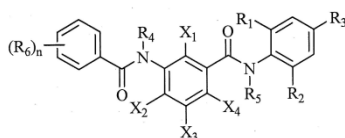




(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ  
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)   
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ  
1-0042050  
(51)<sup>2020.01</sup> C07C 237/42; C07C 255/29; A01N (13) B  
37/22; A01P 7/04

(21) 1-2020-07170 (22) 07/05/2019  
(86) PCT/CN2019/085737 07/05/2019 (87) WO/2019/214588 14/11/2019  
(30) 201810448081.X 11/05/2018 CN  
(45) 25/12/2024 441 (43) 25/03/2021 396  
(73) Metisa Biotechnology Co., Ltd (CN)  
206A, Block A, Building 4, No.23, Chuangxin Road, High-tech Zone, Nanning,  
Guangxi Province, China  
(72) ZHANG, Lixin (CN); ZHANG, Jing (CN); ZHANG, Xihan (CN); GAO, Yixing  
(CN); WANG, Jie (CN); KANG, Zhuo (CN).  
(74) CÔNG TY TRÁCH NHIỆM HỮU HẠN TƯ VẤN ĐẦU TƯ VÀ SỞ HỮU TRÍ TUỆ  
INTERFIVE (INTERFIVE CO., LTD)

(54) HỢP CHẤT BENZAMIT, CHẾ PHẨM DIỆT CÔN TRÙNG CHỨA HỢP CHẤT  
NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT CÔN TRÙNG  
(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất benzamit có công thức I, chế phẩm diệt côn trùng chứa  
hợp chất này và phương pháp kiểm soát côn trùng trong lĩnh vực nông nghiệp, lâm nghiệp  
và sức khỏe.



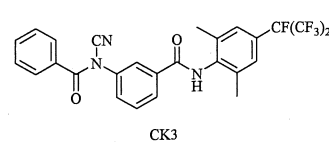
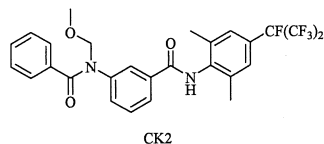
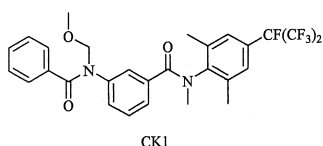
(I)

### Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

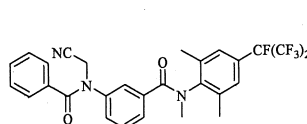
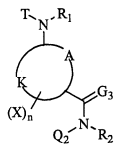
Sáng chế đề cập đến chế phẩm diệt côn trùng bảo vệ thực vật; cụ thể là đề cập đến hợp chất benzamit và việc sử dụng nó.

### Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

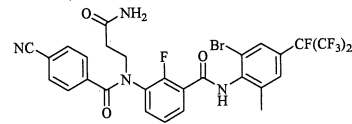
Sáng chế JP2007099761A đề cập đến hợp chất benzamit có hoạt tính diệt côn trùng, cụ thể là đề cập đến cấu trúc sau: CK1 (Hợp chất số: 1-23), CK2 (Hợp chất số: 1-24), CK3 (Hợp chất số: 1-206).



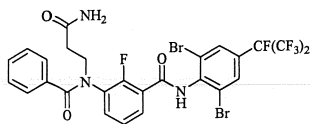
Sáng chế CN102112437A mô tả hợp chất có công thức sau và các hợp chất cụ thể CK4 (Hợp chất số: 6-18), CK5 (Hợp chất số: 1-128), CK6 (Hợp chất số: 1-163), CK7 (Hợp chất số: 1-171), CK8 (Hợp chất số: 7-130), CK9 (Hợp chất số: 7-135), CK10 (Hợp chất số: 7-169), CK11 (Hợp chất số: 7-174), CK12 (Hợp chất số: 8-111), CK13 (Hợp chất số: 8-146), CK14 (Hợp chất số: 8-155), có hoạt tính diệt côn trùng nhất định:



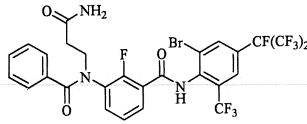
CK4



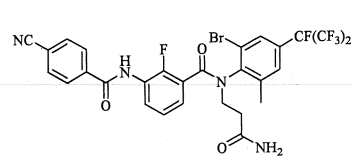
CK5



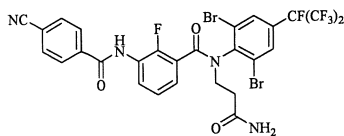
CK6



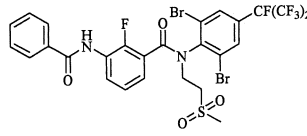
CK7



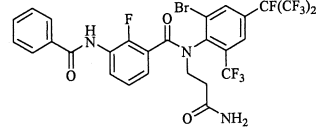
CK8



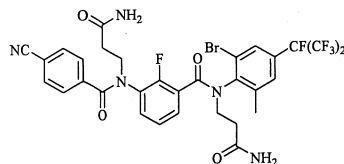
CK9



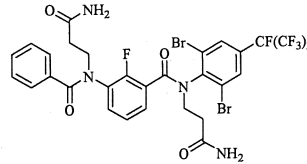
CK10



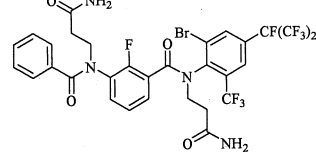
CK11



CK12

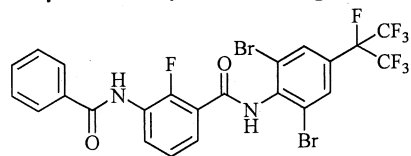


CK13



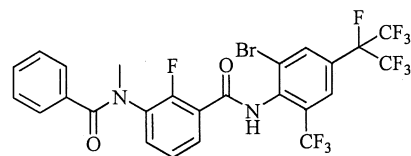
CK14

Sáng chế CN102119144A mô tả hợp chất CK15 (Hợp chất số: 3-14), có hoạt tính diệt côn trùng nhất định.



CK15

Sáng chế CN102119143A mô tả hợp chất CK16 (Hợp chất số: 7-1574); hợp chất này có hoạt tính diệt côn trùng nhất định; hơn nữa, hợp chất này được nghiên cứu và phát triển làm chất diệt côn trùng, và tên gốc của nó là broflanilit.



CK16

Không có báo cáo nào trong lĩnh vực kỹ thuật này về hợp chất có công thức I và hoạt tính diệt côn trùng của nó theo sáng chế. Hơn nữa, so với tài liệu kỹ thuật đã biết thì hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt côn trùng cao hơn và

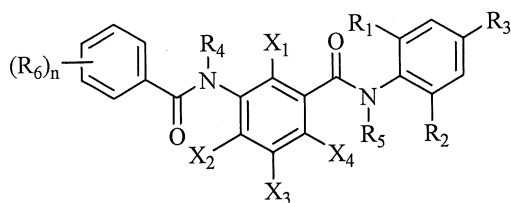
có hiệu quả diệt côn trùng nhanh siêu việt hơn.

### Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất benzamit. Hợp chất này có thể được sử dụng để sản xuất chế phẩm kiểm soát côn trùng gây hại trong lĩnh vực nông nghiệp và các lĩnh vực khác.

Giải pháp kỹ thuật của sáng chế là:

Hợp chất benzamit, có công thức I:



trong đó:

R<sub>1</sub> và R<sub>2</sub> độc lập được chọn từ H, halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkoxy;

R<sub>3</sub> được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

R<sub>4</sub> và R<sub>5</sub> độc lập được chọn từ H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất một trong các nhóm R<sub>4</sub> và R<sub>5</sub> được chọn từ xyanometyl;

R<sub>6</sub> được chọn từ H, halogen, xyano, nitryl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkoxy; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylthio hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylthio; n=1, 2, 3, 4 hoặc 5; khi n lớn hơn 1 thì R<sub>6</sub> có thể giống hoặc khác.

X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, X<sub>3</sub>, và X<sub>4</sub> độc lập được chọn từ H, halogen, xyano hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy; hơn nữa, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, X<sub>3</sub>, và X<sub>4</sub> không đồng thời là H.

Tốt hơn là, hợp chất theo sáng chế như sau: trong công thức I

R<sub>1</sub> và R<sub>2</sub> độc lập được chọn từ H, halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkoxy hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalkoxy;

R<sub>3</sub> được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

R<sub>4</sub> và R<sub>5</sub> độc lập được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất

một trong các nhóm  $R_4$  và  $R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, halogen, xyano, nitryl,  $C_1$ - $C_4$  alkyl,  $C_1$ - $C_4$  haloalkyl,  $C_1$ - $C_4$  alkoxy hoặc  $C_1$ - $C_4$  haloalkoxy;  $C_1$ - $C_4$  alkylthio hoặc  $C_1$ - $C_4$  haloalkylthio;  $n = 1, 2, 3$ , hoặc 4;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, F hoặc xyano.

Tốt hơn nữa là, hợp chất theo sáng chế như sau: trong công thức I

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  và  $R_5$  độc lập được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất một trong các nhóm  $R_4$  và  $R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyano, nitryl, metyl, etyl, propyl, tertiary butyl, triflometyl, heptaflorisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n = 1, 2$  hoặc 3;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

Tốt hơn nữa là, hợp chất theo sáng chế như sau: trong công thức I

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  được chọn từ xyanometyl;

$R_5$  được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyano, nitryl, metyl, etyl, propyl, tertiary butyl, triflometyl, heptaflorisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n = 1, 2$  hoặc 3;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

hoặc, tốt hơn nữa là, hợp chất theo sáng chế như sau: trong công thức I

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  được chọn từ H, methyl, hoặc ethyl;

$R_5$  được chọn từ xyanomethyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyno, nitryl, methyl, ethyl, propyl, tertiary butyl, triflomethyl, heptaflorisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n=1, 2$  hoặc  $3$ ;

$X_1$  được chọn từ F;

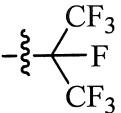
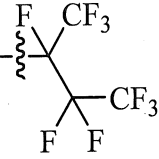
$X_2, X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

trong định nghĩa về hợp chất có công thức I nêu trên, nói chung, các thuật ngữ được sử dụng ở đây dùng cho các nhóm thế sau:

Halogen: F, Cl, Br hoặc I.

Alkyl: alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl hoặc different butyl, amyl hoặc hexyl isomers.

Haloalkyl: alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh; nguyên tử H ở các nhóm alkyl này có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bởi halogen, như clomethyl, diclomethyl, triclomethyl, flomethyl, diflomethyl, Triflomethyl, 2,2,2-trifloethyl,

heptaflorisopropyl ( , nonaflo-2-butyl ( ,

1,1,2,2,2-pentaflorethyl.

Alkoxy: alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, liên kết với một cấu trúc bằng liên kết của nguyên tử oxy, như metoxy, etoxy, tert-butoxy.

Haloalkoxy: nguyên tử H ở nhóm alkoxy có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bởi halogen, như clometoxy, diclometoxy, triclometoxy, flometoxy, diflometoxy, trifloetoxo, cloflometoxy, trifloetoxo.

