



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ

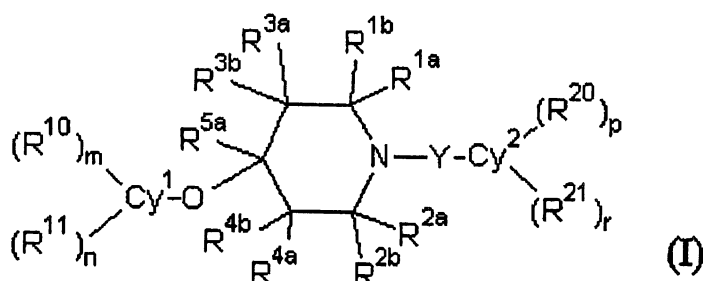


(51)⁷ C07D 451/06, A01N 43/90, 43/42, 43/54, (13) B
43/56, 43/58, 43/80, 43/88, C07D 491/052

- (21) 1-2012-02478 (22) 24.02.2011
(86) PCT/JP2011/054173 24.02.2011 (87) WO2011/105506 01.09.2011
(30) 2010-039839 25.02.2010 JP
2010-117392 21.05.2010 JP
2010-224844 04.10.2010 JP
(45) 27.05.2019 374 (43) 25.12.2012 297
(73) Nippon Soda Co., Ltd. (JP)
2-1, Ohtemachi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8165 Japan
(72) HAMAMOTO Isami (JP), KOIZUMI Keiji (JP), KAWAGUCHI Masahiro (JP),
TANIGAWA Hisashi (JP), NAKAMURA Takehiko (JP), KOBAYASHI Tomomi
(JP)
(74) Công ty TNHH Tâm nhìn và Liên danh (VISION & ASSOCIATES CO.LTD.)

(54) HỢP CHẤT AMIN VÒNG VÀ CHẤT DIỆT TRỪ LOÀI GÂY HẠI

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) (trong công thức (I), Cy¹ và Cy² độc lập biểu thị nhóm C₆₋₁₀ aryl hoặc nhóm heterocyclyl; R^{1a} đến R^{5a} độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế; R¹⁰, R¹¹, R²⁰ và R²¹ độc lập biểu thị nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₆ alkoxy chưa được thế hoặc được thế, nguyên tử halogen hoặc các nguyên tử tương tự; mỗi m, n, p, và r là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5; và Y biểu thị nguyên tử oxy hoặc các nguyên tử tương tự) hoặc muối của chúng, và thuốc diệt ve bét chứa hợp chất này.



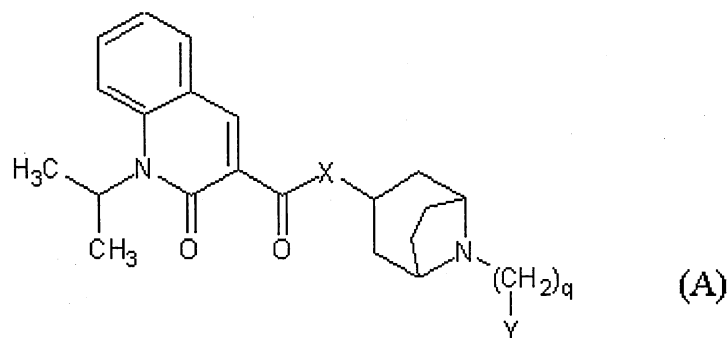
Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất amin vòng và chất diệt trừ loài gây hại. Cụ thể hơn, sáng chế đề cập đến hợp chất amin vòng và thuốc diệt ve bét với hoạt tính diệt ve bét vượt trội hơn, có tính chất tốt hơn, an toàn, và có thể được tổng hợp một cách thuận lợi trên quy mô công nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Hợp chất được biểu thị bằng công thức (A), mà có liên quan về cấu trúc với hợp chất theo sáng chế được bộc lộ trong tài liệu patent 1. Tài liệu này mô tả rằng hợp chất này hữu hiệu dùng làm chất kích thích thụ thể serotonin 4. Tuy nhiên, quy trình tổng hợp cụ thể và công hiệu của hợp chất được biểu thị bằng công thức (A), trong đó X biểu thị nguyên tử oxy, Y biểu thị nhóm alkoxy và q bằng 0, không được mô tả.

