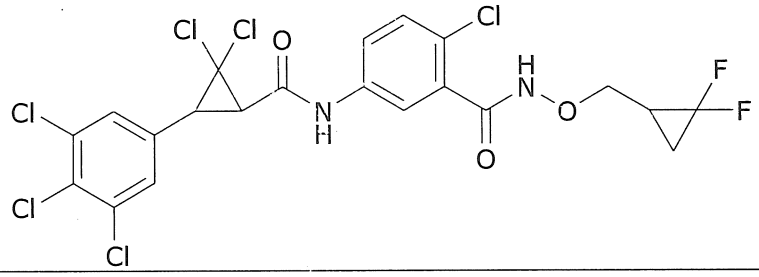
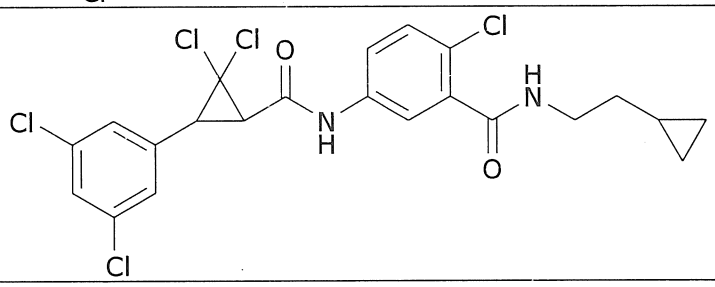
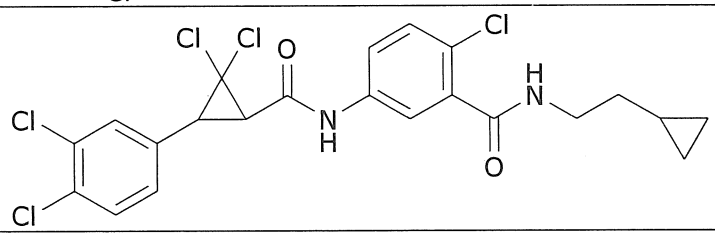
(R) Q^1 và Q^2 là O.

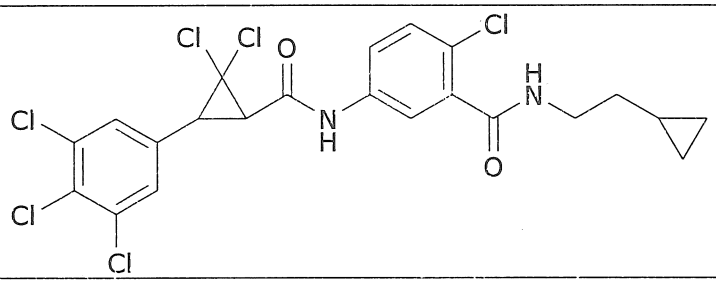
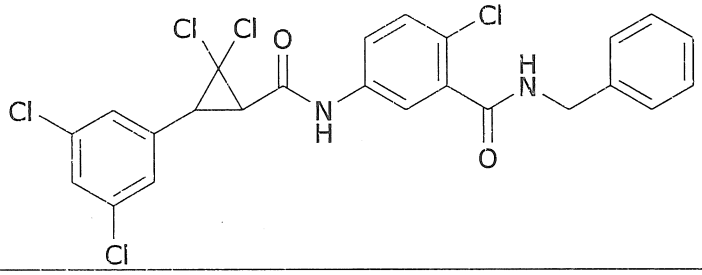
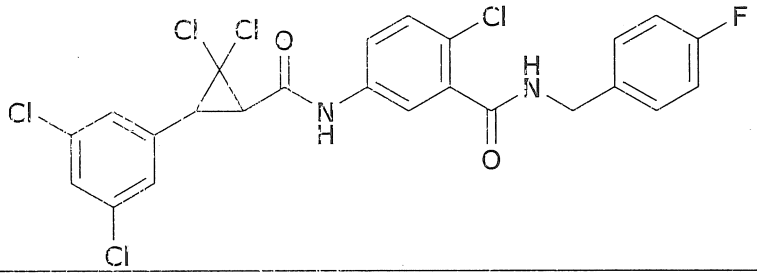
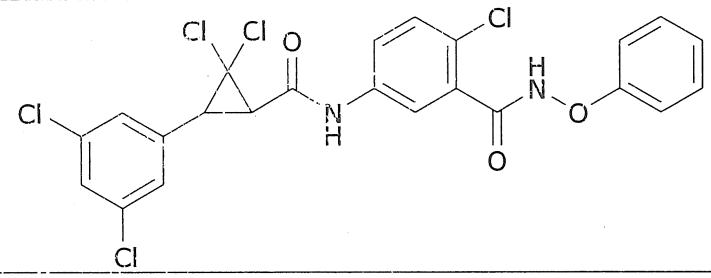
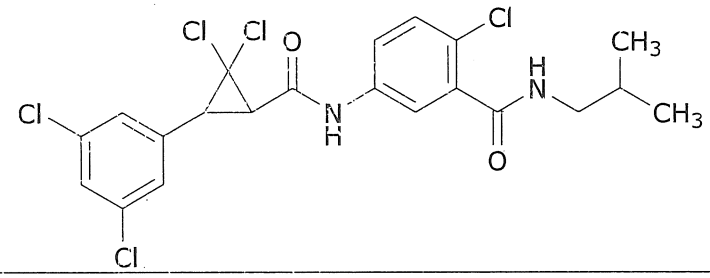
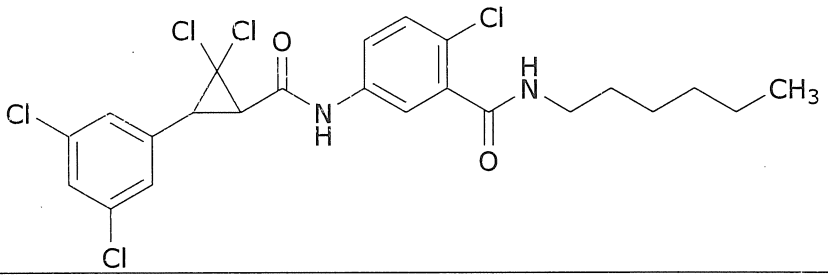
10. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này được chọn từ nhóm bao gồm F1 đến F75, F78, F79, F84 đến F88, F91 đến F100, F102 đến F109, F111 đến F135, PF1 đến PF7, và PF10 đến PF16

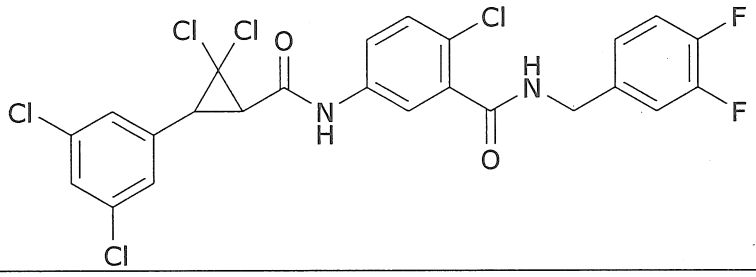
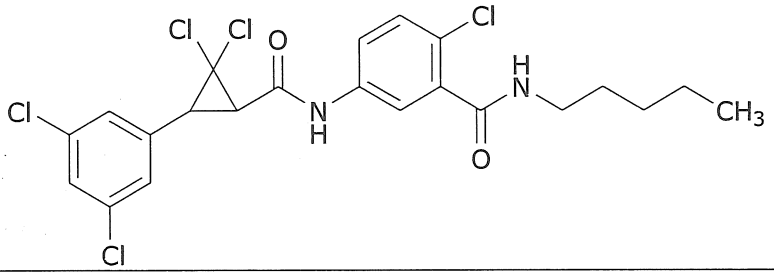
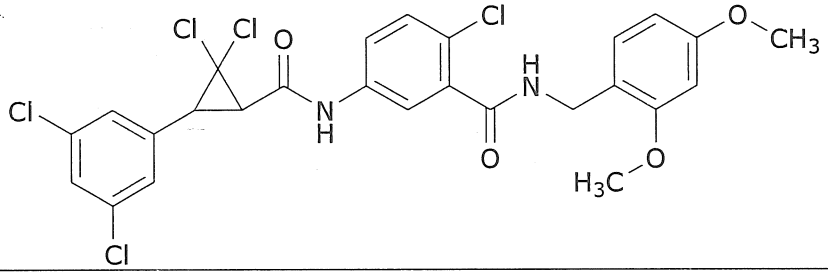
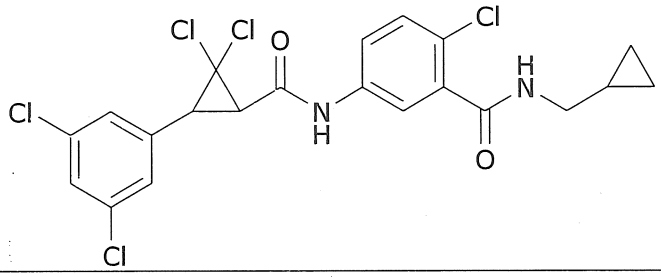
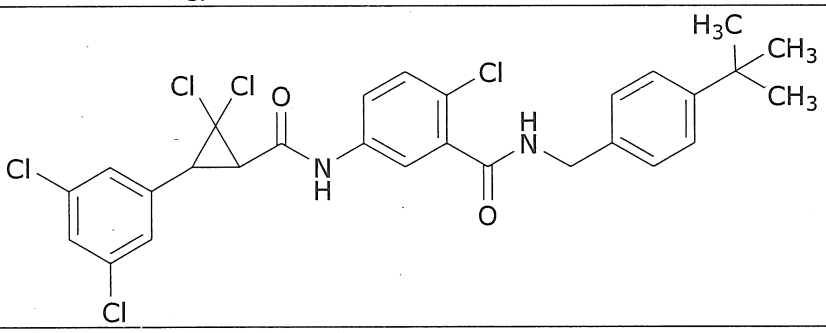
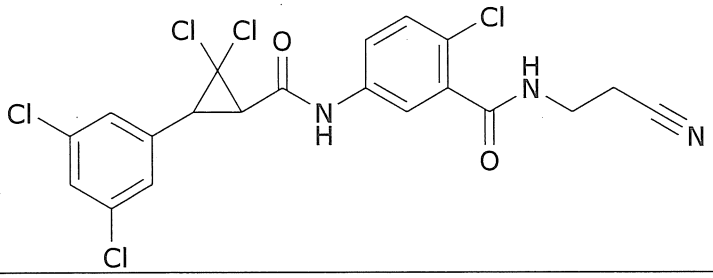
Số	Cấu trúc
F1	
F2	
F3	
F4	
F5	