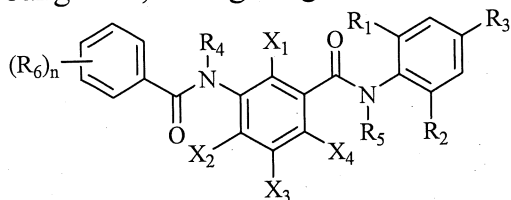
Alkylthio: alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, liên kết với một cấu trúc bằng liên kết của nguyên tử lưu huỳnh, như methylthio, ethylthio.

Haloalkylthio: nguyên tử H ở nhóm alkylthio có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bởi halogen, như diflomethylthio, trifloethylthio.

Xyanomethyl:  $CNCH_2-$ .

### Mô tả chi tiết sáng chế

Một phần các hợp chất có công thức I theo sáng chế được thể hiện trong các bảng 1-70, nhưng sáng chế không chỉ giới hạn bởi các hợp chất này.



Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CH_3$ ,  $R_3$ =heptafloisopropyl,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4$ =xyanometyl và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là nhóm thế khác so với các nhóm thế nêu ở Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 1.1-1.321.

Bảng 1

| No.  | $(R_6)_n$                           | Số   | $(R_6)_n$                                                         | Số   | $(R_6)_n$                                         |
|------|-------------------------------------|------|-------------------------------------------------------------------|------|---------------------------------------------------|
| 1.1  | 2-F                                 | 1.2  | 2-Cl                                                              | 1.3  | 2-Br                                              |
| 1.4  | 3-F                                 | 1.5  | 3-Cl                                                              | 1.6  | 3-Br                                              |
| 1.7  | 4-F                                 | 1.8  | 4-Cl                                                              | 1.9  | 4-Br                                              |
| 1.10 | 2-I                                 | 1.11 | 2-CN                                                              | 1.12 | 2-NO <sub>2</sub>                                 |
| 1.13 | 3-I                                 | 1.14 | 3-CN                                                              | 1.15 | 3-NO <sub>2</sub>                                 |
| 1.16 | 4-I                                 | 1.17 | 4-CN                                                              | 1.18 | 4-NO <sub>2</sub>                                 |
| 1.19 | 2-CH <sub>3</sub>                   | 1.20 | 2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                   | 1.21 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| 1.22 | 3-CH <sub>3</sub>                   | 1.23 | 3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                   | 1.24 | 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| 1.25 | 4-CH <sub>3</sub>                   | 1.26 | 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                   | 1.27 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| 1.28 | 2-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | 1.29 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.30 | 2-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                |
| 1.31 | 3-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | 1.32 | 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.33 | 3-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                |
| 1.34 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | 1.35 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.36 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                |
| 1.37 | 2-CF <sub>3</sub>                   | 1.38 | 2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | 1.39 | 2-OCH <sub>3</sub>                                |
| 1.40 | 3-CF <sub>3</sub>                   | 1.41 | 3-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | 1.42 | 3-OCH <sub>3</sub>                                |
| 1.43 | 4-CF <sub>3</sub>                   | 1.44 | 4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | 1.45 | 4-OCH <sub>3</sub>                                |
| 1.46 | 2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.47 | 2-OCF <sub>3</sub>                                                | 1.48 | 2-OCHF <sub>2</sub>                               |
| 1.49 | 3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.50 | 3-OCF <sub>3</sub>                                                | 1.51 | 3-OCHF <sub>2</sub>                               |

|       |                                       |       |                                                      |       |                                        |
|-------|---------------------------------------|-------|------------------------------------------------------|-------|----------------------------------------|
| 1.52  | 4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | 1.53  | 4-OCF <sub>3</sub>                                   | 1.54  | 4-OCHF <sub>2</sub>                    |
| 1.55  | 2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | 1.56  | 2-SCH <sub>3</sub>                                   | 1.57  | 2-SCF <sub>3</sub>                     |
| 1.58  | 3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | 1.59  | 3-SCH <sub>3</sub>                                   | 1.60  | 3-SCF <sub>3</sub>                     |
| 1.61  | 4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | 1.62  | 4-SCH <sub>3</sub>                                   | 1.63  | 4-SCF <sub>3</sub>                     |
| 1.64  | 2,3-2F                                | 1.65  | 2,3-2Cl                                              | 1.66  | 2,3-2Br                                |
| 1.67  | 2,4-2F                                | 1.68  | 2,4-2Cl                                              | 1.69  | 2,4-2Br                                |
| 1.70  | 2,5-2F                                | 1.71  | 2,5-2Cl                                              | 1.72  | 2,5-2Br                                |
| 1.73  | 2,6-2F                                | 1.74  | 2,6-2Cl                                              | 1.75  | 2,6-2Br                                |
| 1.76  | 3,4-2F                                | 1.77  | 3,4-2Cl                                              | 1.78  | 3,4-2Br                                |
| 1.79  | 3,5-2F                                | 1.80  | 3,5-2Cl                                              | 1.81  | 3,5-2Br                                |
| 1.82  | 2,3-2CN                               | 1.83  | 2,3-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.84  | 2,3-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.85  | 2,4-2CN                               | 1.86  | 2,4-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.87  | 2,4-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.88  | 2,5-2CN                               | 1.89  | 2,5-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.90  | 2,5-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.91  | 2,6-2CN                               | 1.92  | 2,6-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.93  | 2,6-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.94  | 3,4-2CN                               | 1.95  | 3,4-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.96  | 3,4-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.97  | 3,5-2CN                               | 1.98  | 3,5-2NO <sub>2</sub>                                 | 1.99  | 3,5-2CH <sub>3</sub>                   |
| 1.100 | 2,3-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.101 | 2,3-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.102 | 2,3-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.103 | 2,4-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.104 | 2,4-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.105 | 2,4-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.106 | 2,5-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.107 | 2,5-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.108 | 2,5-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.109 | 2,6-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.110 | 2,6-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.111 | 2,6-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.112 | 3,4-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.113 | 3,4-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.114 | 3,4-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.115 | 3,5-2C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | 1.116 | 3,5-2(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.117 | 3,5-2CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |
| 1.118 | 2,3-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.119 | 2,3-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.120 | 2,3-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.121 | 2,4-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.122 | 2,4-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.123 | 2,4-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.124 | 2,5-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.125 | 2,5-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.126 | 2,5-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.127 | 2,6-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.128 | 2,6-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.129 | 2,6-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.130 | 3,4-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.131 | 3,4-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.132 | 3,4-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.133 | 3,5-2C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.134 | 3,5-2CF <sub>3</sub>                                 | 1.135 | 3,5-2OCH <sub>3</sub>                  |
| 1.136 | 2,3-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.137 | 2,3-2SCH <sub>3</sub>                                | 1.138 | 2,3-2SCF <sub>3</sub>                  |



|       |                                       |       |                                                     |       |                                                    |
|-------|---------------------------------------|-------|-----------------------------------------------------|-------|----------------------------------------------------|
| 1.139 | 2,4-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.140 | 2,4-2SCH <sub>3</sub>                               | 1.141 | 2,4-2SCF <sub>3</sub>                              |
| 1.142 | 2,5-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.143 | 2,5-2SCH <sub>3</sub>                               | 1.144 | 2,5-2SCF <sub>3</sub>                              |
| 1.145 | 2,6-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.146 | 2,6-2SCH <sub>3</sub>                               | 1.147 | 2,6-2SCF <sub>3</sub>                              |
| 1.148 | 3,4-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.149 | 3,4-2SCH <sub>3</sub>                               | 1.150 | 3,4-2SCF <sub>3</sub>                              |
| 1.151 | 3,5-2OCF <sub>3</sub>                 | 1.152 | 3,5-2SCH <sub>3</sub>                               | 1.153 | 3,5-2SCF <sub>3</sub>                              |
| 1.154 | 2-F-4-Cl                              | 1.155 | 2-F-4-Br                                            | 1.156 | 2-F-4-I                                            |
| 1.157 | 2-F-3-Cl                              | 1.158 | 2-F-5-Cl                                            | 1.159 | 2-F-6-Cl                                           |
| 1.160 | 3-F-2-Cl                              | 1.161 | 3-F-4-Cl                                            | 1.162 | 3-F-5-Cl                                           |
| 1.163 | 3-F-6-Cl                              | 1.164 | 4-F-2-Cl                                            | 1.165 | 4-F-3-Cl                                           |
| 1.166 | 2-Cl-4-Br                             | 1.167 | 2-Cl-4-I                                            | 1.168 | 3-Cl-4-I                                           |
| 1.169 | 4-Cl-2-Br                             | 1.170 | 2-CN-3-F                                            | 1.171 | 2-CN-3-Cl                                          |
| 1.172 | 2-CN-4-Cl                             | 1.173 | 2-CN-4-Br                                           | 1.174 | 2-CN-4-NO <sub>2</sub>                             |
| 1.175 | 4-CN-2-Cl                             | 1.176 | 4-CN-2-CF <sub>3</sub>                              | 1.177 | 4-CN-2-NO <sub>2</sub>                             |
| 1.178 | 2-NO <sub>2</sub> -4-F                | 1.179 | 2-NO <sub>2</sub> -4-Cl                             | 1.180 | 2-NO <sub>2</sub> -4-Br                            |
| 1.181 | 2-NO <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | 1.182 | 2-NO <sub>2</sub> -4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 1.183 | 2-NO <sub>2</sub> -5-Cl                            |
| 1.184 | 3-NO <sub>2</sub> -4-F                | 1.185 | 3-NO <sub>2</sub> -4-Cl                             | 1.186 | 3-NO <sub>2</sub> -4-Br                            |
| 1.187 | 4-NO <sub>2</sub> -2-Cl               | 1.188 | 4-NO <sub>2</sub> -2-OCH <sub>3</sub>               | 1.189 | 5-NO <sub>2</sub> -2-F                             |
| 1.190 | 5-NO <sub>2</sub> -2-Cl               | 1.191 | 5-NO <sub>2</sub> -2-Br                             | 1.192 | 5-NO <sub>2</sub> -2-OCH <sub>3</sub>              |
| 1.193 | 2-CH <sub>3</sub> -4-F                | 1.194 | 2-CH <sub>3</sub> -4-Cl                             | 1.195 | 2-CH <sub>3</sub> -4-Br                            |
| 1.196 | 2-CH <sub>3</sub> -4-I                | 1.197 | 2-CH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>                | 1.198 | 2-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub>              |
| 1.199 | 2-CH <sub>3</sub> -3-F                | 1.200 | 2-CH <sub>3</sub> -3-Cl                             | 1.201 | 2-CH <sub>3</sub> -3-NO <sub>2</sub>               |
| 1.202 | 2-CH <sub>3</sub> -5-F                | 1.203 | 2-CH <sub>3</sub> -5-Cl                             | 1.204 | 2-CH <sub>3</sub> -5-Br                            |
| 1.205 | 2-CH <sub>3</sub> -5-NO <sub>2</sub>  | 1.206 | 2-CH <sub>3</sub> -6-Cl                             | 1.207 | 2-CH <sub>3</sub> -6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |
| 1.208 | 2-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>  | 1.209 | 3-CH <sub>3</sub> -2-Cl                             | 1.210 | 3-CH <sub>3</sub> -2-Br                            |
| 1.211 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Cl               | 1.212 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Br                             | 1.213 | 3-CH <sub>3</sub> -4-I                             |
| 1.214 | 4-CH <sub>3</sub> -2-Cl               | 1.215 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Cl                             | 1.216 | 4-CH <sub>3</sub> -2-Br                            |
| 1.217 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Br               | 1.218 | 4-CH <sub>3</sub> -3-F                              | 1.219 | 4-CH <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub>               |
| 1.220 | 4-CH <sub>3</sub> -3-NO <sub>2</sub>  | 1.221 | 5-CH <sub>3</sub> -2-F                              | 1.222 | 5-CH <sub>3</sub> -2-CN                            |
| 1.223 | 5-CH <sub>3</sub> -2-OCH <sub>3</sub> | 1.224 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -2-Cl            | 1.225 | 2-CF <sub>3</sub> -4-Cl                            |