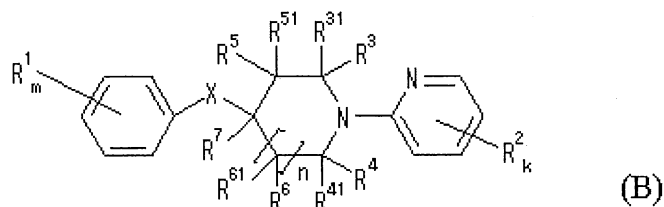
[Công thức hóa học 1]



Ngoài ra, hợp chất được biểu thị bằng công thức (B), muối và N-oxit của hợp chất được biểu thị bằng công thức (B), và chất diệt trừ loài gây hại bao gồm hợp chất được biểu thị bằng công thức (B) làm hoạt chất được bộc lộ trong tài liệu patent 2 (trong công thức (B), R^1 biểu thị nhóm hydroxy hoặc các nhóm tương tự, m bằng 0 hoặc số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 5, R^2 biểu thị nguyên tử halogen hoặc các nguyên tử tương tự, k bằng 0 hoặc số nguyên nằm trong khoảng

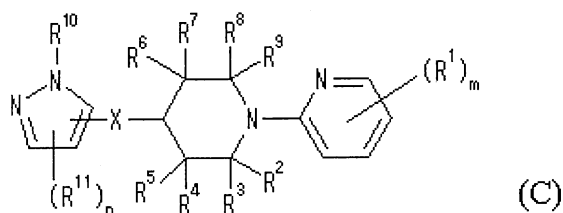
từ 1 đến 4, R^3 , R^{31} , R^4 , R^{41} , R^5 , R^{51} , R^6 , R^{61} và R^7 độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử tương tự, X biểu thị nguyên tử oxy hoặc các nguyên tử tương tự, n bằng 0 hoặc 1).

[Công thức hóa học 2]



Ngoài ra, hợp chất N-pyridyl piperidin được biểu thị bằng công thức (C) được bộc lộ trong tài liệu patent 3. Tài liệu này mô tả rằng hợp chất được biểu thị bằng công thức (C) có hoạt tính diệt ve bét kháng ve bét nhện và ve bét gây bệnh gỉ sắt (trong công thức (C), R^1 biểu thị nguyên tử halogen, nhóm C_{1-4} haloalkyl, nhóm xyano, nhóm nitro hoặc nhóm C_{1-4} alkoxyacarbonyl. R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 và R^9 độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C_{1-4} alkyl. R^{10} biểu thị nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử tương tự. R^{11} biểu thị nguyên tử halogen hoặc các nguyên tử tương tự. X biểu thị nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh. m là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 4. n bằng 1 hoặc 2).

[Công thức hóa học 3]



Tài liệu kỹ thuật có liên quan

Tài liệu sáng chế

Tài liệu patent 1: Công bố đơn yêu cầu cấp patent Nhật Bản chưa xét nghiệm số

Hei 8-34784

Tài liệu patent 2: WO2005/095380

Tài liệu patent 3: WO2008/026658

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Các vấn đề sáng chế cần giải quyết

Mặc dù các thuốc diệt ve bét truyền thống có thể được tổng hợp một cách thuận lợi trên quy mô công nghiệp và được sử dụng một cách an toàn, nhưng đa số các thuốc này thiếu các tính chất khác như tác dụng tồn dư. Ngoài ra, yêu cầu về độ an toàn như làm giảm tác động gây hại của các hóa chất đối với cây trồng, làm giảm hoặc trung hòa độc tính đối với người, vật nuôi hoặc sinh vật sống ở biển ngày càng cao hơn.