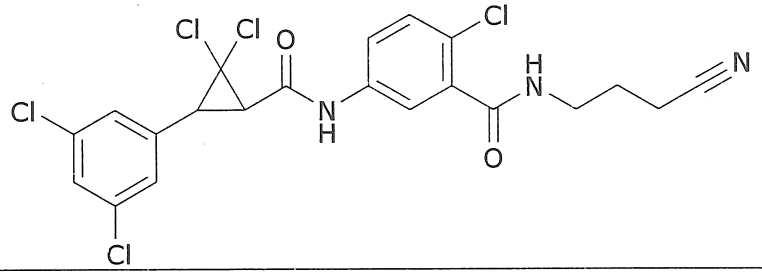
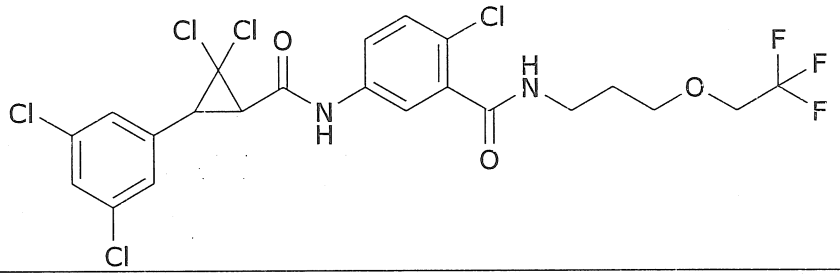
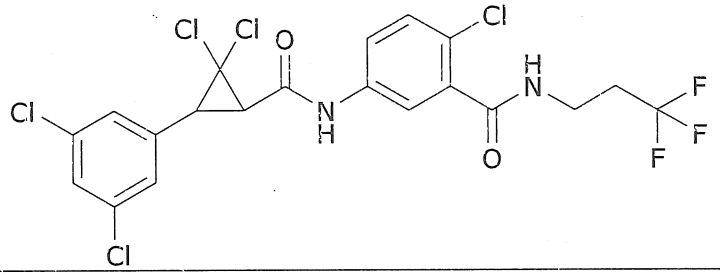
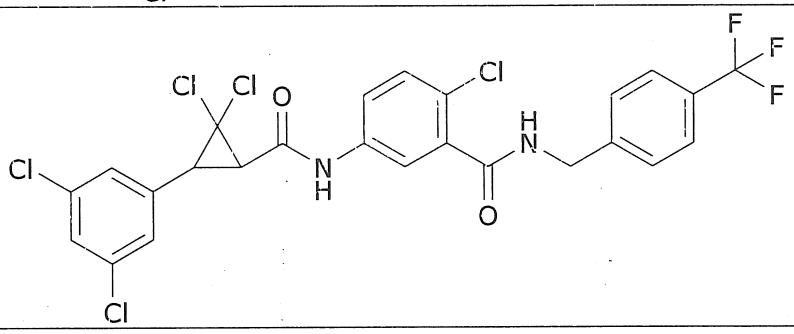
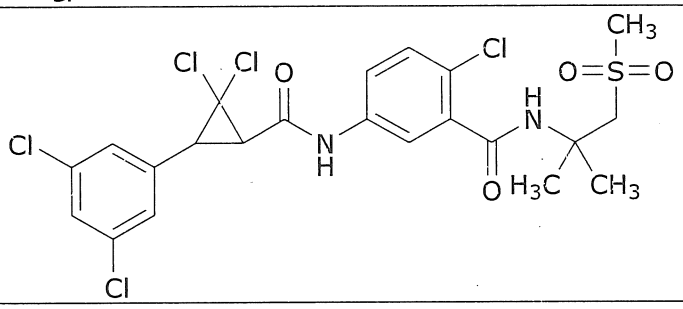
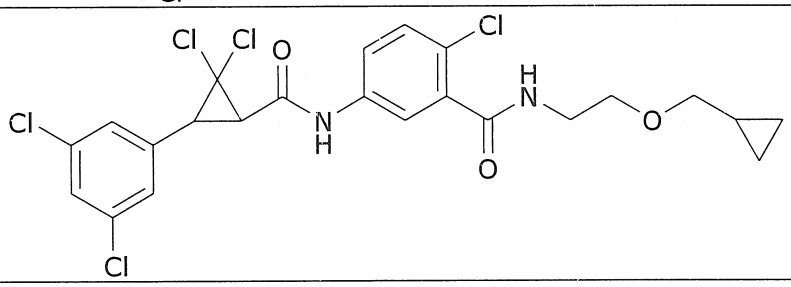
F6	
F7	
F8	
F9	
F10	
F11	

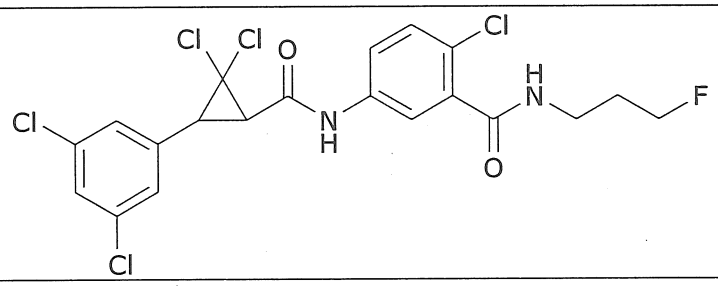
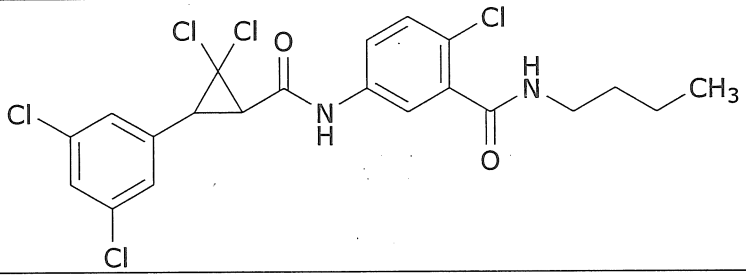
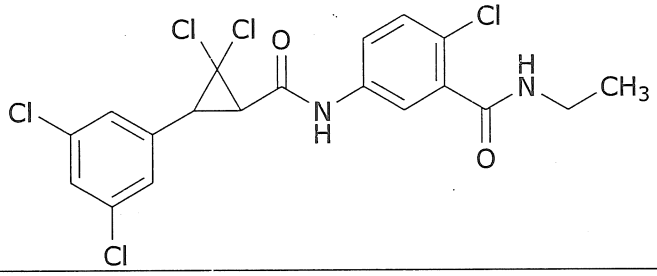
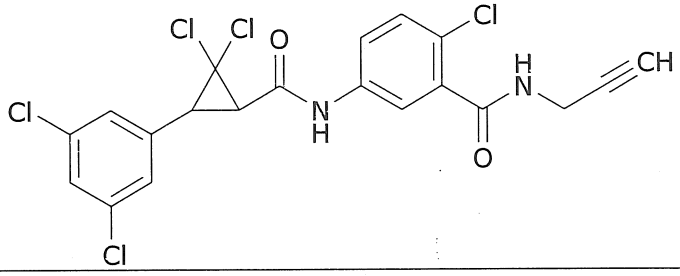
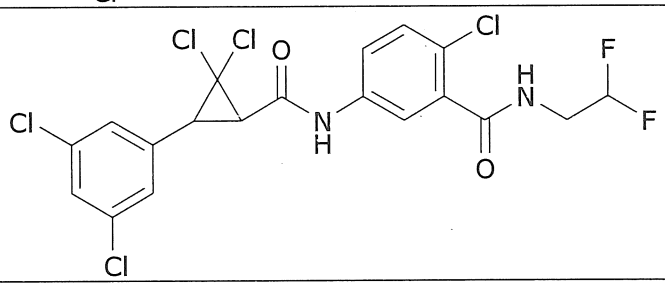
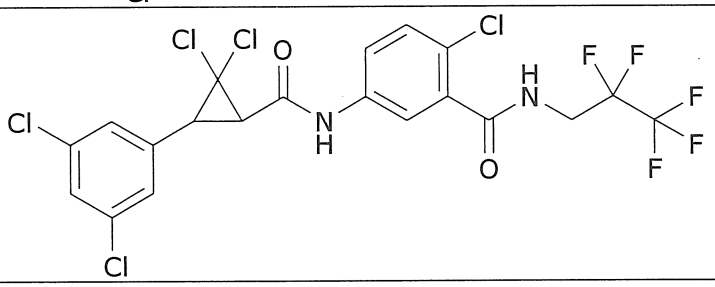
F12	
F13	
F14	
F15	
F16	
F17	
F18	

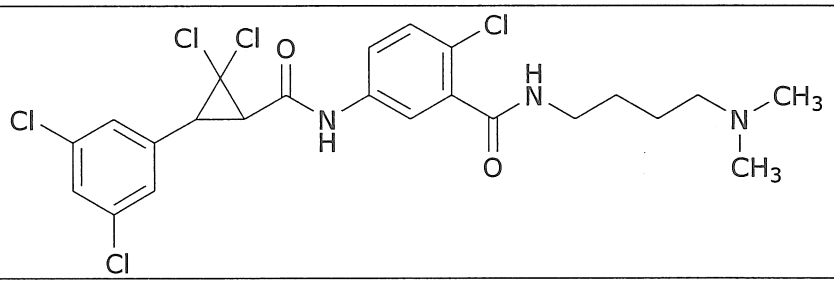
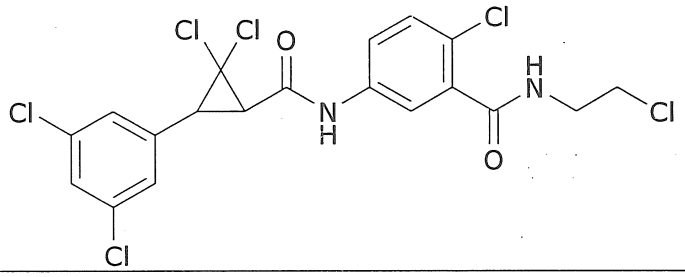
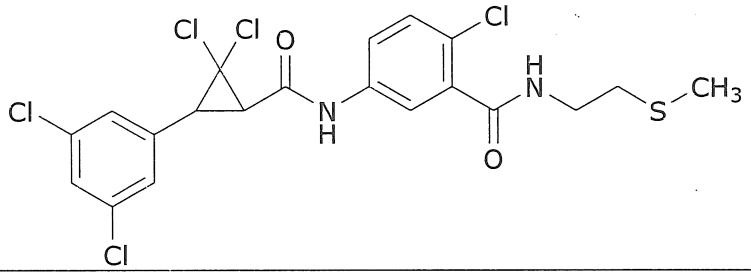
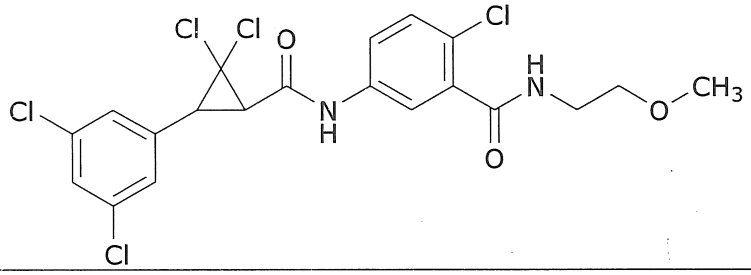
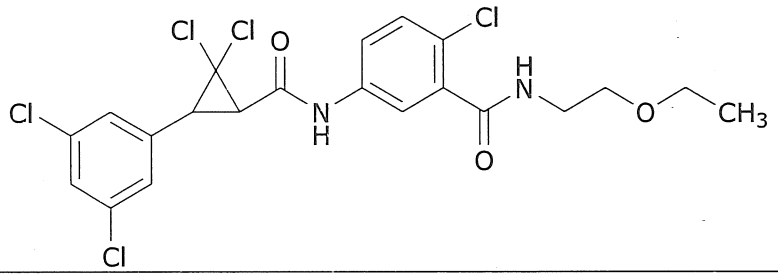
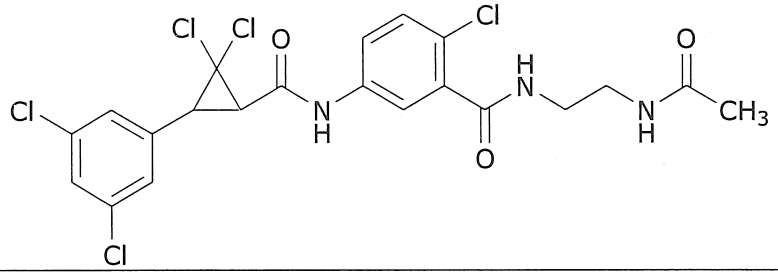
F19	
F20	
F21	
F22	
F23	
F24	
F25	