|       |                                                          |       |                                            |       |                                            |
|-------|----------------------------------------------------------|-------|--------------------------------------------|-------|--------------------------------------------|
| 1.226 | 2-CF <sub>3</sub> -4-Br                                  | 1.227 | 2-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>       | 1.228 | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                     |
| 1.229 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                                  | 1.230 | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>       | 1.231 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Cl                    |
| 1.232 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Br                                  | 1.233 | 4-CF <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub>       | 1.234 | 5-CF <sub>3</sub> -2-Cl                    |
| 1.235 | 5-CF <sub>3</sub> -2-Br                                  | 1.236 | 5-CF <sub>3</sub> -2-OCH <sub>3</sub>      | 1.237 | 2-OCH <sub>3</sub> -5-Cl                   |
| 1.238 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-F                                  | 1.239 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-Cl                   | 1.240 | 2-OCF <sub>3</sub> -4-Cl                   |
| 1.241 | 2-OCF <sub>3</sub> -4-Br                                 | 1.242 | 2-OCF <sub>3</sub> -4-CN                   | 1.243 | 4-OCF <sub>3</sub> -2-Cl                   |
| 1.244 | 4-OCF <sub>3</sub> -2-Br                                 | 1.245 | 4-OCF <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub>      | 1.246 | 2-SCH <sub>3</sub> -5-Cl                   |
| 1.247 | 2,3,4-3F                                                 | 1.248 | 2,3,4-3Cl                                  | 1.249 | 2,3,4-3Br                                  |
| 1.250 | 2,3,5-3F                                                 | 1.251 | 2,3,5-3Cl                                  | 1.252 | 2,3,5-3Br                                  |
| 1.253 | 2,3,6-3F                                                 | 1.254 | 2,3,6-3Cl                                  | 1.255 | 2,3,6-3Br                                  |
| 1.256 | 2,4,5-3F                                                 | 1.257 | 2,4,5-3Cl                                  | 1.258 | 2,4,5-3Br                                  |
| 1.259 | 2,4,6-3F                                                 | 1.260 | 2,4,6-3Cl                                  | 1.261 | 2,4,6-3Br                                  |
| 1.262 | 3,4,5-3F                                                 | 1.263 | 3,4,5-3Cl                                  | 1.264 | 3,4,5-3Br                                  |
| 1.265 | 2,4,6-3CH <sub>3</sub>                                   | 1.266 | 2,4,6-3C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | 1.267 | 2,4,6-3CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   |
| 1.268 | 2,4,6-3C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                  | 1.269 | 2,4,6-3CF <sub>3</sub>                     | 1.270 | 2,4,6-3NO <sub>2</sub>                     |
| 1.271 | 2,4,6-3OCH <sub>3</sub>                                  | 1.272 | 3,4,5-3OCH <sub>3</sub>                    | 1.273 | 2,4,6-3OCF <sub>3</sub>                    |
| 1.274 | 2,4,6-3SCH <sub>3</sub>                                  | 1.275 | 2,4,6-3SCF <sub>3</sub>                    | 1.276 | 2-F-4,6-2Br                                |
| 1.277 | 2-F-4-Cl-6-Br                                            | 1.278 | 4-F-2,6-2Br                                | 1.279 | 2,4-2F-6-Cl                                |
| 1.280 | 2,3-2Cl-4-Br                                             | 1.281 | 2-CH <sub>3</sub> -4,6-2Br                 | 1.282 | 3-CH <sub>3</sub> -2,6-2Cl                 |
| 1.283 | 4-CH <sub>3</sub> -2,6-2Br                               | 1.284 | 2,3-2CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>    | 1.285 | 4,5-2CH <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub>    |
| 1.286 | 2,6-2CH <sub>3</sub> -4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | 1.287 | 2-CH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub> -6-Cl | 1.288 | 2-CH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub> -6-Br |
| 1.289 | 2-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> -4-Cl               | 1.290 | 2-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> -4-Br | 1.291 | 5-CH <sub>3</sub> -4-F-6-Cl                |
| 1.292 | 5-CH <sub>3</sub> -2-OCH <sub>3</sub> -4-Cl              | 1.293 | 2-CF <sub>3</sub> -4,6-2Cl                 | 1.294 | 2-CF <sub>3</sub> -4,6-2Br                 |
| 1.295 | 4-CF <sub>3</sub> -2,6-2Cl                               | 1.296 | 4-CF <sub>3</sub> -2,6-2Br                 | 1.297 | 4-CF <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub> -5-Cl |
| 1.298 | 4-CF <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub> -6-Cl               | 1.299 | 4-CF <sub>3</sub> -2-NO <sub>2</sub> -6-Br | 1.300 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Cl-6-Br               |
| 1.301 | 2-NO <sub>2</sub> -4,6-2Br                               | 1.302 | 2-NO <sub>2</sub> -4-F-5-Cl                | 1.303 | 4-NO <sub>2</sub> -2,6-2Cl                 |
| 1.304 | 4-NO <sub>2</sub> -2,6-2Br                               | 1.305 | 4-NO <sub>2</sub> -2,5-2Cl                 | 1.306 | 2,4-2NO <sub>2</sub> -6-Cl                 |
| 1.307 | 2,4-2NO <sub>2</sub> -6-Br                               | 1.308 | 2-CN-4,6-2Cl                               | 1.309 | 2-CN-4,6-2Br                               |
| 1.310 | 4-CN-2,6-2Cl                                             | 1.311 | 2-CN-4-NO <sub>2</sub> -6-Cl               | 1.312 | 2-CN-4-NO <sub>2</sub> -6-Br               |

|       |                                          |       |                              |       |              |
|-------|------------------------------------------|-------|------------------------------|-------|--------------|
| 1.313 | 2,5-2OCH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub> | 1.314 | 2,4-2OCH <sub>3</sub> -5-Cl  | 1.315 | 2,3,5,6-4F   |
| 1.316 | 4-F-3-Cl-2,6-2Br                         | 1.317 | 6-NO <sub>2</sub> -2,3,4-3F  | 1.318 | 2,3,4,5,6-5F |
| 1.319 | 2,3,4,5,6-5Cl                            | 1.320 | 2,3,5,6-4F-4-CF <sub>3</sub> | 1.321 | H            |

Bảng 2: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Br$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 2.1-2.321.

Bảng 3: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 3.1-3.321.

Bảng 4: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 4.1-4.321.

Bảng 5: Trong công thức I, khi  $R_1=CH_3$ ,  $R_2=CH_2CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1, là các hợp chất được đánh số: 5.1-5.321.

Bảng 6: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 6.1-6.321.

Bảng 7: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 7.1-7.321.

Bảng 8: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=I$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong

Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 8.1-8.321.

Bảng 9: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 9.1-9.321.

Bảng 10: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 10.1-10.321.

Bảng 11: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 11.1-11.321.

Bảng 12: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 12.1-12.321.

Bảng 13: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 13.1-13.321.

Bảng 14: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=H$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 14.1-14.321.

Bảng 15: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 15.1-15.321.

Bảng 16: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Br$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 16.1-16.321.

Bảng 17: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 17.1-17.321.

Bảng 18: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 18.1-18.321.

Bảng 19: Trong công thức I, khi  $R_1=CH_3$ ,  $R_2=CH_2CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 19.1-19.321.

Bảng 20: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 20.1-20.321.

Bảng 21: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 21.1-21.321.

Bảng 22: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=I$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 22.1-22.321.

Bảng 23: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong

Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 23.1-23.321.

Bảng 24: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 24.1-24.321.

Bảng 25: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 25.1-25.321.

Bảng 26: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 26.1-26.321.

Bảng 27: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 27.1-27.321.

Bảng 28: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=H$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 28.1-28.321.

Bảng 29: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 29.1-29.321.

Bảng 30: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Br$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 30.1-30.321.

Bảng 31: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 31.1-31.321.

Bảng 32: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 32.1-32.321.

Bảng 33: Trong công thức I, khi  $R_1=CH_3$ ,  $R_2=CH_2CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 33.1-33.321.

Bảng 34: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 34.1-34.321.

Bảng 35: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=Cl$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 35.1-35.321.

Bảng 36: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=I$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 36.1-36.321.

Bảng 37: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 37.1-37.321.

Bảng 38: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptafloisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có

trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 38.1-38.321.

Bảng 39: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 39.1-39.321.

Bảng 40: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 40.1-40.321.

Bảng 41: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 41.1-41.321.

Bảng 42: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=CH_3$  và  $R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 42.1-42.321.

Bảng 43: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 43.1-43.321.

Bảng 44: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Br$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là nhóm thế khác so với các nhóm thế nêu ở Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1, và là các hợp chất được đánh số: 44.1-44.321.

Bảng 45: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Cl$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 45.1-45.321.



Bảng 46: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 46.1-46.321.

Bảng 47: Trong công thức I, khi  $R_1=CH_3$ ,  $R_2=CH_2CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 47.1-47.321.

Bảng 48: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 48.1-48.321.

Bảng 49: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=Cl$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 49.1-49.321.

Bảng 50: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=I$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là nhóm thế khác so với các nhóm thế nêu ở Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1, và là các hợp chất được đánh số: 50.1-50.321.

Bảng 51: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 51.1-51.321.

Bảng 52: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 52.1-52.321.

Bảng 53: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có

trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 53.1-53.321.

Bảng 54: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 54.1-54.321.

Bảng 55: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 55.1-55.321.

Bảng 56: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$ ,  $R_4=xyanometyl$  và  $R_5=CH_3$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 56.1-56.321.

Bảng 57: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 57.1-57.321.

Bảng 58: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Br$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 58.1-58.321.

Bảng 59: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=Cl$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 59.1-59.321.

Bảng 60: Trong công thức I, khi  $R_1=R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 60.1-60.321.

Bảng 61: Trong công thức I, khi  $R_1=CH_3$ ,  $R_2=CH_2CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 61.1-61.321.

Bảng 62: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CH_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 62.1-62.321.

Bảng 63: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=Cl$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 63.1-63.321.

Bảng 64: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=I$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 64.1-64.321.

Bảng 65: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 65.1-65.321.

Bảng 66: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 66.1-66.321.

Bảng 67: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=CF_3$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 67.1-67.321.