Do đó, mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất amin vòng và thuốc diệt ve bét mới với hoạt tính diệt ve bét vượt trội hơn, có tính chất tốt hơn, an toàn, và có thể được tổng hợp một cách thuận lợi trên quy mô công nghiệp.

Ngoài ra, mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất hydroxylamin thích hợp cho việc tổng hợp hợp chất amin vòng để sử dụng làm hoạt chất của thuốc diệt ve bét.

Cách giải quyết vấn đề

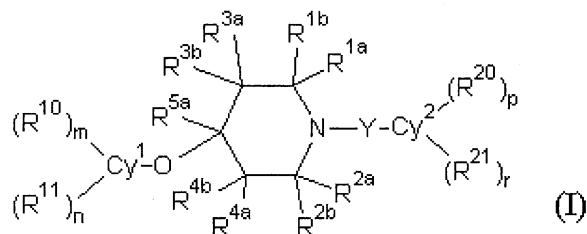
Để đạt được các mục đích trên đây, các tác giả sáng chế đã tiến hành các nghiên cứu có tính bao quát. Nhờ vậy, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng hợp chất amin vòng có cấu trúc đặc trưng, hoặc muối của chúng có thể được sử dụng làm thuốc diệt ve bét với hoạt tính diệt ve bét vượt trội, các tính chất rất tốt và độ an toàn cao. Hơn nữa, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng hợp chất hydroxylamin có cấu trúc đặc trưng, hoặc muối của chúng thích hợp để làm hợp chất trung gian tổng hợp hợp chất amin vòng có cấu trúc đặc trưng, hoặc muối của chúng.

Sáng chế đạt được dựa trên cơ sở sự nhận thức này.

Cụ thể, sáng chế được biểu thị như sau:

[1] Hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của chúng:

[Công thức hóa học 4]



trong công thức (I),

Cy¹ và Cy² độc lập biểu thị nhóm C₆₋₁₀ aryl hoặc nhóm heterocyclyl;

trong công thức (I), R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} và R^{5a} độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế;

R^{1a} và R^{2a}, hoặc R^{3a} và R^{4a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C₃₋₆ alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₆ alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: -CH₂OCH₂-, nhóm được biểu thị bằng công thức: -CH₂SCH₂-, nhóm được biểu thị bằng công thức: -CH₂C(=O)CH₂- hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: -CH₂NR⁶CH₂-, (với điều kiện R⁶ biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₇ axyl chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm C₁₋₆ alkoxyacbonyl chưa được thế hoặc được thế);

trong công thức (I), R¹⁰, R¹¹, R²⁰ và R²¹ độc lập biểu thị nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₈ xycloalkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkynyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm hydroxy, nhóm oxo, nhóm C₁₋₆ alkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₈ xycloalkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkynyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm carboxyl, nhóm C₁₋₇ axyl chưa được thế hoặc được thế,

nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{3-8} xycloalkyloxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{6-10} aryloxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm heteroxyclyloxyacetyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-7} axyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{3-8} xycloalkyloxyacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-6} alkyl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{3-8} xycloalkyl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkenyl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkynyl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{6-10} aryl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm heteroxyclyl aminocacetyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm aminooxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{6-10} aryl chưa được thể hoặc được thể, nhóm heteroxyclyl chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{6-10} aryloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm heteroxyclyloxy chưa được thể hoặc được thể, nhóm sulfonyloxy được thể, nhóm amino, nhóm C_{1-6} alkyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{3-8} xycloalkyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkenyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkynyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{6-10} aryl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm heteroxyclyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm hydroxyamino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-7} axyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl amino chưa được thể hoặc được thể, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacetyl amino chưa được thể hoặc được thể,

nhóm C_{2-6} alkynyloxyacetyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryloxyacetyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm heterocycloxyacetyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm sulfonyl amino được thế, nhóm aminocacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm mercapto, nhóm C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm heterocyclyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm thiocacetyl (C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocacetyl (C_{1-6} alkoxy chưa được thế hoặc được thế), nhóm cacetyl (C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocacetyl (C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm sulfinyl được thế, nhóm sulfonyl được thế, nhóm pentafluorosulfonyl, nhóm silyl được thế tri C_{1-6} alkyl, nhóm silyl được thế tri C_{6-10} aryl, nhóm cyano, nhóm nitro hoặc nguyên tử halogen;