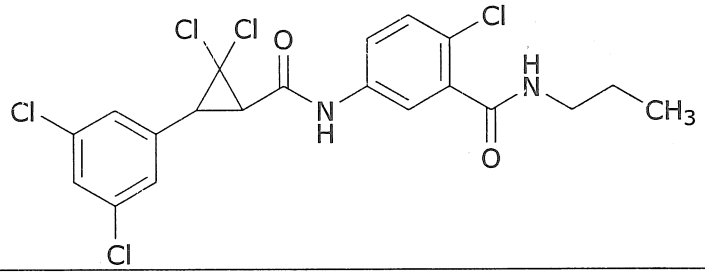
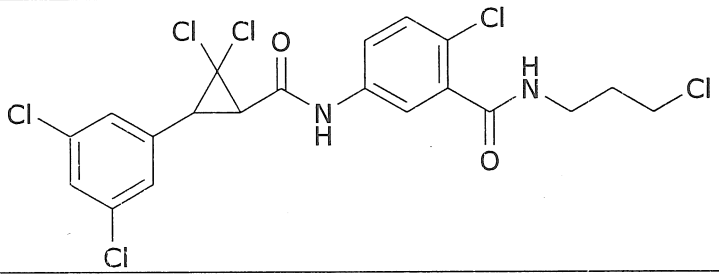
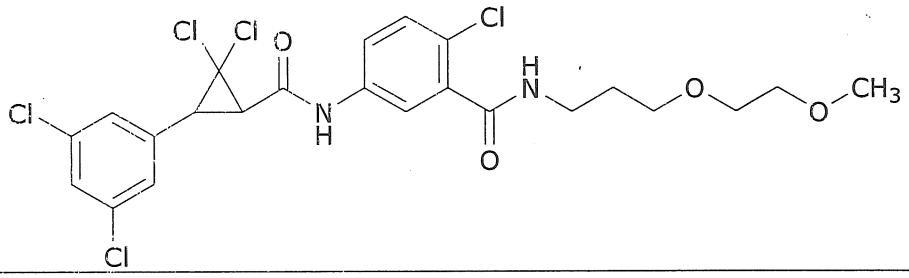
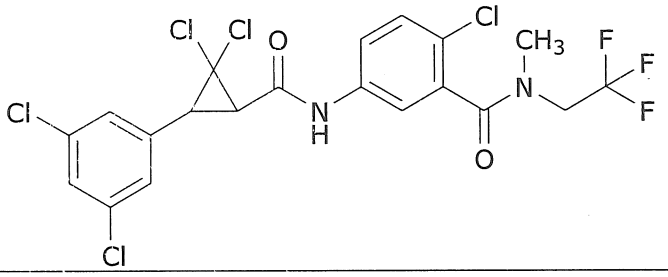
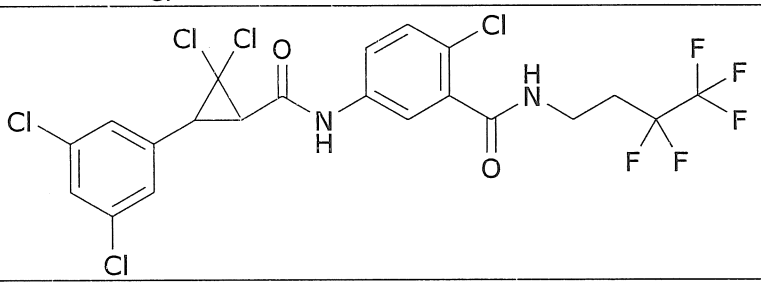
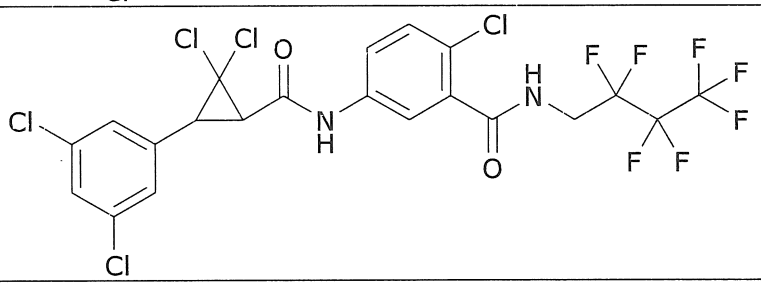
F26	
F27	
F28	
F29	
F30	
F31	

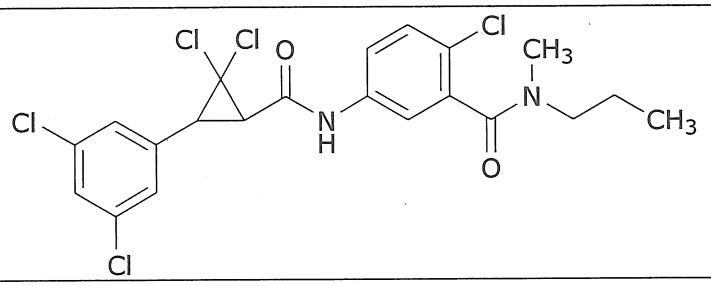
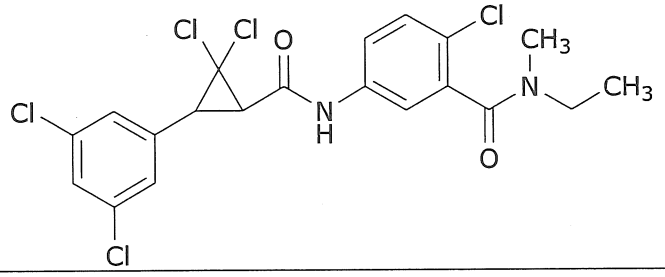
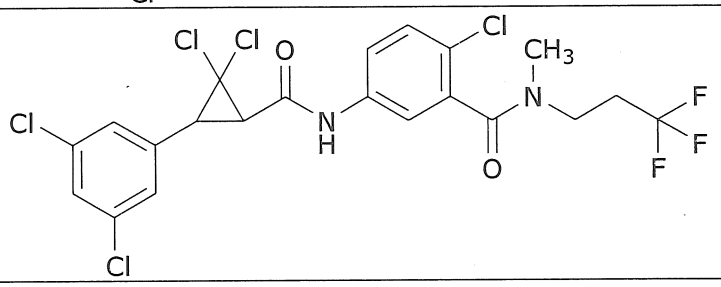
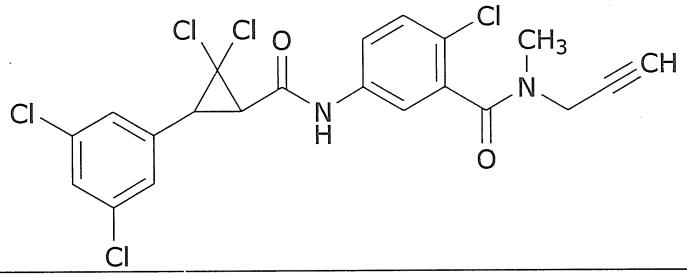
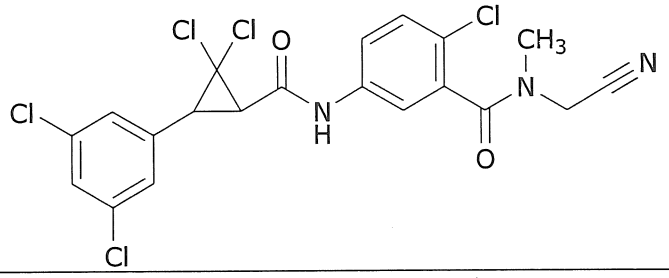
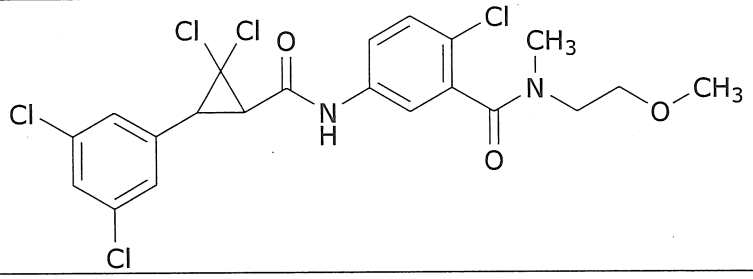
F32	
F33	
F34	
F35	
F36	
F37	