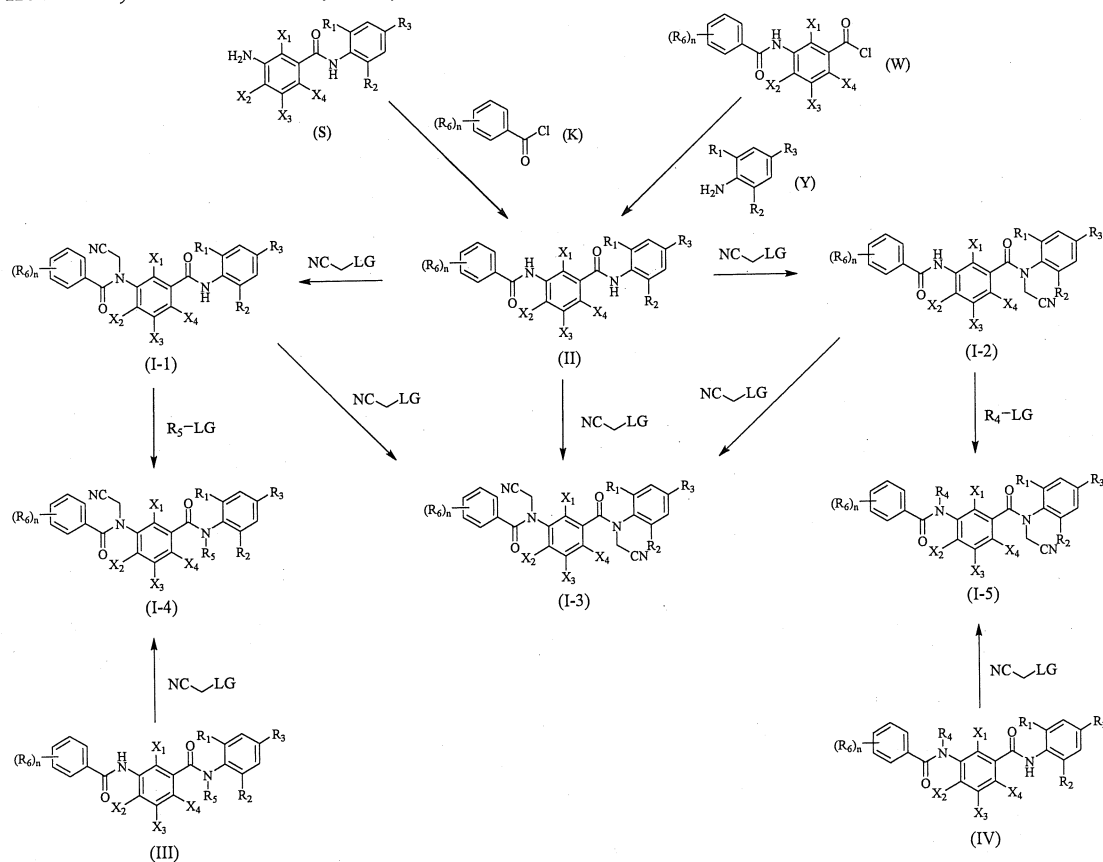
Bảng 68: Trong công thức I, khi  $R_1=Br$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptaflorisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có

trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 68.1-68.321.

Bảng 69: Trong công thức I, khi  $R_1=Cl$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 69.1-69.321.

Bảng 70: Trong công thức I, khi  $R_1=I$ ,  $R_2=OCHF_2$ ,  $R_3=heptafluoroisopropyl$ ,  $X_1=F$ ,  $X_2=X_3=X_4=H$  và  $R_4=R_5=xyanometyl$ ,  $(R_6)_n$  là một nhóm thế khác có trong Bảng 1, lần lượt tương ứng với các nhóm thế được đánh số 1.1-1.321 của Bảng 1; và là các hợp chất được đánh số: 70.1-70.321.

Hợp chất có công thức I theo sáng chế có thể được điều chế theo phương pháp sau đây (trong đó, trừ khi được quy định khác, định nghĩa của mỗi nhóm sẽ như nêu trên; và  $LG=Cl$  hoặc  $Br$ ):



Hợp chất có công thức S và hợp chất có công thức K, hoặc hợp chất có công thức W và hợp chất có công thức Y phản ứng với nhau trong dung môi thích hợp ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}C$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5

đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức II; và phản ứng được tiến hành khi có mặt kiềm.

Hợp chất có công thức II phản ứng với haloaxetonitril khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế các hợp chất tương ứng có công thức I-1, I-2 và I-3. Hợp chất có công thức 1 hoặc 2 phản ứng với haloaxetonitril khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức I-3. Hợp chất có công thức I-1 và hợp chất có công thức  $\text{R}_5\text{-LG}$  phản ứng với nhau khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức I-4. Hợp chất có công thức I-2 phản ứng với hợp chất  $\text{R}_4\text{-LG}$  khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức I-5. Hợp chất có công thức III ( $\text{R}_5$  chỉ là  $\text{C}_1\text{-C}_6$  alkyl hoặc  $\text{C}_1\text{-C}_6$  haloalkyl) phản ứng với haloaxetonitril khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức I-4. Hợp chất có công thức IV ( $\text{R}_4$  chỉ là  $\text{C}_1\text{-C}_6$  alkyl hoặc  $\text{C}_1\text{-C}_6$  haloalkyl) phản ứng với haloaxetonitril khi có mặt dung môi thích hợp và kiềm ở nhiệt độ từ  $-10^{\circ}\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi trong thời gian từ 0,5 đến 48 giờ để điều chế hợp chất có công thức I-5 tương ứng.

Dung môi nêu trên có thể được chọn từ các hydrocacbon thơm như benzen, metylbenzen và xylen, các keton như axeton, metyl etyl keton và metyl isobutyl keton, halohydrocacbon như cloform và diclometan, este như metyl axetat và etyl axetat, ete như tetrahydrofuran, dioxane, dietyl êtê và 1,2-dimetoxyetan, dung môi phân cực như nước, axetonitril, N, N-dimetylformamit, N-metyl pyrrolidon và dimetyl sulfoxit hoặc hỗn hợp các dung môi nêu trên. Kiềm thích hợp có thể được chọn từ các kiềm hữu cơ như trietylamin, pyridin, DBU, 4-dimetylamiopyridin, hydrit của kim loại kiềm như natri hydrua và kali hydrua, kiềm metal hydroxit như natri hydroxit và kali

hydroxit, hydroxit của kim loại kiềm thổ như canxi hydroxit, kiềm cacbonat như natri cacbonat và kali cacbonat, kiềm metal bicarbonat như natri bicarbonat, và alkoxit kim loại như natri metylat, natri etoxit, kali etoxit, kali tert-butoxit và natri tert-butoxit.

Hợp chất có công thức  $R_4-LG$ , Công thức  $R_5-LG$ , Công thức K và Công thức  $CNCH_2-LG$  cũng như kiềm thường được bán sẵn trên thị trường, và cũng có thể được điều chế theo phương pháp thông thường. Hợp chất có công thức S, Công thức W, Công thức Y, Công thức II, Công thức III và Công thức IV có thể được điều chế theo phương pháp chung thông thường, ví dụ, được điều chế theo phương pháp nêu trong WO2011093415, US20110201687, WO2005021488, WO2005073165, WO2010018857, WO2006137395, JP2007099761, WO2008000438, WO2008074427, WO2008107091, WO2010013567, WO2010018714, WO2010090282, WO2010127926, WO2010127928, JP2011063549, WO2012020483, WO2012020484, WO2012077221, WO2012164698, WO2013050261, WO2014069665, WO2014067838, WO2014161848, WO2014161850, WO2015097091 hoặc WO2015097094.

Hợp chất có công thức I theo sáng chế có hoạt tính diệt côn trùng cao bất ngờ, và có thể được sử dụng để diệt các loại côn trùng sau (các đối tượng được nêu ở đây chỉ nhằm làm cụ thể sáng chế chứ không làm giới hạn sáng chế): côn trùng cánh vẩy, như sâu tơ, sâu keo, sâu keo da láng, sâu khoang, sâu thuốc lá, sâu bắp cải, sâu đục thân năm vạch đầu nâu, sâu đục thân hai chấm, sâu cuốn lá, sâu đục thân hại bắp, ngài hại quả phượng Đông, sâu đục quả bông; côn trùng cánh đều chẳng hạn như, rệp rau, rệp đậu, rệp của cải đường, rệp cây bông, rệp cây táo, rệp đào, rệp ngô, rầy phấn trắng, rầy lá, rầy nâu, rầy hại lúa và rệp sáp; côn trùng cánh nửa như, như rệp ngô, rệp cây bông, bọ cây cà chua, bọ xít xanh và bọ hại lúa; côn trùng cánh viên như bọ trĩ hành, bọ trĩ hại hoa và rệp nigropilosus uzeli; côn trùng cánh cứng như bọ khoai tây, bọ bắp cải, sâu nhót, sâu đục lá và bọ symplezomias velatus chevrolati; côn trùng hai cánh như ruồi và muỗi; côn trùng cánh màng như ong và kiến. Hợp chất có công thức I theo

sáng chế có thêm hiệu quả diệt côn trùng nhanh cao bất ngờ, và đạt hiệu quả rất nhanh chóng; hơn nữa, có công thức I có thể đạt được hoạt tính diệt côn trùng cao hơn vào thời điểm 1 ngày sau khi phun, và hoạt tính diệt côn trùng cao nhất trong vòng 3 ngày. Hợp chất có công thức I theo sáng chế có phương pháp điều chế đơn giản và hiệu quả, dễ dàng để sản xuất trên quy mô công nghiệp và do đó có triển vọng áp dụng rộng rãi. Do đó, giải pháp kỹ thuật theo sáng chế bao gồm cả việc sử dụng hợp chất có công thức I để sản xuất chế phẩm diệt côn trùng trong nông nghiệp và các lĩnh vực khác.

Nhờ các đặc tính tốt, hợp chất nêu trên có thể hữu dụng để bảo vệ các loại cây trồng quan trọng, vật nuôi và con giống trong lĩnh vực nông nghiệp và lâm vườn cũng như môi trường sống của con người tránh khỏi thiệt hại do côn trùng gây ra.

Để đạt được hiệu quả tối ưu, liều của hợp chất nêu trên thay đổi phụ thuộc vào các yếu tố khác nhau, ví dụ, hợp chất sử dụng, loại cây trồng cần bảo vệ, loại côn trùng, mức độ nhiễm, điều kiện thời tiết, phương pháp sử dụng, dạng liều sử dụng, v.v...

Hợp chất với liều từ 10g đến 5kg cho mỗi hecta có thể đủ tác dụng diệt côn trùng.

Sáng chế đề cập đến chế phẩm diệt côn trùng có hợp chất có công thức I làm hoạt chất. Phần trăm trọng lượng của hoạt chất trong chế phẩm diệt côn trùng là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 99%. Chế phẩm diệt côn trùng có thể chứa thêm chất mang được dùng trong lĩnh vực nông nghiệp, lâm nghiệp và sức khỏe.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng ở dạng pha chế. Hợp chất có công thức I, là hoạt chất, được hòa tan hoặc phân tán vào chất mang hoặc được điều chế thành các dạng pha chế sao cho nó dễ dàng phân tán khi sử dụng làm chế phẩm diệt côn trùng. Ví dụ: các dạng pha chế hóa học có thể được sản xuất ở dạng bột thấm nước, hỗn dịch dầu, huyền phù đậm đặc, nhũ tương trong nước, dạng hòa tan trong nước hoặc tan trong dầu, v.v... Ít nhất một hoặc chất mang lỏng hoặc rắn được cho vào các chế phẩm này, và ngoài ra, có thể cho

thêm chất hoạt động bề mặt thích hợp khi cần.