R^{10} và R^{11} của Cy^1 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^1 để tạo thành vòng; R^{20} và R^{21} của Cy^2 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^2 để tạo thành vòng;

trong công thức (I), m biểu thị số lượng R^{10} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi m bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

trong công thức (I), n biểu thị số lượng R^{11} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi n bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{11} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

trong công thức (I), p biểu thị số lượng R^{20} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi p bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{20} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

trong công thức (I), r là số lượng R^{21} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi r bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{21} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

trong công thức (I), Y biểu thị nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh.

[2] Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo mục [1], trong đó:

trong công thức (I), Cy^1 biểu thị nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl hoặc nhóm pyridazinyl, và Cy^2 biểu thị nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl, hoặc pyridazinyl.

[3] Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo mục [1] hoặc [2], trong đó:

trong công thức (I), R^{10} biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm xyano C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy, nhóm hydroxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacbonyl, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyl aminocacbonyloxy, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heteroxyclyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio hoặc nhóm nitro;

trong công thức (I), R^{11} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentaflorosulfanyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl;

trong công thức (I), R^{20} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentaflorosulfanyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl; và

trong công thức (I), R^{21} biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxycarbonyl, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm nitro.

[4] Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục [1]-[3], trong đó:

Cy^1 biểu thị nhóm phenyl;

R^{1b} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} và R^{5a} biểu thị nguyên tử hydro;

R^{1a} và R^{2a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$ hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế);

Cy^2 biểu thị nhóm pyridin-2-yl;

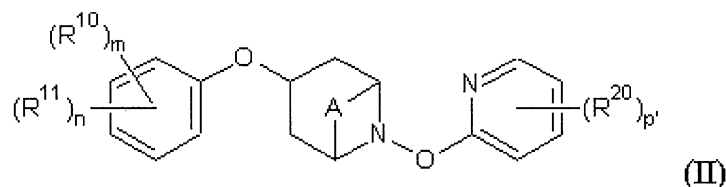
Y biểu thị nguyên tử oxy;

r bằng 0; và

p là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4.

[5] Hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (II) hoặc muối của chúng:

[Công thức hóa học 5]



trong công thức (II), R^{10} , m , R^{11} , n và R^{20} giống như đã được xác định trước đây trong công thức (I).

trong công thức (II), A biểu thị nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$ hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl chưa được thế hoặc được thế).

trong công thức (II), p' biểu thị số lượng R^{20} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4. Khi p' bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{20} là giống nhau hoặc khác nhau.

[6] Hợp chất amin vòng theo mục [5], trong đó:

trong công thức (II), R^{10} biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy,

nhóm xyano C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy, nhóm hydroxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacarbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacarbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacarbonyl, nhóm C_{1-6} alkoxyacarbonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyl aminocarbonyloxy, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heterocyclyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacarbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio hoặc nhóm nitro;

trong công thức (II), R^{11} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluorsulfonyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl; và

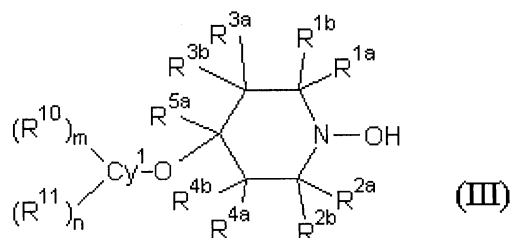
trong công thức (II), R^{20} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluorsulfonyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl.

[7] Chất diệt trừ loài gây hại chứa ít nhất một hợp chất được chọn từ hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục [1]-[6] làm hoạt chất.

[8] Thuốc diệt ve bét chứa ít nhất một hợp chất được chọn từ hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục [1]-[6] làm hoạt chất.