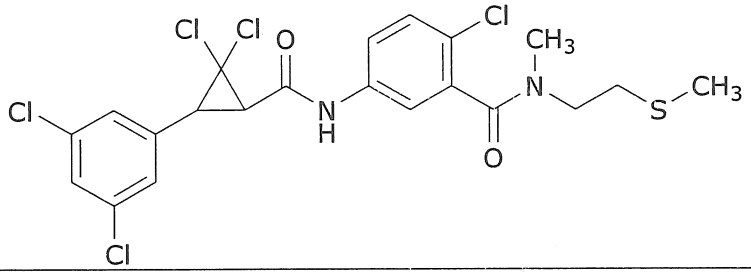
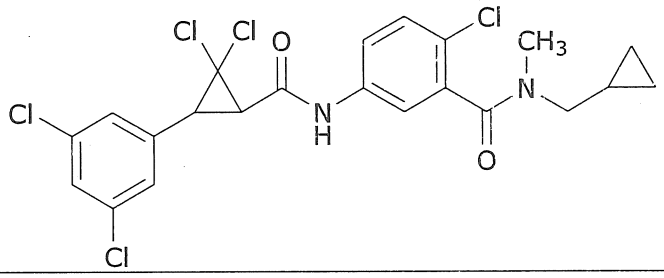
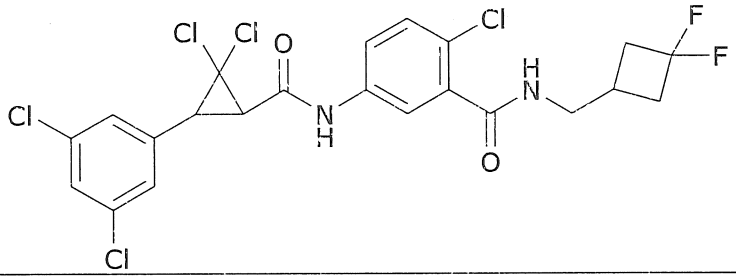
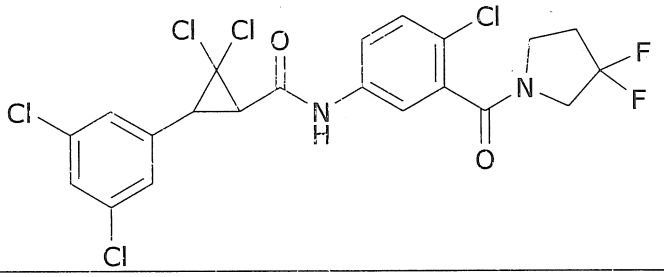
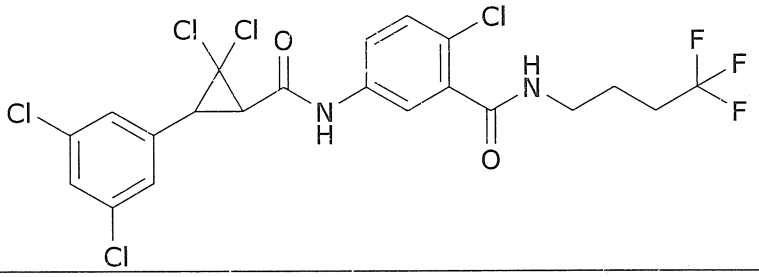
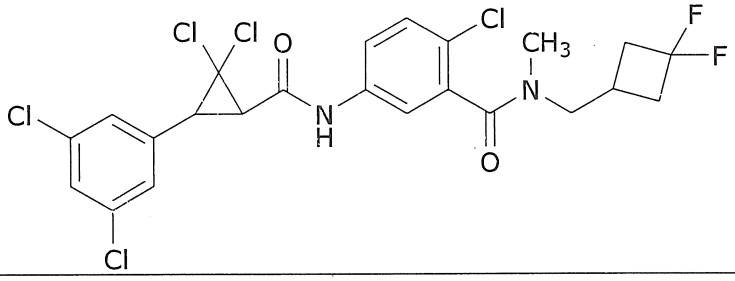
F38	
F39	
F40	
F41	
F42	
F43	

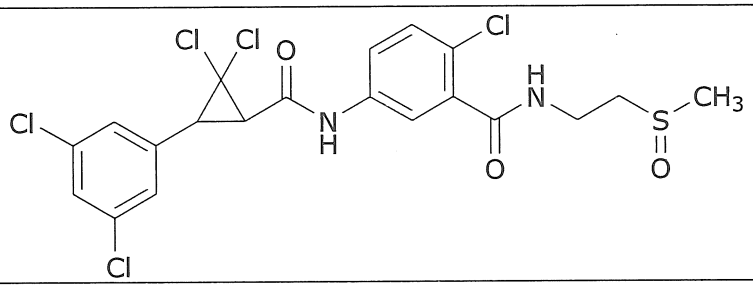
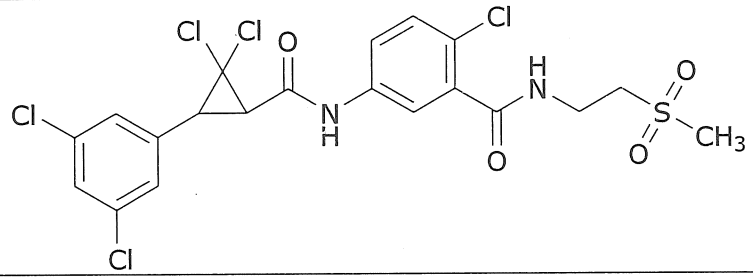
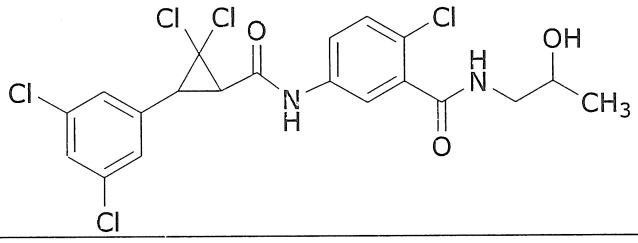
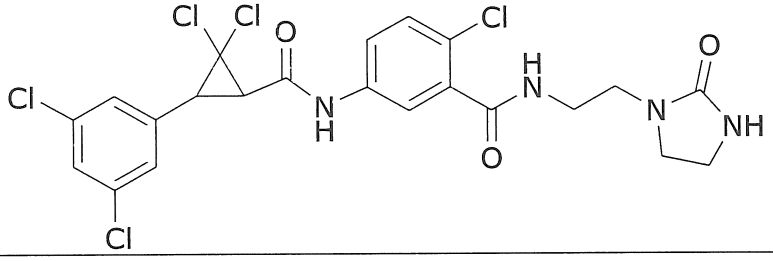
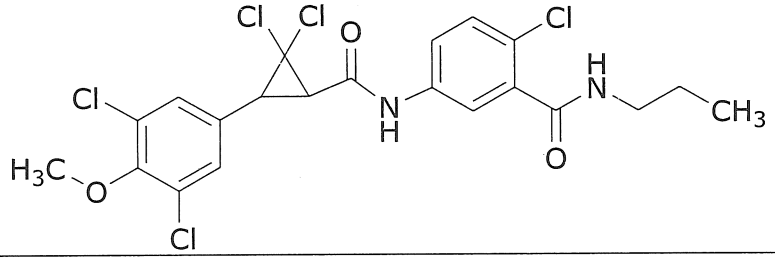
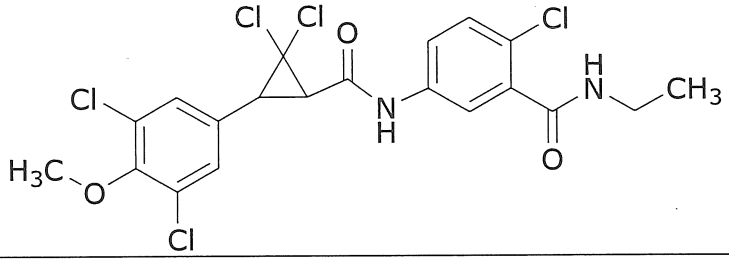
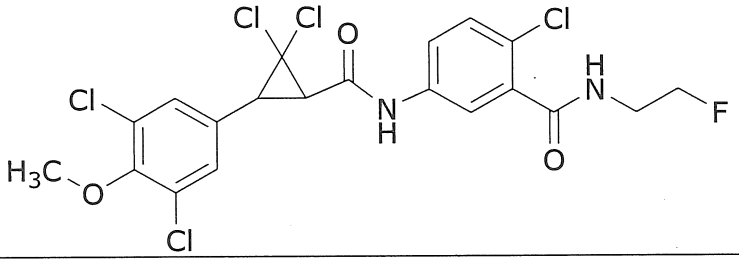
F44	
F45	
F46	
F47	
F48	
F49	

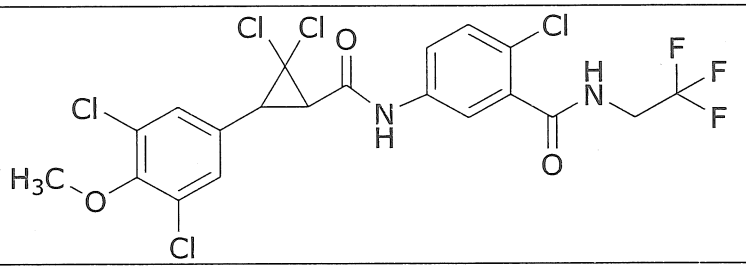
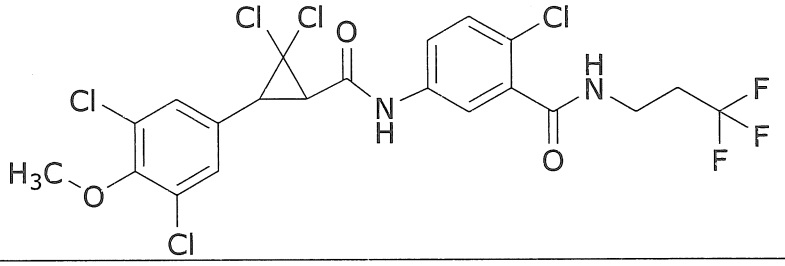
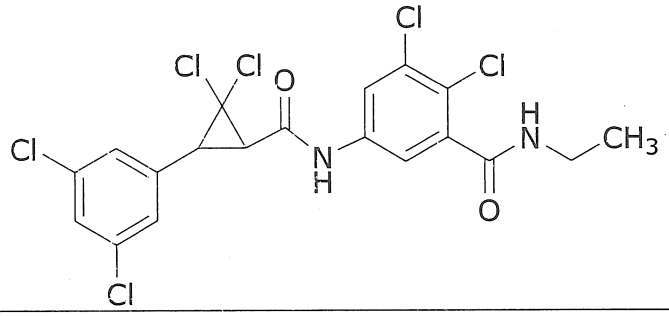
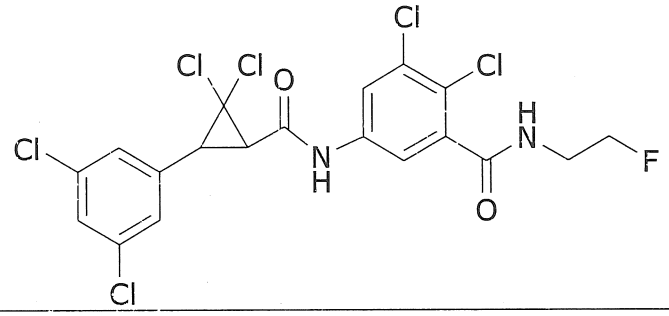
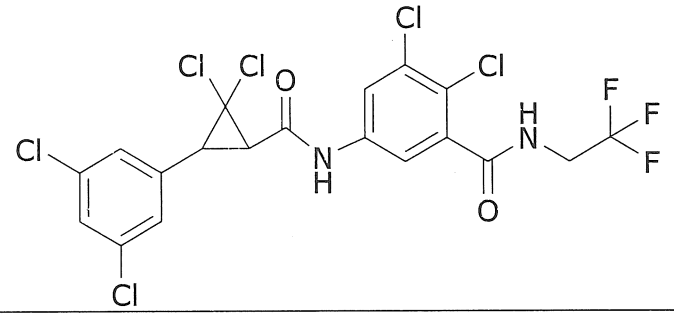
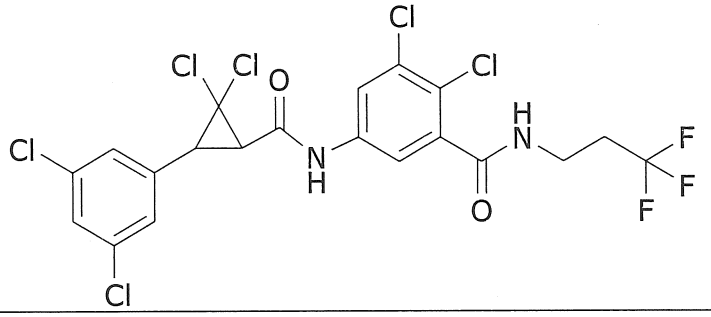
F50	
F51	
F52	
F53	
F54	
F55	