Giải pháp kỹ thuật theo sáng chế có thể bao gồm cả phương pháp diệt côn trùng: chế phẩm diệt côn trùng theo sáng chế được sử dụng cho côn trùng hoặc ấu trùng trong giai đoạn phát triển của nó. Thông thường, liều hiệu quả thích hợp được chọn trong khoảng từ 10g đến 1000g cho một hecta; tốt hơn là, liều hiệu quả là từ 10g đến 500g trên một hecta.

Trong một số trường hợp, ví dụ, một hoặc nhiều chất diệt khuẩn, diệt côn trùng/điệt ve bét, diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng thực vật hoặc phân bón, v.v... có thể được cho vào chế phẩm diệt côn trùng theo sáng chế trong lĩnh vực nông nghiệp, nhờ đó mang lại lợi ích và hiệu quả vượt trội.

Cần làm rõ rằng, các biến thể khác nhau và các thay đổi có thể được thực hiện trong phạm vi nêu trong các yêu cầu bảo hộ theo sáng chế.

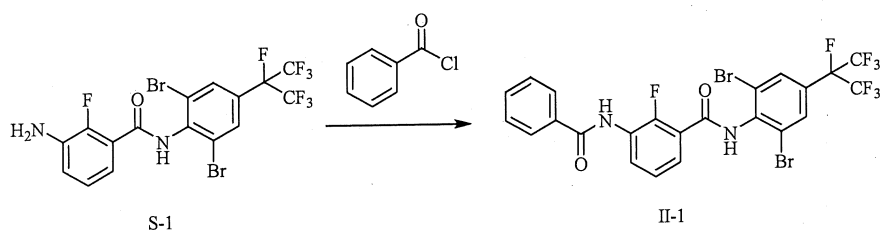
### Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế mô tả cụ thể hơn theo các phương án chi tiết dưới đây, nhưng sáng chế không chỉ giới hạn bởi các ví dụ này (Trừ khi được quy định khác, các nguyên liệu thô đều được bán sẵn trên thị trường)

Các ví dụ tổng hợp

Hợp chất có công thức I theo sáng chế có thể được điều chế lần lượt bằng các nguyên liệu thô khác nhau dựa trên phương pháp tổng hợp nêu trên; và được mô tả chi tiết hơn như sau:

Ví dụ 1: điều chế hợp chất 2.321



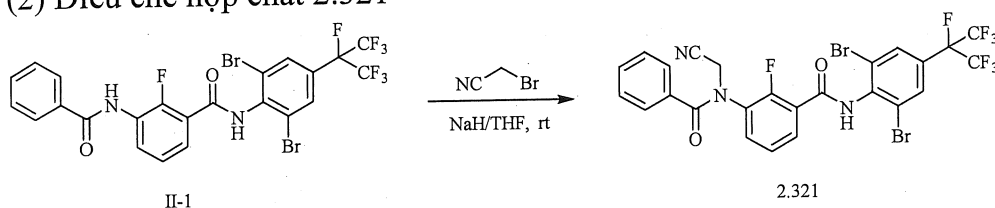
(1) Điều chế 3-benzamido-N-(2,6-dibromo-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-flobenzamidit (chất trung gian II-1) 1,00 g (1,80 mmol)

N-(2,6-dibromo-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-flo-3-aminobenzamidit (chất trung gian S-1, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong



WO2010013567, WO2010018714, US20110201687 hoặc WO2011093415, v.v...) và 0,27g (1,93 mmol) benzoyl clorua được cho vào 30ml metylbenzen, và được gia nhiệt để hồi lưu. Kiểm soát bằng sắc ký lớp mỏng, và khi kết thúc phản ứng, dung dịch nêu trên được khử dung môi trong áp suất giảm; và sau đó cặn được tinh chế bằng sắc ký cột (chất rửa giải là etyl axetat và ête dầu mỏ với tỉ lệ thể tích 1:6-1:2) để thu được 1,09g chất rắn màu trắng, là chất trung gian II-1.

(2) Điều chế hợp chất 2.321



0,30 g (7,5mmol) natri hydrua 60% được cho vào 10 ml tetrahydrofuran, 0,50 g (0,75mmol) 3-benzamido-N-(2,6-dibromo-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenzamit (chất trung gian II-1) được hòa tan trong 10ml tetrahydrofuran được cho từng giọt vào ở nhiệt độ phòng, và sau đó khuấy trong thời gian 10 phút ở nhiệt độ phòng; và 0,45g (3,78 mmol) bromoaxetonitril được cho vào và khuấy liên tục trong 1 giờ ở nhiệt độ phòng. Bằng cách kiểm soát bằng sắc ký lớp mỏng, và khi kết thúc phản ứng, phản ứng được dập tắt bằng nước đá; etyl axetat được cho vào để chiết; sản phẩm thu được được làm khô bằng magiê sulfat khan, được lọc, và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm; và cặn được tinh chế bằng sắc ký cột (chất rửa giải là etyl axetat và ête dầu mỏ với tỉ lệ thể tích 1:6-1:2) để thu được 0,38 g chất rắn màu trắng.

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 2.321 như sau:

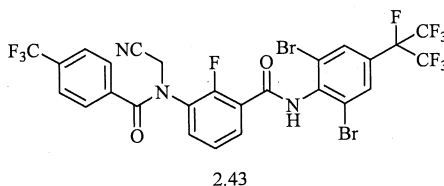
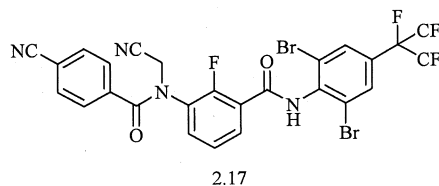
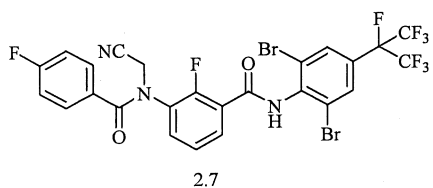
$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,10 (t, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,86 (s, 2H), 7,54 - 7,48(m, 1H), 7,41 - 7,29(m, 4H), 7,28 - 7,21(m, 2H), 4,80 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta$ (ppm): 10,62 (d, 1H), 8,04 (d, 2H), 7,66 (d, 2H), 7,44 - 7,27 (m, 6H), 4,93 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 722,0 (m+Na+H).

Tương tự hợp chất 2.7, 2.17 và 2.43 cũng được điều chế theo phương pháp của

Ví dụ 1.



Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 2.7 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta(\text{ppm})$ : 8,13 (t, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,87 (s, 2H), 7,54 - 7,49 (m, 1H), 7,44 - 7,39 (m, 2H), 7,35 (t, 1H), 6,95 (t, 2H), 4,79 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta(\text{ppm})$ : 10,62 (s, 1H), 8,04 (s, 2H), 7,73 - 7,65 (m, 2H), 7,48 - 7,42 (m, 2H), 7,38 (t, 1H), 7,15 (t, 2H), 4,94 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 718,1 (m+H).

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 2.17 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta(\text{ppm})$ : 8,16 (t, 1H), 7,88 (s, 2H), 7,57 (d, 2H), 7,53 - 7,48 (m, 3H), 7,37 (t, 1H), 7,34 (s, 1H), 4,99 (s, 1H), 4,67 (s, 1H).

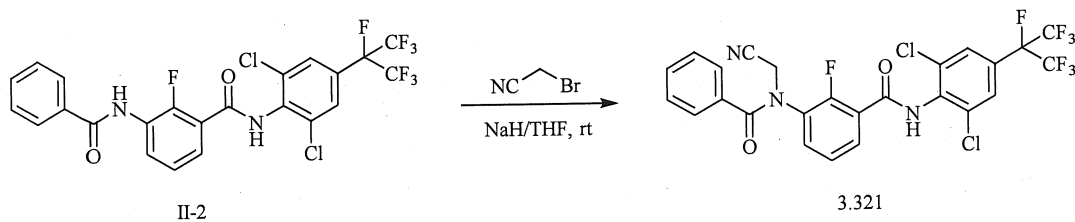
$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta(\text{ppm})$ : 10,59 (s, 1H), 8,04 (s, 2H), 7,80 (d, 2H), 7,77 - 7,67 (m, 2H), 7,55 (d, 2H), 7,38 (t, 1H), 4,99 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 725,2 (m+H).

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 2.43 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta(\text{ppm})$ : 7,90 - 7,80 (m, 4H), 7,55 (d, 2H), 7,23 (s, 1H), 7,11 (s, 1H), 6,85 (s, 1H), 4,39 - 4,31 (m, 1H), 4,08 (d, 2H), LC-MS(m/z): 767,9 (m+H).

Ví dụ 2: điều chế hợp chất 3.321



Phương pháp điều chế hợp chất 3.321 bằng 3-benzamido-N-(2,6-diclo-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenzamid (chất trung gian II-2, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2010018857) giống như phương pháp nêu trong Ví dụ 1.

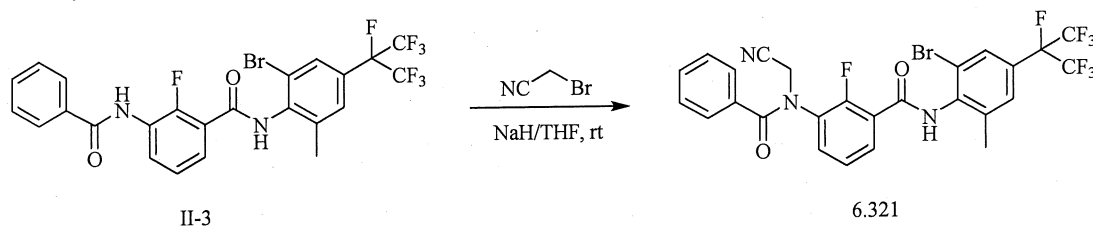
Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 3.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,10 (t, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,67 (s, 2H), 7,49 (t, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 3H), 7,31 (t, 1H), 7,29 - 7,22 (m, 2H), 4,80 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta$ (ppm): 10,61 (s, 1H), 7,92 (s, 2H), 7,70 - 7,58 (m, 2H), 7,42 - 7,27 (m, 6H), 4,93 (s, 2H),

LC-MS(m/z): 610,0 (m+H).

Ví dụ 3: điều chế hợp chất 6.321



Phương pháp điều chế hợp chất 6.321 bằng 3-benzamido-N-(2-bromo-6-metyl-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenzamid (chất trung gian II-3, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2010018857) giống như phương pháp nêu trong Ví dụ 1.