[9] Hợp chất hydroxylamin được biểu thị bằng công thức (III) hoặc muối của chúng:

[Công thức hóa học 6]



trong công thức (III), Cy^1 biểu thị nhóm C_{6-10} aryl hoặc nhóm heterocyclyl;

trong công thức (III), R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} và R^{5a} độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế; và R^{1a} và R^{2a} , hoặc R^{3a} và R^{4a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$ hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl chưa được thế hoặc được thế);

trong công thức (III), R^{10} và R^{11} độc lập biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} cycloalkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm hydroxy, nhóm oxo, nhóm C_{1-6} alkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} cycloalkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm carboxyl,

nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} cycloalkyloxyacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryloxyacetyl chưa được thế hoặc được thế,

nhóm heterocycloxyloxyacetyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} cycloalkyloxyacetyloxy chưa được thế hoặc được thế,

thế, nhóm C₂₋₆ alkenyloxyacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkyloxyacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₆ alkyl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₈ cycloalkyl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkynyl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₆₋₁₀ aryl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm heterocyclyl aminocacetyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm aminoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₆ alkylidene aminoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₆₋₁₀ aryl chưa được thế hoặc được thế, nhóm heterocyclyl chưa được thế hoặc được thế,

nhóm C₆₋₁₀ aryloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxycyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm sulfonyloxy được thế, nhóm amino, nhóm C₁₋₆ alkyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₈ xycloalkyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkynyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₆₋₁₀ aryl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxycyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm hydroxyamino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₇ axyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₆ alkoxyacacbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyloxyacacbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkynyloxyacacbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₆₋₁₀ aryloxyacacbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxycyloxyacacbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm sulfonyl amino được thế, nhóm aminocacbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm mercapto, nhóm C₁₋₆ alkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃₋₈ xycloalkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₂₋₆ alkenyl thio chưa được

thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm heterocyclyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkoxy chưa được thế hoặc được thế), nhóm carbonyl(C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm sulfinyl được thế, nhóm sulfonyl được thế, nhóm pentafluorosulfonyl, nhóm silyl được thế tri C_{1-6} alkyl, nhóm silyl được thế tri C_{6-10} aryl, nhóm cyano, nhóm nitro hoặc nguyên tử halogen;

R^{10} và R^{11} của Cy^1 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^1 để tạo thành vòng;

trong công thức (III), m biểu thị số lượng R^{10} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi m bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

trong công thức (III), n biểu thị số lượng R^{11} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi n bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{11} có thể giống nhau hoặc khác nhau.

[10] Hợp chất hydroxylamin hoặc muối của chúng theo mục [9], trong đó:

trong công thức (III), Cy^1 biểu thị nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl hoặc nhóm pyridazinyl.

[11] Hợp chất hydroxylamin hoặc muối của chúng theo mục [9] hoặc mục [10], trong đó:

trong công thức (III), R^{10} biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy,

nhóm xyano C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy, nhóm hydroxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacbonyl, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl oxy, nhóm C_{1-6} alkyl aminocacbonyl oxy, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heterocyclyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio hoặc nhóm nitro; và

trong công thức (III), R^{11} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluoranyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl.

Hiệu quả của sáng chế

Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế làm cho sáng chế có thể ngăn ngừa một cách có hiệu quả loài ve bét có hại đối với cây trồng nông nghiệp hoặc có hại đối với vấn đề vệ sinh.

Hợp chất hydroxylamin hoặc muối của chúng theo sáng chế làm cho sáng chế có thể dễ dàng tổng hợp hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế.

Mô tả chi tiết sáng chế

[Hợp chất amin vòng]

Hợp chất amin theo sáng chế được biểu thị bằng công thức (I) hoặc (II). Ngoài ra, muối của hợp chất amin vòng theo sáng chế là muối của hợp chất vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc (II).

Thuật ngữ “chưa được thế” trong bản mô tả này nghĩa là nhóm gốc là nhóm duy nhất cấu thành nhóm này. Ngoài ra, trừ khi có chỉ dẫn khác, một nhóm “chưa được thế” khi nhóm này không được mô tả là “được thế” và được mô tả bằng cách sử dụng tên của nhóm gốc.