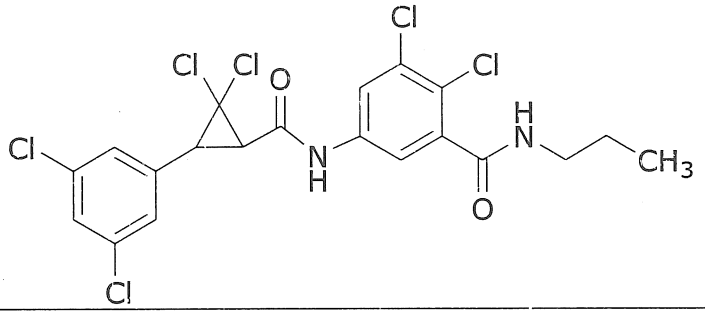
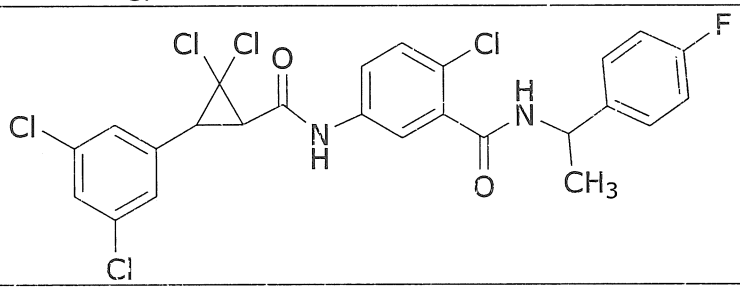
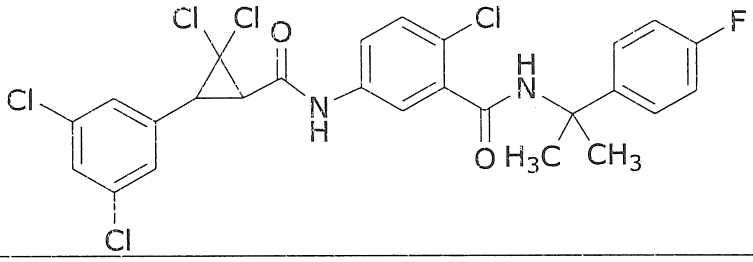
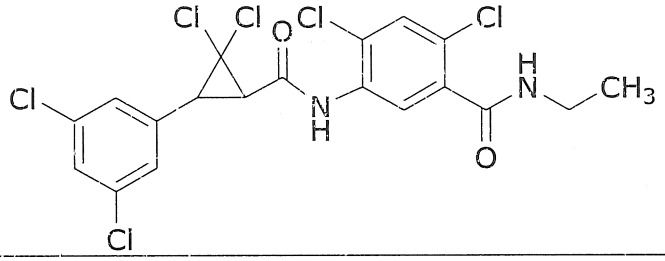
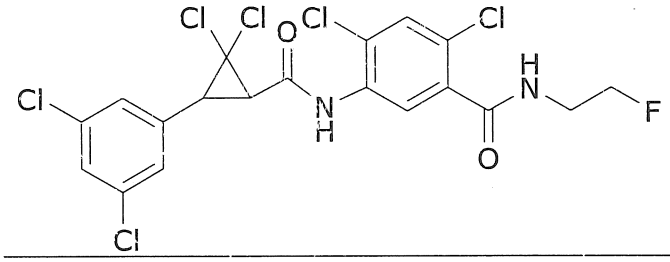
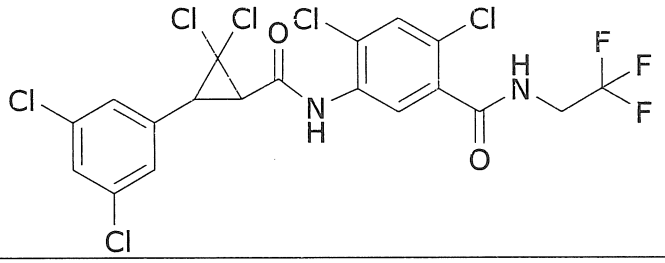
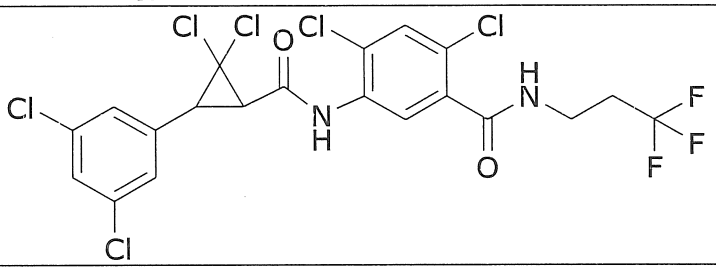
F56	
F57	
F58	
F59	
F60	
F61	

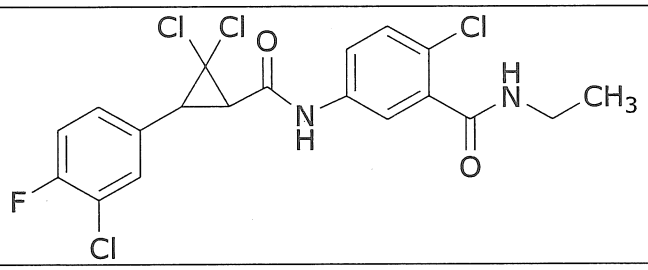
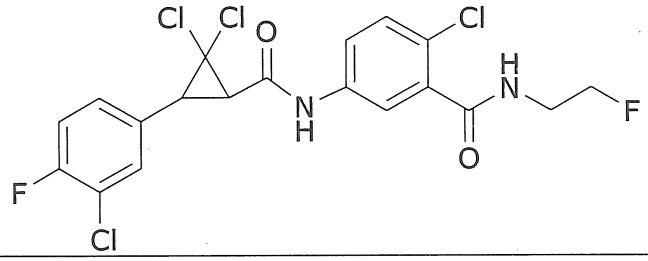
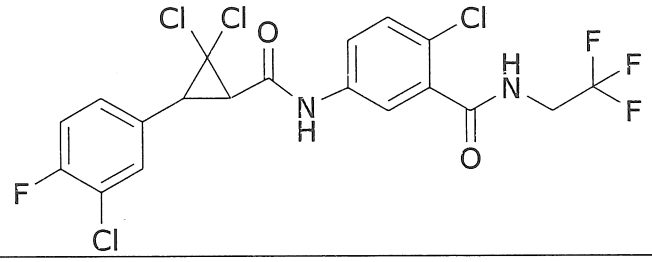
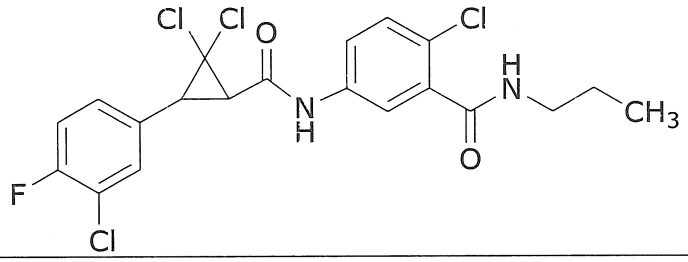
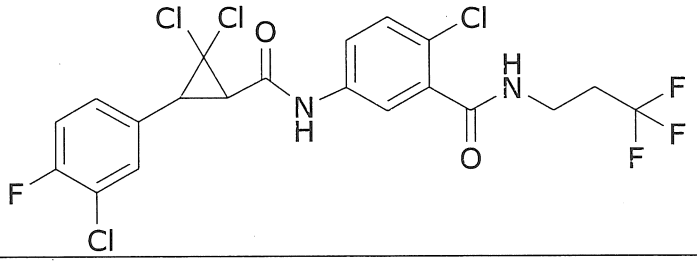
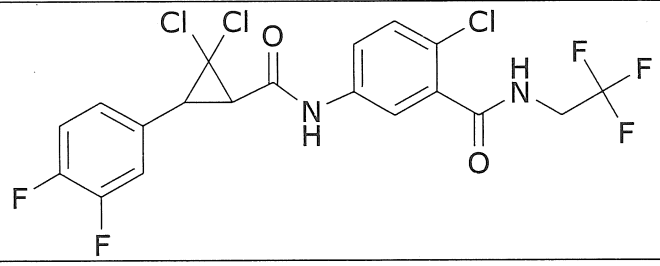
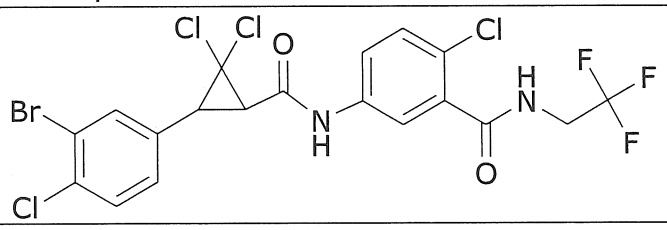
F62	
F63	
F64	
F65	
F66	
F67	

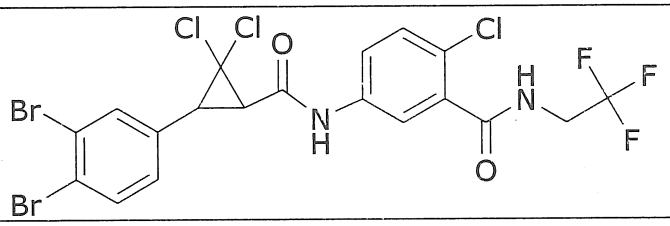
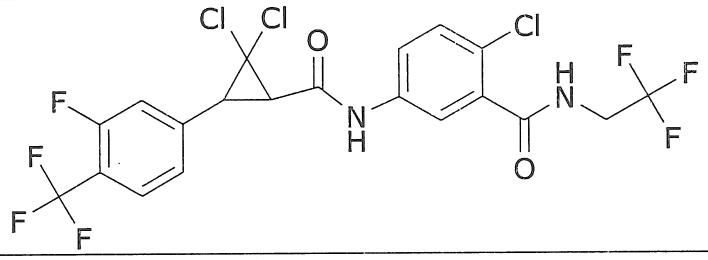
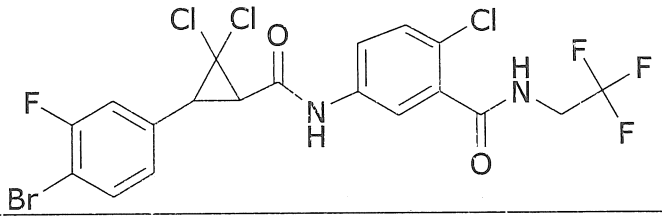
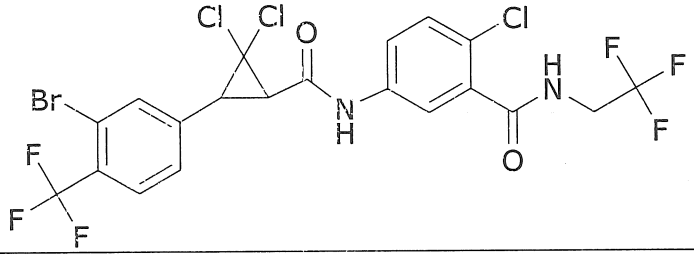
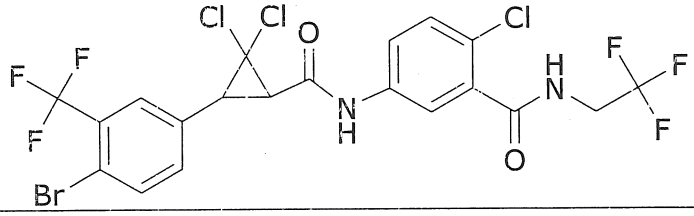
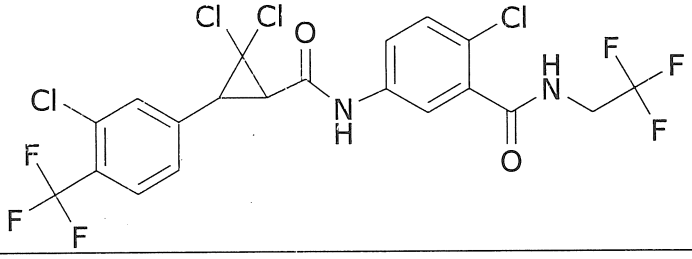
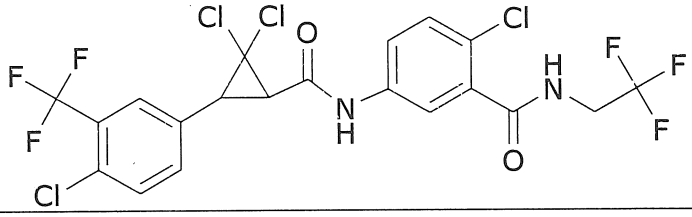
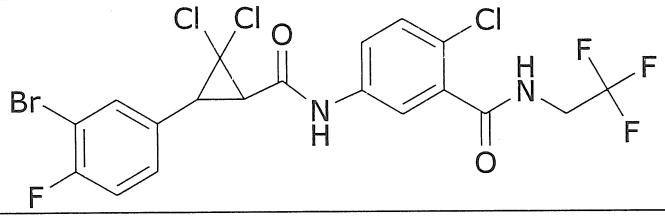
F68	
F69	
F70	
F71	
F72	
F73	