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 6.321 như sau:

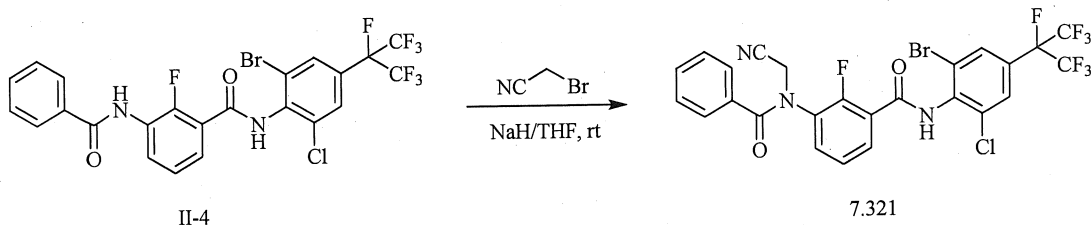
$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,12-8,06 (m, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,42 - 7,30 (m, 4H), 7,28 - 7,22 (m, 1H), 4,81 (d, 2H), 2,38 (s, 3H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta$ (ppm): 10,29 (s, 1H),

7,80 (d, 1H), 7,70 - 7,64 (m, 2H), 7,59 (t, 1H), 7,38 (d, 3H), 7,35 - 7,27 (m, 3H), 4,93 (s, 2H), 2,35 (s, 3H).

LC-MS(m/z): 634,0 (m+H).

Ví dụ 4: điều chế hợp chất 7.321



Phương pháp điều chế hợp chất 7.321 bằng 3-benzamido-N-(2-bromo-6-clo-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenzamidit (chất trung gian II-4, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2014161849) giống như phương pháp nêu trong Ví dụ 1.

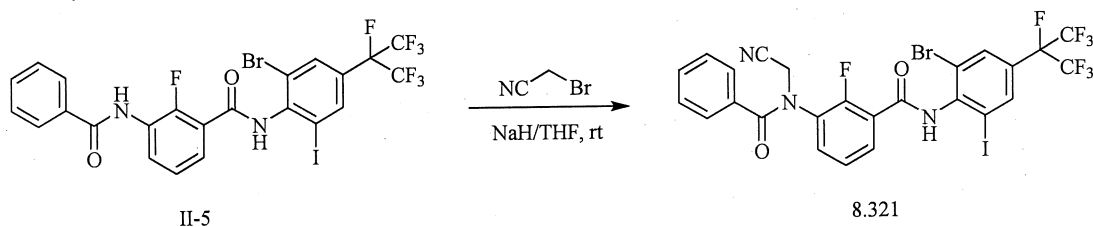
Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 7.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,10 (t, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,88 - 7,80 (m, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,54 - 7,46 (m, 1H), 7,42 - 7,29 (m, 4H), 7,28 - 7,21 (m, 2H), 4,80 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta$ (ppm): 10,61 (s, 1H), 8,05 - 7,99 (m, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,71 - 7,58 (m, 2H), 7,42 - 7,27 (m, 6H), 4,93 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 654,0 (m+H).

Ví dụ 5: điều chế hợp chất 8.321



Phương pháp điều chế hợp chất 8.321 bằng 3-benzamido-N-(2-bromo-6-iodo-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenzamidit (chất trung gian II-5, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2010018857) giống như phương pháp nêu trong Ví dụ 1.

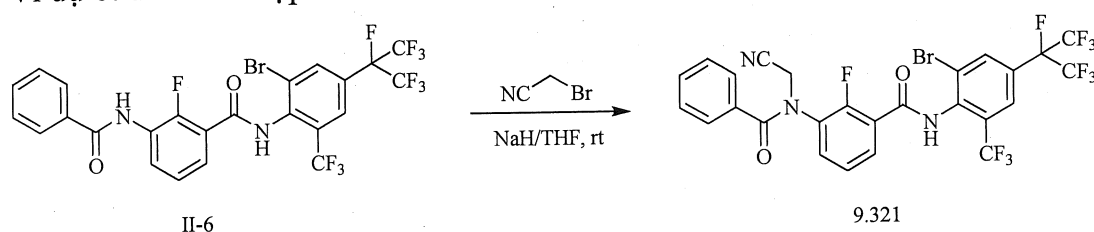
Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 8.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta(\text{ppm})$ : 8,12 (t, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,42 - 7,31 (m, 4H), 7,28 - 7,21 (m, 2H), 4,81 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta(\text{ppm})$ : 10,61 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,70 (t, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 1H), 7,41 - 7,28 (m, 6H), 4,93 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 745,9 (m+H).

Ví dụ 6: điều chế hợp chất 9.321



Phương pháp điều chế hợp chất 9.321 bằng 3-benzamido-N-(2-bromo-6-triflometyl-4-heptaflorisopropylphenyl)-2-flobenza mit (chất trung gian II-6, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2010013567, WO2010018714, US20110201687 hoặc WO2011093415, v.v....) giống như phương pháp nêu trong Ví dụ 1.

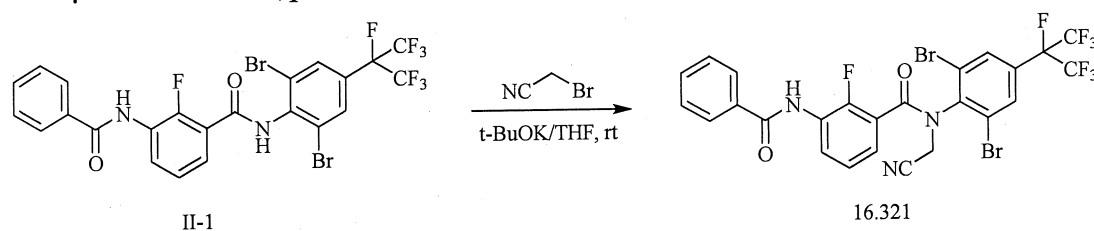
Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 9.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta(\text{ppm})$ : 8,13 (s, 1H), 8,08 (t, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,40 - 7,30 (m, 4H), 7,28 - 7,22 (m, 2H), 4,80 (d, 2H).

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO)  $\delta(\text{ppm})$ : 10,66 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,62 (q, 2H), 7,39 - 7,31 (m, 4H), 7,28 (t, 2H), 4,91 (s, 2H).

LC-MS(m/z): 687,9 (m+H).

Ví dụ 7: điều chế hợp chất 16.321

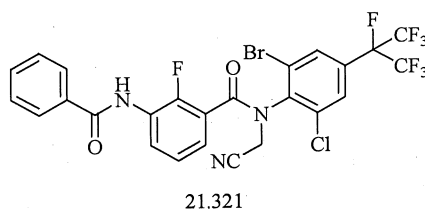
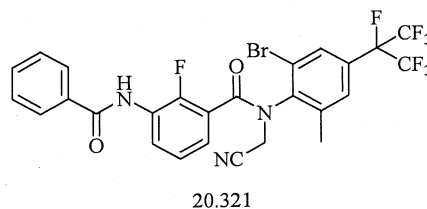
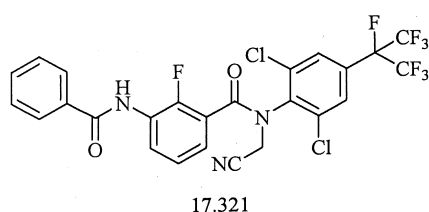


0,5g (0,75mmol) 3-benzamido-N-(2,6-dibromo-4-heptafluoropropylphenyl)-2-flobenzamidit (chất trung gian II-1), 0,18 g (1,51mmol) bromoaxetonitril, và 0,17g (1,52 mmol) kali tert-butoxit được cho vào 20ml tetrahydrofuran, và sau đó được khuấy trong 5 giờ ở nhiệt độ phòng. Bằng cách kiểm soát bằng sắc ký lớp mỏng, và khi kết thúc phản ứng, nước và etyl axetat được cho vào để chiết; sản phẩm thu được được làm khô bằng magiê sulfat khan, được lọc, và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm; cặn được tinh chế bằng sắc ký cột (chất rửa giải là etyl axetat và ête dầu mỏ với tỉ lệ thể tích 1:6-1:2) để thu được 0,29 g chất rắn màu trắng.

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 16.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,52 (td, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,88 - 7,83 (m, 2H), 7,79 (s, 2H), 7,62 - 7,57 (m, 1H), 7,54 - 7,50 (m, 2H), 6,98 - 6,93 (m, 1H), 6,92 - 6,88 (m, 1H), 4,72 (s, 2H), LC-MS(m/z): 699,9 (m+H).

Tương tự, các hợp chất 17.321, 20.321 và 21.321 được điều chế theo phương pháp của Ví dụ 7.



Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 17.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,54 - 8,48 (m, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,87 - 7,82 (m, 2H), 7,60 - 7,57 (m, 3H), 7,54 - 7,50 (m, 2H), 6,97 (t, 1H), 6,92 - 6,87 (m, 1H), 4,74 (s, 2H), LC-MS(m/z): 610,0 (m+H).

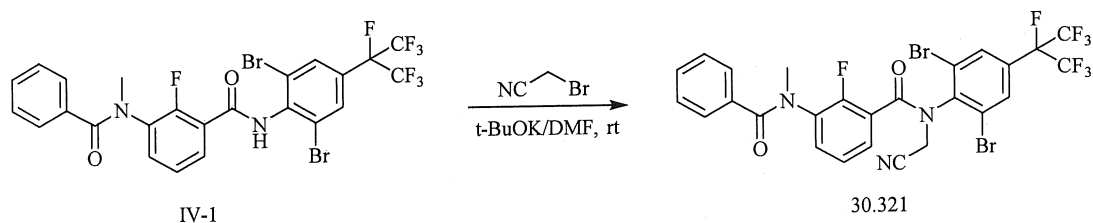
Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 20.321 như sau:

$^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 8,51 - 8,45 (m,

1H), 8,00 (d, 1H), 7,87 - 7,82 (m, 2H), 7,71 (s, 1H), 7,62 - 7,58 (m, 1H), 7,54 - 7,50 (m, 2H), 7,37 (s, 1H), 6,97 (t, 1H), 6,93 - 6,89 (m, 1H), 5,14 (d, 1H), 4,35 (d, 1H), 2,43 (s, 3H), LC-MS(m/z): 634,0 (m+H).

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 21.321 như sau: <sup>1</sup>H NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8,56 - 8,50 (m, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,88 - 7,83 (m, 2H), 7,76 (d, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 2H), 7,56 - 7,50 (m, 2H), 6,97 (t, 1H), 6,93 - 6,87 (m, 1H), 4,79 (d, 1H), 4,68 (d, 1H), LC-MS(m/z): 654,0 (m+H).

Ví dụ 8: điều chế hợp chất 30.321



0,5g (0,74mmol) N-(2,6-dibromo-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-fluoro-3-(N-benzamido)benzamid (chất trung gian IV-1, được điều chế dựa trên phương pháp được mô tả trong WO2010013567, WO2010018714, US20110201687 hoặc WO2011093415, v.v...), 0,18g (1,51mmol) bromoaxetonitril và 0,17g (1,52mmol) kali tert-butoxit được cho vào 20ml DMF, và sau đó được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 10 giờ. Bằng cách kiểm soát bằng sắc ký lớp mỏng, và khi kết thúc phản ứng, nước và etyl axetat được cho vào để chiết; sản phẩm thu được được làm khô bằng magiê sulfat khan, được lọc, và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm; và cặn được tinh chế bằng sắc ký cột (chất rửa giải là etyl axetat và ête dầu mỏ với tỉ lệ thể tích 1:6-1:2) để thu được 0,34 g chất rắn màu trắng.