Mặt khác, thuật ngữ “được thế” nghĩa là khi bất kỳ nguyên tử hydro nào của nhóm gốc được thế bằng một nhóm giống hoặc khác với nhóm gốc. Nhóm “được thế” có thể được thế bằng một phần tử thế, hoặc hai hoặc nhiều phần tử thế. Hai hoặc nhiều phần tử thế này có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Ví dụ, thuật ngữ “C₁₋₆” nghĩa là nhóm gốc có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon. Con số này không bao gồm số lượng nguyên tử cacbon cấu thành phần tử thế. Ví dụ, nhóm butyl được thế bằng nhóm etoxy được phân loại thành nhóm C₂ alkoxy C₄ alkyl.

"Phần tử thế" không bị giới hạn một cách cụ thể miễn là nó chấp nhận được về mặt hóa học và đạt được hiệu quả theo sáng chế.

Ví dụ về "phần tử thế" bao gồm nguyên tử halogen như nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iot hoặc các nguyên tử tương tự; nhóm C₁₋₆ alkyl như nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm n-hexyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₃₋₈ xycloalkyl như nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl, nhóm xycloheptyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₂₋₆ alkenyl như nhóm vinyl, nhóm 1-propenyl, nhóm 2-propenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 3-butenyl, nhóm 1-metyl-2-propenyl, nhóm 2-metyl-2-propenyl, nhóm 1-pentenyl, nhóm 2-pentenyl, nhóm 3-pentenyl, nhóm 4-pentenyl, nhóm 1-metyl-2-butenyl, nhóm 2-metyl-2-butenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 2-hexenyl, nhóm 3-hexenyl, nhóm 4-hexenyl, nhóm 5-hexenyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₃₋₈ xycloalkenyl như nhóm 2-xyclopropenyl, nhóm 2-xyclopentenyl, nhóm 3-xyclohexenyl, nhóm 4-xyclooctenyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₂₋₆ alkynyl như nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butynyl, nhóm 2-butynyl, nhóm 3-butynyl, nhóm 1-metyl-2-propynyl, nhóm 2-metyl-3-butynyl, nhóm 1-pentynyl,

nhóm 2-pentynyl, nhóm 3-pentynyl, nhóm 4-pentynyl, nhóm 1-metyl-2-butynyl, nhóm 2-metyl-3-pentynyl, nhóm 1-hexynyl, nhóm 1,1-đimetyl-2-butynyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm C_{1-6} alkoxy như nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm i-propoxy, nhóm n-butoxy, nhóm s-butoxy, nhóm i-butoxy, nhóm t-butoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkenyloxy như nhóm vinyloxy, nhóm alyloxy, nhóm propenyloxy, nhóm butenyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkynyloxy như nhóm etynyloxy, nhóm propargyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl như nhóm phenyl, nhóm naphtyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryloxy như nhóm phenoxy, nhóm 1-naphtoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyl như nhóm benzyl, nhóm phentyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyloxy như nhóm benzyloxy, nhóm phentyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-7} axyl như nhóm formyl, nhóm axetyl, nhóm propionyl, nhóm benzoyl, nhóm xyclohexyl cacbonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-7} axyloxy như nhóm formyloxy, nhóm axetyloxy, nhóm propionyloxy, nhóm benzoyloxy, nhóm xyclohexyl cacbonyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxycacbonyl như nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm n-propoxycacbonyl, nhóm i-propoxycacbonyl, nhóm n-butoxycacbonyl, nhóm t-butoxycacbonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm carboxyl;