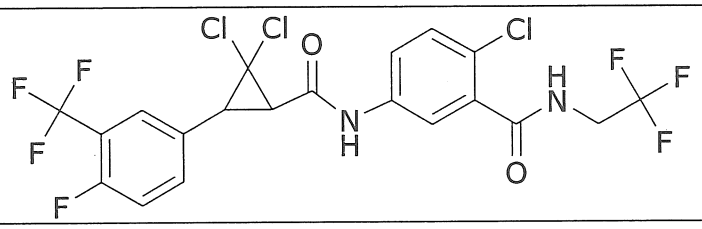
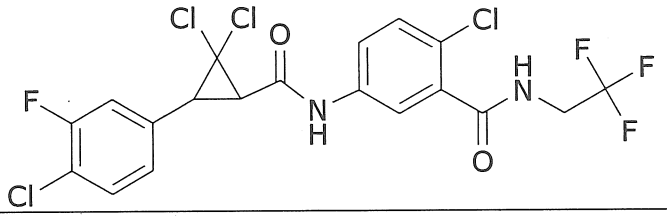
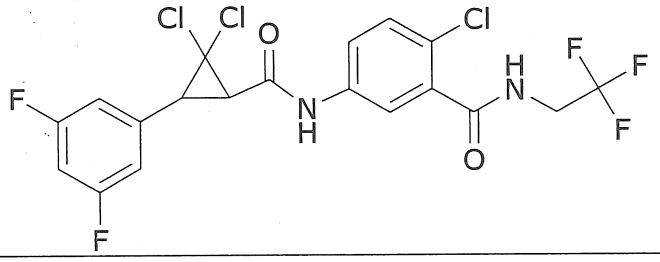
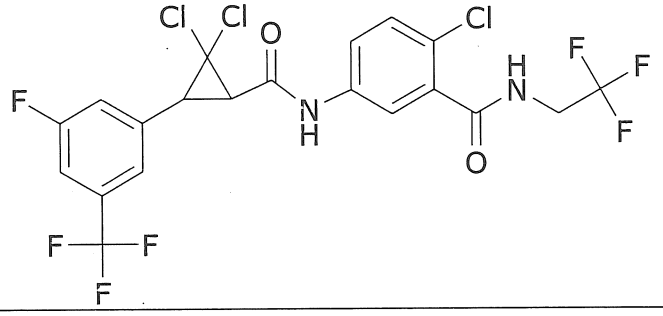
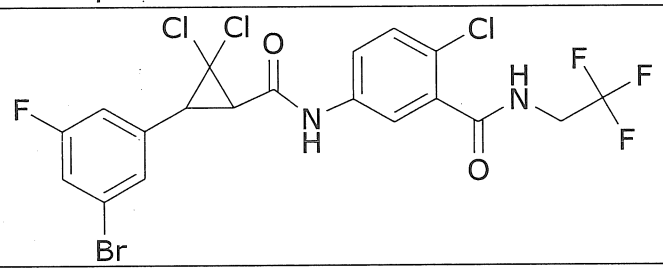
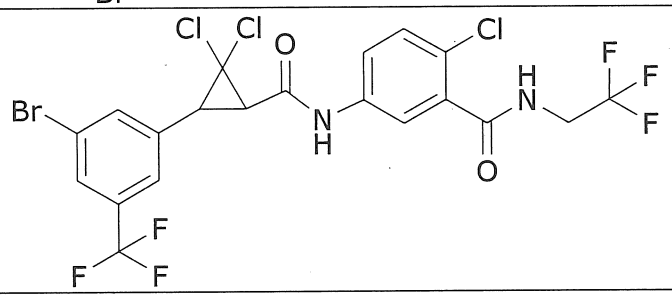
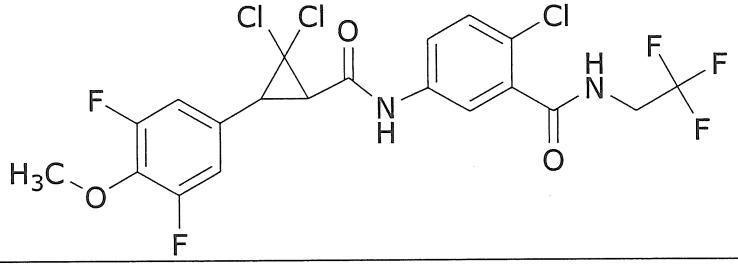
F74	
F75	
F78	
F79	
F84	
F85	
F86	

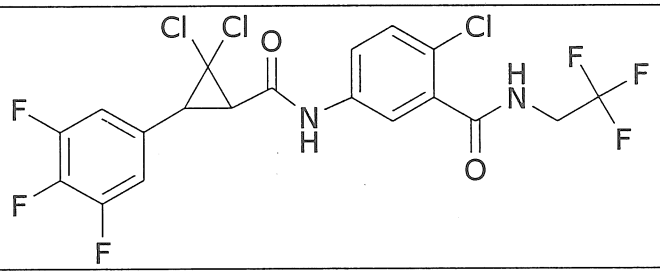
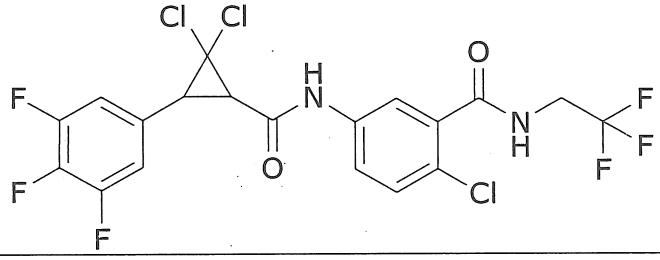
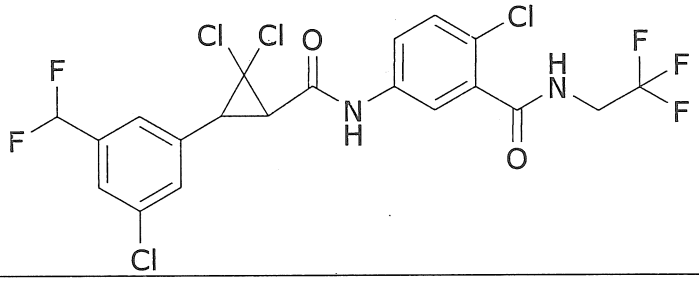
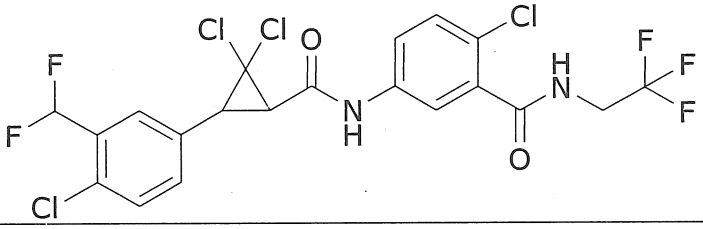
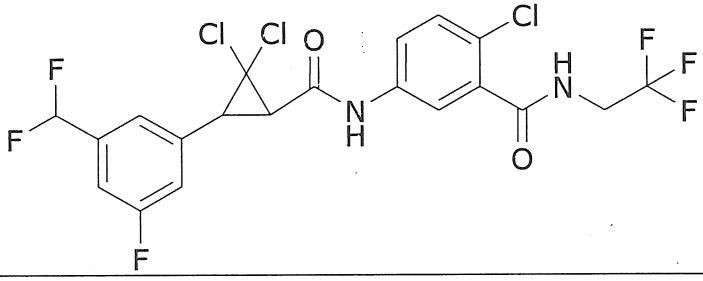
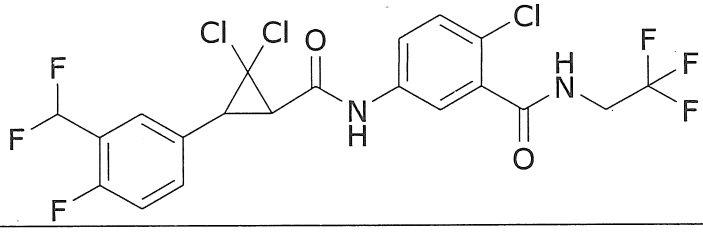
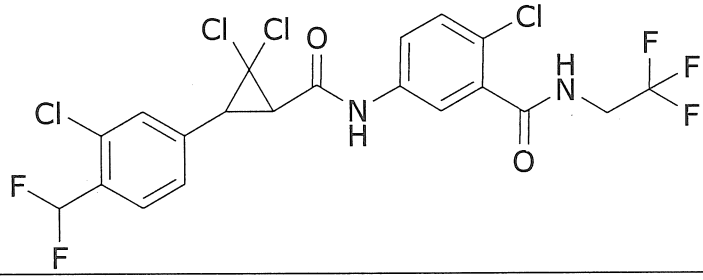
F87	
F88	
F91	
F92	
F93	
F94	