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 30.321 như sau:

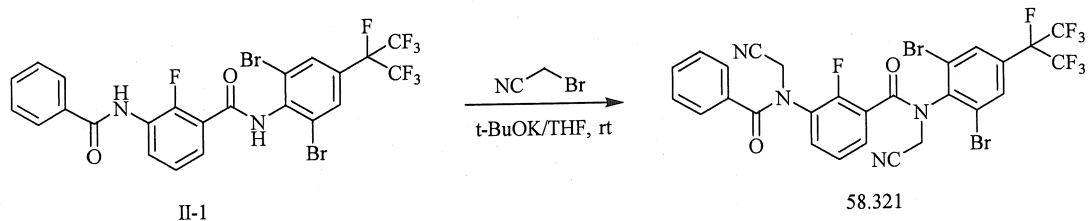
<sup>1</sup>H NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7,76(s, 2H), 7,49 - 7,37(m, 1H), 7,28 - 7,21(m, 2H), 7,18 - 7,10(m, 3H), 7,00 - 6,94(m, 1H), 6,80 - 6,74(m, 1H), 4,69(s, 2H), 3,27(s, 3H).

<sup>1</sup>H NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi DMSO) δ(ppm): 7,99(s, 2H), 7,31 - 7,25(m, 2H), 7,24 - 7,16(m, 4H), 7,07 - 7,01(m, 1H), 6,94 - 6,88(m, 1H),

4,88(s, 2H), 3,18(s, 3H).

LC-MS(m/z): 713.9 (m+H).

Ví dụ 9: điều chế hợp chất 58.321



0,5g (0,75mmol) 3-benzamido-N-(2,6-dibromo-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-flobenzamidit (chất trung gian II-1), 0,45g (3,78mmol) bromoaxetonitril và 0,42g (3,75mmol) kali tert-butoxit được cho vào 20ml tetrahydrofuran, và sau đó được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 5 giờ. Bằng cách kiểm soát bằng sắc ký lớp mỏng, và khi kết thúc phản ứng, nước và etyl axetat được cho vào để chiết; sản phẩm thu được được làm khô bằng magiê sulfat khan, được lọc, và loại bỏ dung môi trong áp suất giảm; và cặn được tinh chế bằng sắc ký cột (chất rửa giải là etyl axetat và ête dầu mỏ với tỉ lệ thể tích 1:6-1:2) để thu được 0,26g chất rắn màu trắng.

Số liệu từ tính hạt nhân và khối phổ của hợp chất 58.321 như sau:  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz, chuẩn nội TMS, dung môi  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ (ppm): 7,77 (s, 2H), 7,33 - 7,28 (m, 3H), 7,18 (t, 2H), 7,16 - 7,12 (m, 1H), 7,09 (t, 1H), 6,82 (t, 1H), 5,05 (s, 1H), 4,69 (d, 2H), 4,20 (s, 1H), LC-MS(m/z): 760,9 (m+H).

Các hợp chất có công thức I khác theo sáng chế có thể được điều chế dựa trên các Ví dụ nêu trên.

Xác định hoạt tính sinh học

Ví dụ 10: xác định hoạt tính diệt côn trùng

Thực hiện các thử nghiệm để xác định hoạt tính diệt côn trùng của hợp chất kháng lại một số loài côn trùng. Phương pháp xác định như sau.

Hợp chất cần thử nghiệm được hòa tan bằng dung môi hỗn hợp chứa axeton/metanol (1:1), và sau đó được pha loãng bằng nước chứa 0,1% (trọng lượng) Tween 80 đến nồng độ yêu cầu.

Phương pháp phun Airbrush được áp dụng để xác định hoạt tính đối với



các loại sâu đích là sâu keo, sâu tơ và sâu đục thân năm vạch đầu nâu.

(1) Xác định hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu keo

Phương pháp xác định: lá ngô được cắt thành các đoạn dài 2 cm; với áp lực phun của Airbrush là 10 psi (khoảng  $0,7\text{kg/cm}^2$ ), cả hai mặt của mỗi đoạn lá đều được phun với lượng 0,5ml. Sau khi làm khô trong bóng râm, mỗi đoạn được cấy 10 ấu trùng giai đoạn 3, lặp lại 3 lần cho mỗi đoạn. Sau đó, các đoạn đã được xử lý được đưa vào phòng quan sát ( $25^\circ\text{C}$ , độ ẩm tương đối: 60-70%) để nuôi cấy; số cá thể sống sót được đánh giá sau 1 ngày, 2 ngày và 3 ngày sau khi phun, và sau đó tỉ lệ chết được tính.

Một phần các kết quả thử nghiệm liên quan đến sâu keo như sau:

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 6.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 20.321, 21.321, 30.321 và 58.321 kháng lại sâu keo là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều 0,5 mg/L, 3 ngày sau khi phun;

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 21.321, 30.321 và 58.321 kháng lại sâu keo là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều 0,1 mg/L, 3 ngày sau khi phun;

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 9.321 và 30.321 kháng lại sâu keo là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều 0,05 mg/L, 3 ngày sau khi phun;

(2) Xác định hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ

Phương pháp xác định: lá cải bắp được đục lỗ thành các đĩa lá đường kính 2cm bằng máy đục lỗ; áp lực phun Airbrush là 10 psi (khoảng  $0,7\text{kg/cm}^2$ ), cả hai mặt của mỗi đĩa lá đều được phun với lượng 0,5ml. Sau khi làm khô trong bóng râm, mỗi đĩa lá được cấy 10 ấu trùng giai đoạn 3, lặp lại 3 lần cho mỗi đĩa lá. và sau đó, các đĩa lá đã được xử lý được đưa vào phòng quan sát ( $25^\circ\text{C}$ , độ ẩm tương đối: 60-70%) để nuôi cấy; số cá thể sống sót được đánh giá sau 1 ngày, 2 ngày và 3 ngày sau khi phun, và sau đó tỉ lệ chết được tính.

Một phần các kết quả thử nghiệm liên quan đến sâu tơ như sau:

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 6.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 20.321, 21.321, 30.321, và 58.321 kháng lại sâu

tơ là 90% hoặc hoặc cao hơn khi sử dụng liều 1mg/L, 3 ngày sau khi phun;  
Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 9.321, 16.321, 30.321, và 58.321 kháng lại sâu tơ là 90% hoặc hoặc cao hơn khi sử dụng liều 0,5mg/L, 3 ngày sau khi phun.

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 9.321 và 30.321 kháng lại sâu tơ là 90% hoặc hoặc cao hơn khi sử dụng liều 0,05mg/L, 3 ngày sau khi phun.

CK1, CK2, CK3 và CK4 được chọn làm các hợp chất đối chứng, và các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 6.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 20.321, 21.321, 30.321 và 58.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ (3 ngày sau khi phun); phương pháp xác định giống như đã nêu ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 71:

Bảng 71 Thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng của một phần các hợp chất theo sáng chế và CK1-CK4 kháng lại sâu tơ

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |
|-------------|-----------------------------------------|
|             | 10 mg/L                                 |
| 2.7         | 100                                     |
| 2.17        | 100                                     |
| 2.43        | 100                                     |
| 2.321       | 100                                     |
| 3.321       | 100                                     |
| 6.321       | 100                                     |
| 7.321       | 100                                     |
| 8.321       | 100                                     |
| 9.321       | 100                                     |
| 16.321      | 100                                     |
| 17.321      | 100                                     |
| 20.321      | 100                                     |
| 21.321      | 100                                     |

|        |     |
|--------|-----|
| 30.321 | 100 |
| 58.321 | 100 |
| CK1    | 0   |
| CK2    | 0   |
| CK3    | 0   |
| CK4    | 0   |

CK5, CK8 và CK12 được chọn làm các hợp chất đối chứng, và các hợp chất 6.321 và 20.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ (3 ngày sau khi phun); phương pháp xác định giống như được mô tả ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 72:

Bảng 72: Thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng của các hợp chất 6.321 và 20.321 theo sáng chế và CK5, CK8, và CK12 kháng lại sâu tơ:

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |        |
|-------------|-----------------------------------------|--------|
|             | 5 mg/L                                  | 1 mg/L |
| 6.321       | 100                                     | 98,5   |
| 20.321      | 100                                     | 93,9   |
| CK5         | 63,5                                    | 0      |
| CK8         | 65,8                                    | 0      |
| CK12        | 60                                      | 0      |

CK6, CK9, CK10, CK13 và CK15 được chọn làm các hợp chất đối chứng, và các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 16.321, 30.321 và 58.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ (3 ngày sau khi phun); phương pháp xác định giống như được mô tả ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 73:

Bảng 73: Thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng một phần các hợp chất theo sáng chế và CK6, CK9, CK10, CK13 và CK15 kháng lại sâu tơ.

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |          |
|-------------|-----------------------------------------|----------|
|             | 1 mg/L                                  | 0,5 mg/L |
| 2.7         | 100                                     | 100      |
| 2.17        | 100                                     | 100      |
| 2.43        | 100                                     | 100      |
| 2.321       | 100                                     | 100      |
| 16.321      | 100                                     | 100      |
| 30.321      | 100                                     | 100      |
| 58.321      | 100                                     | 98       |
| CK6         | 68                                      | 10       |
| CK9         | 55                                      | 0        |
| CK10        | 55                                      | 0        |
| CK13        | 75                                      | 0        |
| CK15        | 90                                      | 50       |

CK7, CK11, CK14 và CK16 được chọn làm các hợp chất đối chứng, và hợp chất 9.321 và 30.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ (3 ngày sau khi phun); phương pháp xác định giống như mô tả ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 74.

Bảng 74: Thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng của hợp chất 9.321 và 30.321 theo sáng chế và CK7, CK11, CK14, CK16 kháng lại sâu tơ

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |           |
|-------------|-----------------------------------------|-----------|
|             | 0.5 mg/L                                | 0.05 mg/L |
| 9.321       | 100                                     | 100       |
| 30.321      | 100                                     | 100       |
| CK7         | 70                                      | 0         |
| CK11        | 75                                      | 0         |

|      |     |      |
|------|-----|------|
| CK14 | 60  | 0    |
| CK16 | 100 | 80,8 |

CK15 được chọn là hợp chất đối chứng, và hợp chất 2.321 và 30.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ, để so sánh về hiệu quả diệt côn trùng nhanh; và các kết quả được thể hiện trong bảng 75.

Bảng 75: Thử nghiệm so sánh về hiệu quả diệt côn trùng nhanh của hợp chất 2.321 và 30.321 theo sáng chế và CK15 kháng lại sâu tơ

| Hợp chất số | Liều (mg/L) | Tỉ lệ tử vong (%)   |                     |                     |
|-------------|-------------|---------------------|---------------------|---------------------|
|             |             | 1 ngày sau khi phun | 2 ngày sau khi phun | 3 ngày sau khi phun |
| 2.321       | 0.5         | 80                  | 95                  | 100                 |
| 30.321      | 0.5         | 90                  | 100                 | 100                 |
| CK15        | 0.5         | 0                   | 30                  | 50                  |

Có thể thấy từ bảng 75 là khi so sánh với hợp chất CK15 đã có, hợp chất theo sáng chế có hiệu quả diệt côn trùng nhanh siêu việt và có hoạt tính diệt côn trùng cao hơn ở liều thấp.

CK16 được chọn là hợp chất đối chứng, và hợp chất 9.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu tơ, để so sánh về hiệu quả diệt côn trùng nhanh; và các kết quả được thể hiện trong bảng 76.