Nhóm hydroxy; nhóm oxo; nhóm C_{1-6} haloalkyl như nhóm clometyl, nhóm cloetyl, nhóm triflometyl, nhóm 1,2-điclo-n-propyl, nhóm 1-flo-n-butyl, nhóm perflo-n-pentyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} haloalkenyl như nhóm 2-clo-1-propenyl, nhóm 2-flo-1-butenyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} haloalkynyl như nhóm 4,4-điclo-1-butynyl, nhóm 4-flo-1-pentynyl, nhóm 5-brom-2-pentynyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} haloalkoxy như nhóm 2-clo-n-propoxy, nhóm 2,3-điclobutoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6}

haloalkenyloxy như nhóm 2-clopropenyloxy, nhóm 3-brombutenyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ haloaryl như nhóm 4-clophenyl, nhóm 4-flophenyl, nhóm 2,4-điclophenyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ haloaryloxy như nhóm 4-flophenyloxy, nhóm 4-clo-1-naphtoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₇ axyl được thế halogen như nhóm cloaxetyl, nhóm trifloaxetyl, nhóm tricloaxetyl, nhóm 4-clobenzoyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm xyano; nhóm isoxyano; nhóm nitro; nhóm isoxyanato; nhóm xyanato; nhóm amino; nhóm C₁₋₆ alkyl amino như nhóm metyl amino, nhóm đimetyl amino, nhóm dietyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ aryl amino như nhóm anilino, nhóm naphtyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₇₋₁₁ aralkyl amino như nhóm benzyl amino, nhóm phenyl etyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₇ axyl amino như nhóm formyl amino, nhóm axetyl amino, nhóm propanoyl amino, nhóm butyryl amino, nhóm i-propyl cacbonyl amino, nhóm benzoyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ alkoxyacabonyl amino như nhóm metoxyacabonyl amino, nhóm etoxyacabonyl amino, nhóm n-propoxyacabonyl amino, nhóm i-propoxyacabonyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm aminocacabonyl chưa được thế hoặc được thế như nhóm aminocacabonyl, nhóm đimetyl aminocacabonyl, nhóm phenyl aminocacabonyl, nhóm N-phenyl-N-metyl aminocacabonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ alkyl được thế imino như nhóm iminometyl, nhóm (1-imino)etyl, nhóm (1-imino)-n-propyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ alkyl được thế hydroxyimino như nhóm hydroxyiminometyl, nhóm (1-hydroxyimino)etyl, nhóm (1-hydroxyimino)propyl, nhóm metoxyiminometyl, nhóm (1-metoxyimino)etyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm mercapto; nhóm isothioxyanato; nhóm thioxyanato; nhóm C₁₋₆ alkyl thio như nhóm metyl thio, nhóm etyl thio, nhóm n-propyl thio, nhóm i-propyl thio, nhóm n-butyl thio, nhóm i-butyl thio, nhóm s-butyl thio, nhóm

t-butyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkenyl thio như nhóm vinyl thio, nhóm alyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkynyl thio như nhóm etynyl thio, nhóm propargyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl thio như nhóm phenyl thio, nhóm naphtyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm heteroxyclyl thio như nhóm thiazolyl thio, nhóm pyridyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyl thio như nhóm benzyl thio, nhóm phenetyl thio hoặc các nhóm tương tự; nhóm $(C_{1-6}$ alkyl thio)cacbonyl như nhóm (metyl thio)cacbonyl, nhóm (etyl thio)cacbonyl, nhóm (n-propyl thio)cacbonyl, nhóm (i-propyl thio)cacbonyl, nhóm (n-butyl thio)cacbonyl, nhóm (i-butyl thio)cacbonyl, nhóm (s-butyl thio)cacbonyl, nhóm (t-butyl thio)cacbonyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm C_{1-6} alkyl sulfinyl như nhóm metyl sulfinyl, nhóm etyl sulfinyl, nhóm t-butyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkenyl sulfinyl như nhóm alyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm C_{2-6} alkynyl sulfinyl như nhóm propargyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl sulfinyl như nhóm phenyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm heteroxyclyl sulfinyl như nhóm thiazolyl sulfinyl, nhóm pyridyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyl sulfinyl như nhóm benzyl sulfinyl, nhóm phentyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkyl sulfonyl như nhóm metyl sulfonyl, nhóm etyl sulfonyl, nhóm t-butyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkenyl sulfonyl như nhóm alyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{2-6} alkynyl sulfonyl như nhóm propargyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl sulfonyl như nhóm phenyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm heteroxyclyl sulfonyl như nhóm thiazolyl sulfonyl, nhóm pyridyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyl sulfonyl như nhóm benzyl sulfonyl, nhóm phentyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm heteroaryl 5 cạnh như nhóm pyrrolyl, nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm imidazolyl, nhóm pyrazolyl, nhóm oxazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm thiazolyl, nhóm isothiazolyl, nhóm triazolyl, nhóm oxadiazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm tetrazolyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm heteroaryl 6 cạnh như nhóm pyridyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm triazinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm heterocyclyl no như nhóm aziridinyl, nhóm epoxy, nhóm pyrrolidinyl, nhóm tetrahydrofuranyl, nhóm piperidyl, nhóm piperazinyl, nhóm morpholinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm silyl được thế tri C_{1-6} alkyl như nhóm trimetyl silyl, nhóm trietyl silyl, nhóm t-butyl dimetyl silyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm triphenyl silyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ngoài ra, các "phần tử thế" này có thể được thế bằng các "phần tử thế" khác.