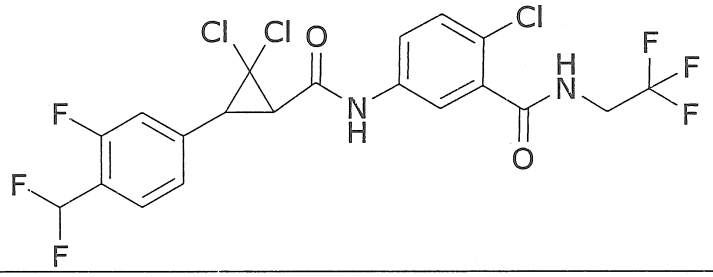
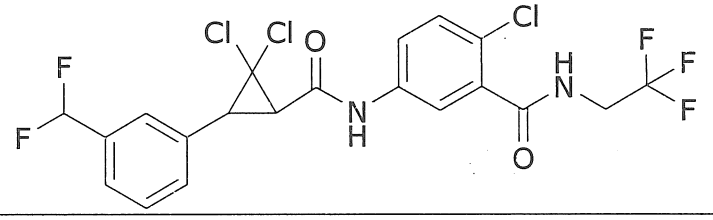
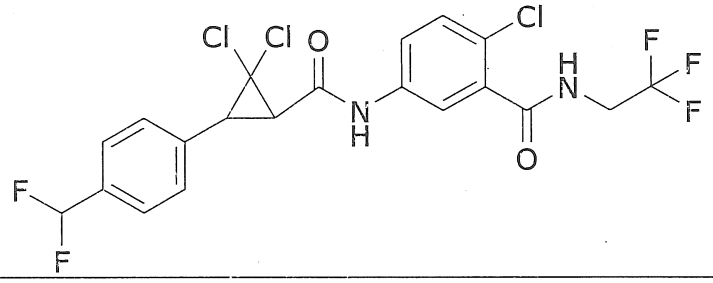
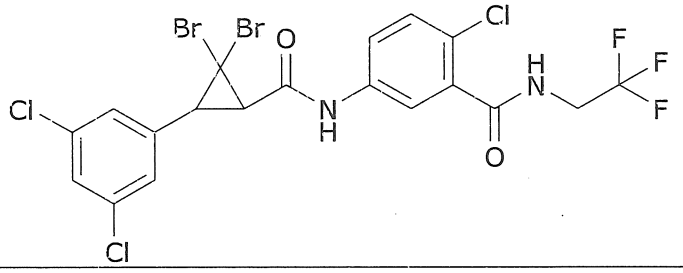
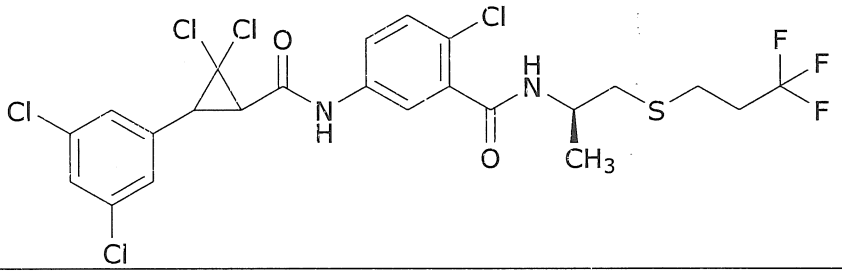
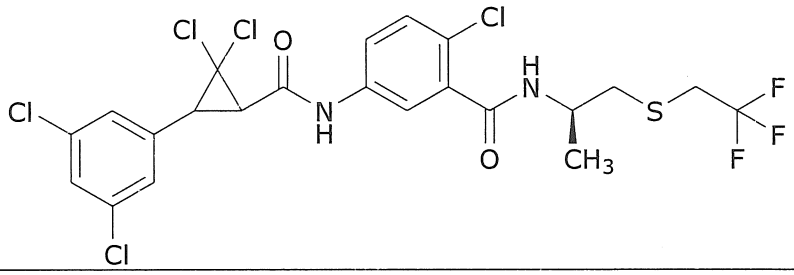
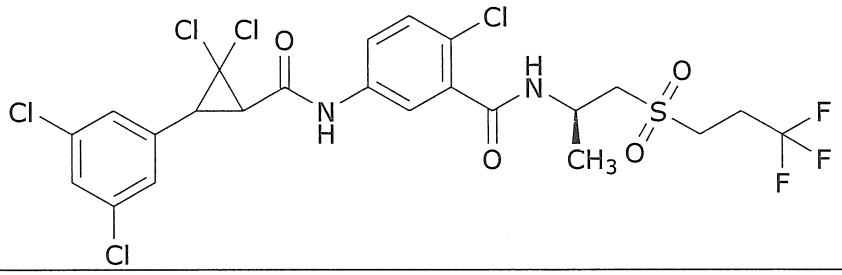
F95	
F96	
F97	
F98	
F99	
F100	
F102	

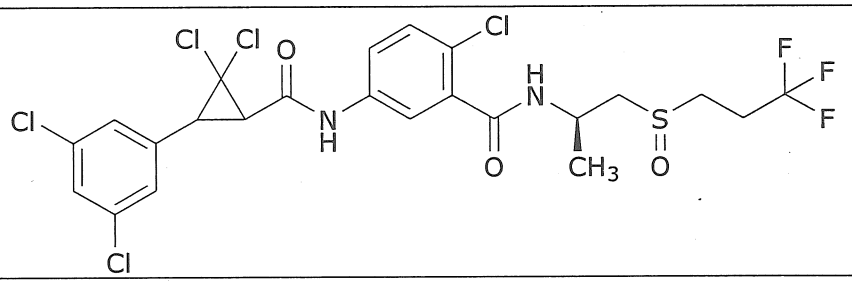
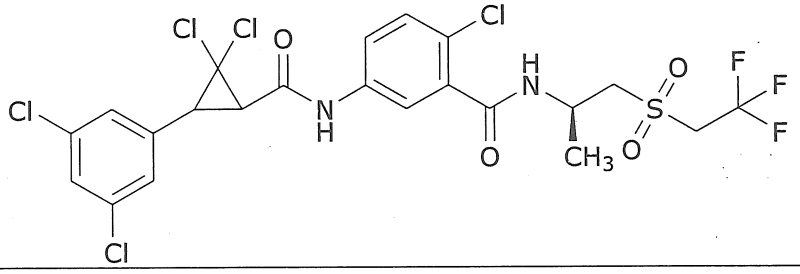
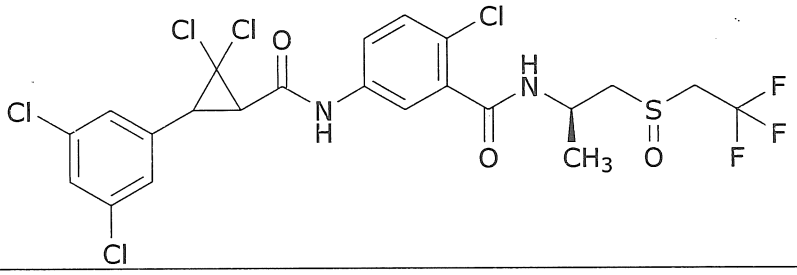
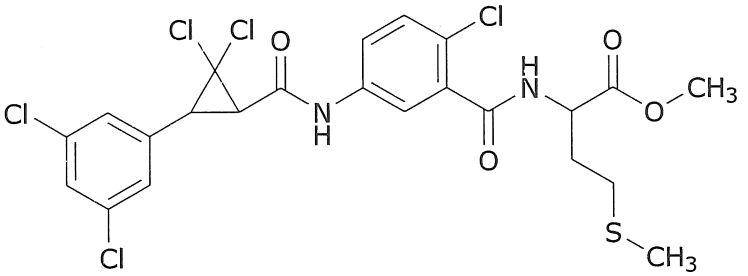
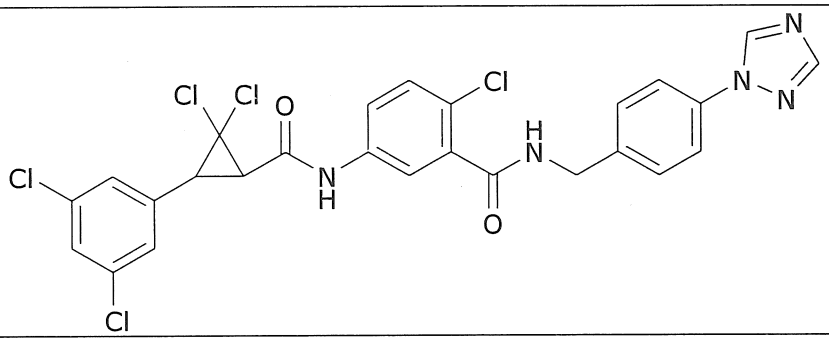
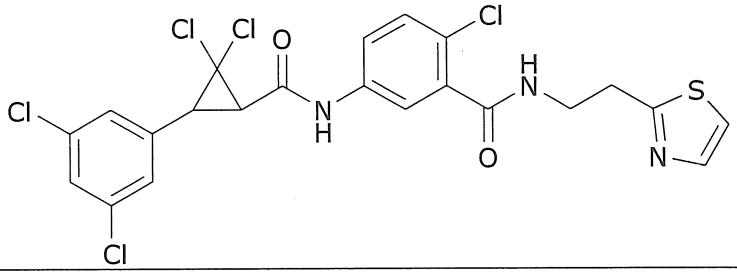
F103	
F104	
F105	
F106	
F107	
F108	
F109	

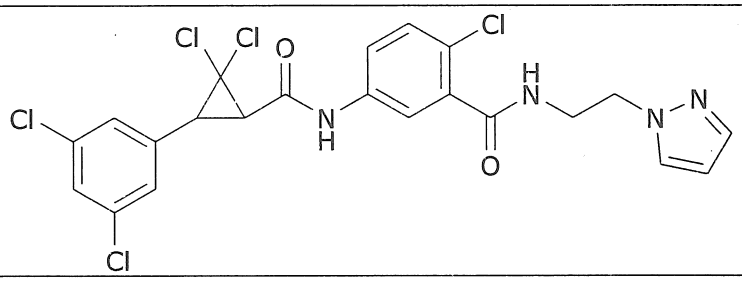
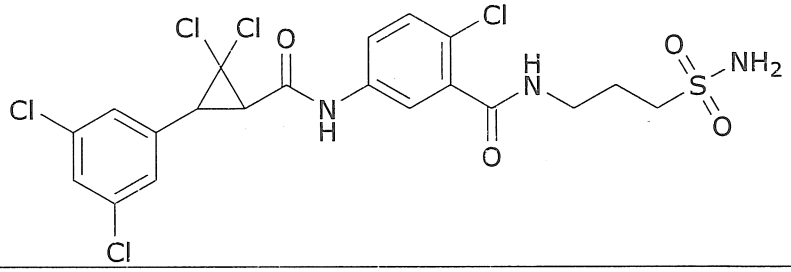
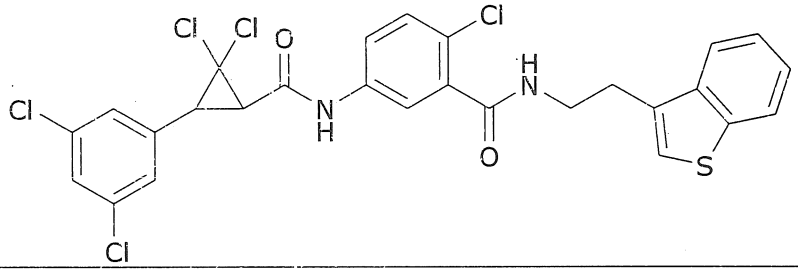
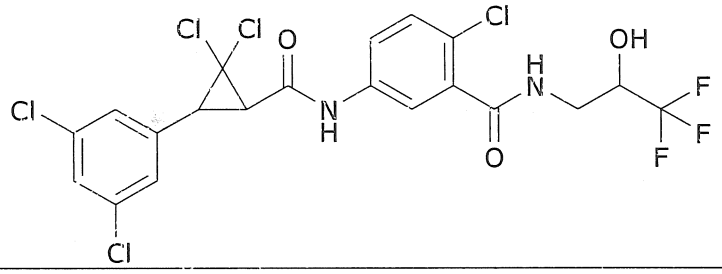
F111	
F112	
F113	
F114	
F115	
F116	
F117	
F118	