Bảng 76: Thử nghiệm so sánh về hiệu quả diệt côn trùng nhanh của hợp chất 9.321 theo sáng chế và CK16 kháng lại sâu tơ

| Hợp chất số | Liều (mg/L) | Tỉ lệ tử vong (%)   |                     |                     |
|-------------|-------------|---------------------|---------------------|---------------------|
|             |             | 1 ngày sau khi phun | 2 ngày sau khi phun | 3 ngày sau khi phun |
| 9.321       | 0,05        | 70                  | 95                  | 100                 |
| CK16        | 0,05        | 0                   | 52,5                | 80,8                |

Có thể thấy từ bảng 76 là khi so sánh với hợp chất CK16 đã có, hợp chất theo sáng chế có hiệu quả diệt côn trùng nhanh siêu việt và có hoạt tính diệt

côn trùng cao hơn ở liều thấp.

(3) Xác định hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu

Phương pháp xác định: 1) chuẩn bị cây mạ: cây mạ được trồng trong các cốc chất dẻo nhỏ (đường kính: 4.5 cm và chiều cao: 4 cm) ở nhiệt độ phòng cố định (nhiệt độ: 26-28°C, độ ẩm tương đối: khoảng 60-80% và độ chiếu sáng: 16hL:8giờ/ngày), sau khi cây mạ mọc đến giai đoạn có 4-5 lá, các cây mạ cứng cáp và đồng đều được chọn và xử lý bằng chế phẩm diệt côn trùng, lặp lại 3 lần cho mỗi lần xử lý. 2) Chuẩn bị côn trùng cho thử nghiệm: ấu trùng giai đoạn 3 của sâu đục thân năm vạch đầu nâu được cho ăn liên tục trong phòng. 3) Cây côn trùng lên cây mạ bằng cách phun. Cả cây mạ được phun theo phương pháp phun đồng đều, với liều 15ml cho mỗi lần phun. Đôi chứng trắng được phun đầu tiên, và thao tác nêu trên được lặp lại theo thứ tự từ nồng độ thử nghiệm thấp đến cao. Sau khi phun, các cây mạ được đặt vào bóng râm để khô chế phẩm diệt côn trùng, và sau đó các phần thân cao khoảng trên 5cm so với phần gốc thân được cắt để cho côn trùng ăn để thử nghiệm. Chuẩn bị các đĩa petri bằng thủy tinh (đường kính: 9 mm), được lót bằng giấy lọc ở đáy và được cho thêm nước để tạo ẩm; khoảng 20 đoạn thân mạ được cho vào mỗi đĩa và được cấy 10 ấu trùng; sau đó các đĩa petri được đậy bằng vải không dệt và cho vào phòng nhiệt độ không đổi để nuôi cấy. Số côn trùng sống sót được tính sau 3 ngày sau khi phun.

Một phần các thử nghiệm về sâu đục thân năm vạch đầu nâu như sau:

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 6.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 20.321, 21.321, 30.321 và 58.321 kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều 40 mg/L;

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 3.321, 7.321, 8.321, 9.321, 16.321, 17.321, 21.321, 30.321 và 58.321 kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều 4 mg/L;

Tỉ lệ gây chết của các hợp chất 2.7, 2.17, 2.43, 2.321, 9.321 và 30.321 kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu là 90% hoặc cao hơn khi sử dụng liều

1 mg/L.

CK15 được chọn là hợp chất đối chứng, và hợp chất 2.321 và 30.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu; phương pháp xác định giống như được mô tả ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 77:

Bảng 77: So sánh hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu giữa các hợp chất 2.321 và 30.321 theo sáng chế và CK15

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |          |           |
|-------------|-----------------------------------------|----------|-----------|
|             | 5 mg/L                                  | 2,5 mg/L | 1,25 mg/L |
| 2.321       | 100                                     | 100      | 95,5      |
| 30.321      | 100                                     | 100      | 93,5      |
| CK15        | 503                                     | 22,2     | 8,6       |

Có thể thấy từ bảng 77 là khi so sánh với hợp chất CK15 đã có, hợp chất theo sáng chế có ưu điểm là mang lại hiệu quả diệt côn trùng ở liều thấp.

CK16 được chọn là hợp chất đối chứng, và hợp chất 9.321 theo sáng chế được chọn cho thử nghiệm so sánh song song về hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu; phương pháp xác định giống như được mô tả ở trên; và các kết quả được thể hiện trong bảng 78:

Bảng 78: So sánh hoạt tính diệt côn trùng kháng lại sâu đục thân năm vạch đầu nâu giữa hợp chất 9.321 theo sáng chế và CK16

| Hợp chất số | Tỉ lệ tử vong (% , 3 ngày sau khi phun) |           |           |
|-------------|-----------------------------------------|-----------|-----------|
|             | 2,5 mg/L                                | 1,25 mg/L | 0625 mg/L |
| 9.321       | 100                                     | 100       | 98        |
| CK16        | 85,5                                    | 60,3      | 10        |

Có thể thấy từ bảng 78 là khi so sánh với hợp chất CK16 đã có, hợp chất theo sáng chế có ưu điểm là mang lại hiệu quả diệt côn trùng ở liều thấp.

Các tác giả sáng chế đưa nhóm xyanometyl ( $\text{CNCH}_2$ -) thích hợp ở nguyên tử N của liên kết amido của nó dựa trên khung phân tử cả hợp chất đã có, do đó thu được hợp chất có công thức I theo sáng chế. Từ các số liệu của thử nghiệm so sánh nêu trong các bảng 71-78 có thể thấy rằng việc đưa một đoạn thích hợp

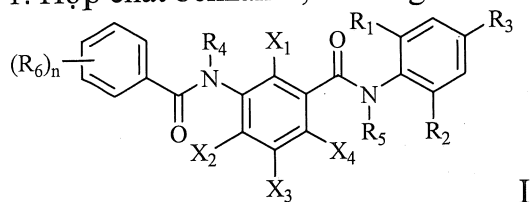
mới vào (nhóm có hiệu quả) sẽ làm tăng khả năng tương tác và liên kết của phân tử với thụ thể; nhờ đó, hợp chất theo sáng có hiệu quả bất ngờ so với các hợp chất đã biết. Có nghĩa là, hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt côn trùng cao hơn và có hiệu quả diệt côn trùng tác dụng nhanh siêu việt hơn (hợp chất theo sáng chế có hiệu quả nhanh, và có thể đạt được có hoạt tính diệt côn trùng cao hơn vào 1 ngày sau khi sử dụng, và hoạt tính diệt côn trùng cao nhất trong vòng 3 ngày).

Trong các phân tử hữu cơ, do sự khác nhau của các nhóm thế về ái lực điện tử, thế tích hoặc cấu hình không gian, có sự khác biệt đáng kể về độ dẫn hay khả năng liên kết thụ thể của toàn bộ phân tử trong các cơ thể sinh học, như côn trùng và thực vật, và theo đó, phân tử này thể hiện sự khác biệt hiển nhiên về hoạt tính sinh học. Hơn nữa, độ dẫn hoặc sự phù hợp liên kết thụ thể của phân tử này là không thể dự tính trước được, và chỉ đạt được khi có sự nỗ lực rất lớn. Do đó, sáng chế đạt được các dấu hiệu kỹ thuật quan trọng và tiến bộ đáng kể.



**Yêu cầu bảo hộ**

1. Hợp chất benzamit, có công thức I:



trong đó:

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen,  $C_1$ - $C_6$  alkyl,  $C_1$ - $C_6$  haloalkyl,  $C_1$ - $C_6$  alkoxy hoặc  $C_1$ - $C_6$  haloalkoxy;

$R_3$  được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  và  $R_5$  độc lập được chọn từ H,  $C_1$ - $C_6$  alkyl,  $C_1$ - $C_6$  haloalkyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất một trong các nhóm  $R_4$  và  $R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, halogen, xyano, nitryl,  $C_1$ - $C_6$  alkyl,  $C_1$ - $C_6$  haloalkyl,  $C_1$ - $C_6$  alkoxy hoặc  $C_1$ - $C_6$  haloalkoxy;  $C_1$ - $C_6$  alkylthio hoặc  $C_1$ - $C_6$  haloalkylthio;  $n=1, 2, 3, 4$  hoặc  $5$ ;

$X_1, X_2, X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, halogen, xyano hoặc  $C_1$ - $C_6$  alkoxy; and,  $X_1, X_2, X_3$ , và  $X_4$  không đồng thời là H.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó, trong công thức I

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen,  $C_1$ - $C_4$  alkyl,  $C_1$ - $C_4$  haloalkyl,  $C_1$ - $C_4$  alkoxy hoặc  $C_1$ - $C_4$  haloalkoxy;

$R_3$  được chọn từ heptaflorisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  và  $R_5$  độc lập được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất một trong các nhóm  $R_4$  và  $R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, halogen, xyano, nitryl,  $C_1$ - $C_4$  alkyl,  $C_1$ - $C_4$  haloalkyl,  $C_1$ - $C_4$  alkoxy hoặc  $C_1$ - $C_4$  haloalkoxy;  $C_1$ - $C_4$  alkylthio hoặc  $C_1$ - $C_4$  haloalkylthio;  $n=1, 2, 3$ , hoặc  $4$ ;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2, X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, F hoặc xyano.

3. Hợp chất theo điểm 2, trong đó, trong công thức I

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptafloisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  và  $R_5$  độc lập được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl; hơn nữa, ít nhất một trong các nhóm  $R_4$  và  $R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyano, nitryl, metyl, etyl, propyl, tertiary butyl, triflometyl, heptafloisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n=1, 2$  hoặc  $3$ ;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

4. Hợp chất theo điểm 1, 2, hoặc 3, trong đó, trong công thức I:

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptafloisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  được chọn từ xyanometyl;

$R_5$  được chọn từ H, metyl, etyl hoặc xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyano, nitryl, metyl, etyl, propyl, tertiary butyl, triflometyl, heptafloisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n=1, 2$  hoặc  $3$ ;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

5. Hợp chất theo điểm 1, 2, hoặc 3, trong đó, trong công thức I:

$R_1$  và  $R_2$  độc lập được chọn từ H, halogen, metyl, etyl, triflometyl hoặc diflometoxy;

$R_3$  được chọn từ heptafloisopropyl hoặc nonaflo-2-butyl;

$R_4$  được chọn từ H, metyl, hoặc etyl;

$R_5$  được chọn từ xyanometyl;

$R_6$  được chọn từ H, F, Cl, Br, xyano, nitryl, metyl, etyl, propyl, tertiary butyl,

triflometyl, heptafloisopropyl, metoxy hoặc triflometoxy;  $n=1, 2$  hoặc  $3$ ;

$X_1$  được chọn từ F;

$X_2$ ,  $X_3$ , và  $X_4$  độc lập được chọn từ H, hoặc F.

6. Chế phẩm diệt côn trùng, trong đó chế phẩm này chứa hợp chất có công thức I theo điểm 1 là hoạt chất; tỉ lệ phần trăm trọng lượng của hoạt chất trong chế phẩm là trong khoảng từ 0,1 đến 99%.

7. Phương pháp kiểm soát côn trùng trong lĩnh vực nông nghiệp và lâm nghiệp, trong đó lượng chế phẩm theo điểm 7 được phun cho côn trùng cần diệt hoặc phun cho môi trường sinh trưởng của chúng.