F119	
F120	
F121	
F122	
F123	
F124	
F125	

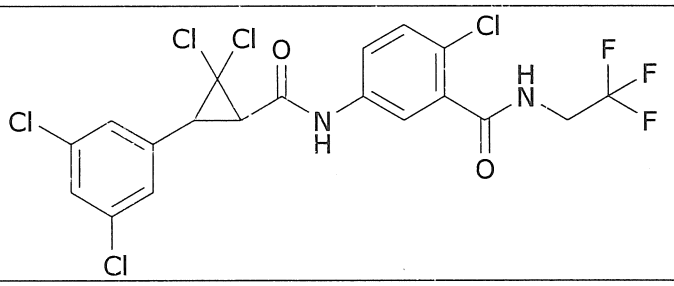
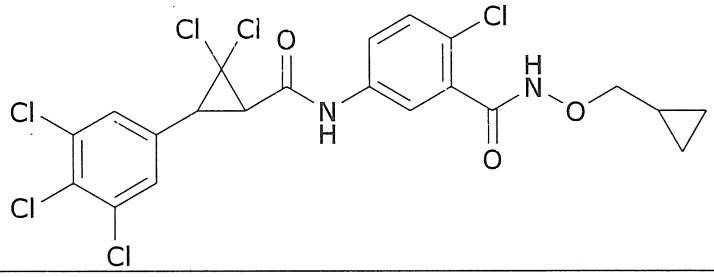
F126	
F127	
F128	
F129	
F130	
F131	
F132	

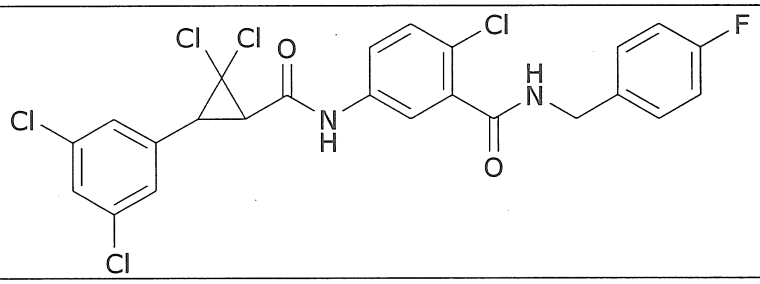
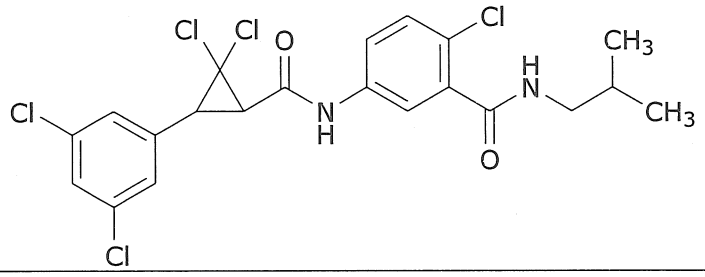
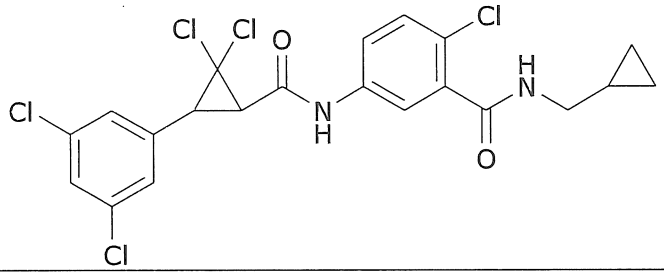
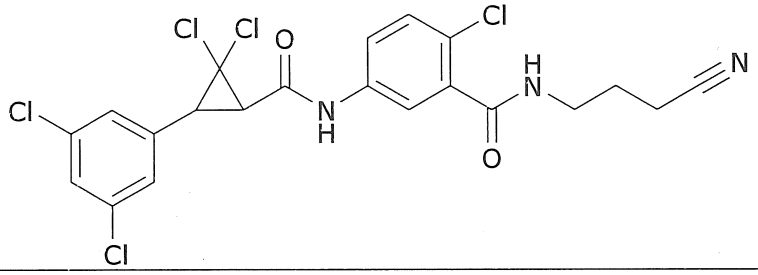
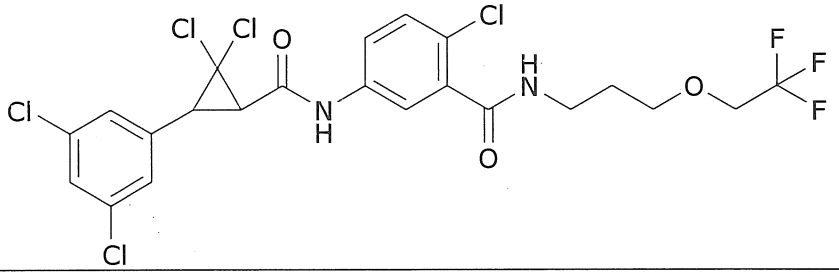
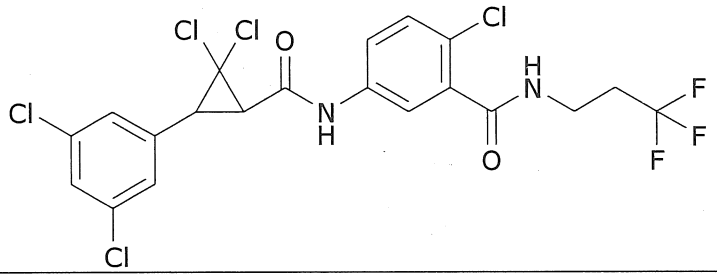
F133	
F134	
F135	
PF1	
PF2	
PF3	
PF4	

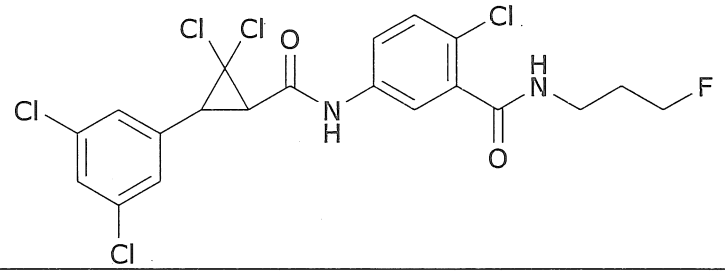
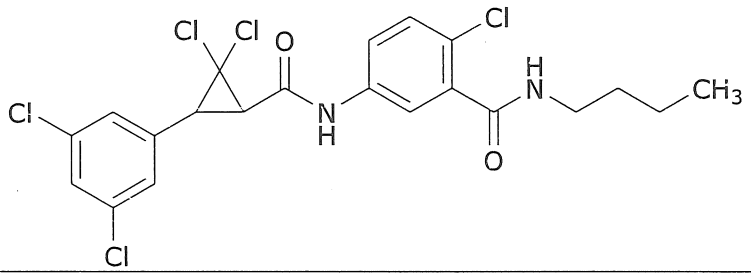
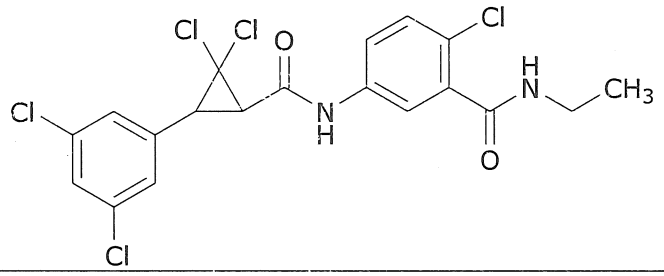
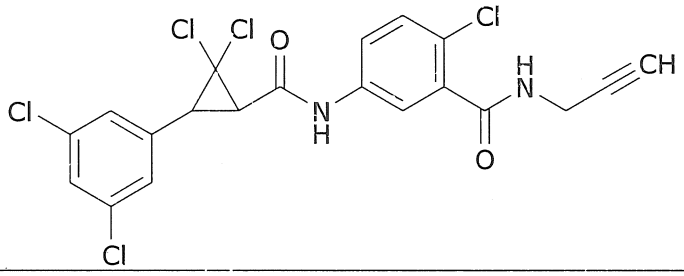
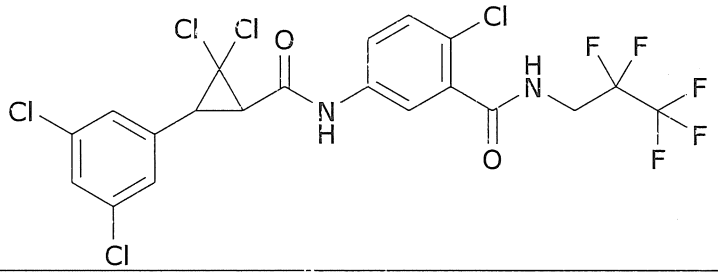
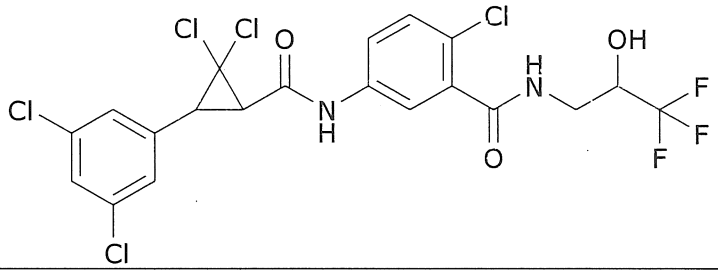
PF5	
PF6	
PF7	
PF10	
PF11	
PF12	

PF13	
PF14	
PF15	
PF16	

11. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này được chọn từ nhóm bao gồm F4, F15, F28, F30, F35, F38, F39, F40, F44, F45, F46, F47, F49, và PF16

F4	
F15	

F28	
F30	
F35	
F38	
F39	
F40	

F44	
F45	
F46	
F47	
F49	
PF16	

12. Chế phẩm diệt sinh vật gây hại chứa (a) hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên và (b) chất mang.

13. Chế phẩm diệt sinh vật gây hại chứa (a) hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 11 và (b) hoạt chất.

14. Quy trình kiểm soát sinh vật gây hại bao gồm đưa vào khu vực cần kiểm soát lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại của: (a) hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 11, hoặc (b) chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm 12 và 13.

15. Quy trình theo điểm 14, trong đó sinh vật gây hại này là sinh vật gây hại loại nhai nghiền.