[Cy¹, Cy²]

Trong công thức (I), Cy¹ và Cy² độc lập biểu thị nhóm C₆₋₁₀ aryl hoặc nhóm dị vòng.

"Nhóm C₆₋₁₀ aryl" của Cy¹ và Cy² có thể là nhóm C₆₋₁₀ aryl vòng đơn hoặc đa vòng. Trong nhóm aryl đa vòng, miễn là nhóm này bao gồm ít nhất một vòng thơm, các vòng khác có thể là vòng béo no, vòng béo không no hoặc vòng thơm. Ví dụ về nhóm C₆₋₁₀ aryl bao gồm nhóm phenyl, nhóm naphthyl, nhóm azulenyl, nhóm indenyl, nhóm indanyl, nhóm tetralinyl hoặc các nhóm tương tự. Trong số các nhóm này, nhóm phenyl được ưu tiên làm "nhóm C₆₋₁₀ aryl" của Cy¹ hoặc Cy².

"Nhóm heterocyclyl" của Cy¹ và Cy² là nhóm trong đó bao gồm 1-4 nguyên tử khác loại được chọn từ nguyên tử nitơ, nguyên tử oxy và nguyên tử lưu

huỳnh để làm nguyên tử cấu thành vòng. Nhóm heterocyclyl có thể là nhóm monoheterocyclyl hoặc nhóm polyheterocyclyl.

Ví dụ về nhóm heterocyclyl bao gồm nhóm heteroaryl 5 cạnh, nhóm heteroaryl 6 cạnh, nhóm heteroaryl được ngưng tụ, nhóm heterocyclyl no, nhóm heterocyclyl không no một phần hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về nhóm heteroaryl 5 cạnh bao gồm nhóm pyrrolyl như nhóm pyrrol-1-yl, nhóm pyrrol-2-yl, nhóm pyrrol-3-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm furyl như nhóm furan-2-yl, nhóm furan-3-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm thienyl như nhóm thiophen-2-yl, nhóm thiophen-3-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm imidazolyl như nhóm imidazol-1-yl, nhóm imidazol-2-yl, nhóm imidazol-4-yl, nhóm imidazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm pyrazolyl như nhóm pyrazol-1-yl, nhóm pyrazol-3-yl, nhóm pyrazol-4-yl, nhóm pyrazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm oxazolyl như nhóm oxazol-2-yl, nhóm oxazol-4-yl, nhóm oxazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm isoxazolyl như nhóm isoxazol-3-yl, nhóm isoxazol-4-yl, nhóm isoxazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm thiazolyl như nhóm thiazol-2-yl, nhóm thiazol-4-yl, nhóm thiazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm isothiazolyl như nhóm isothiazol-3-yl, nhóm isothiazol-4-yl, nhóm isothiazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm triazolyl như nhóm 1,2,3-triazol-1-yl, nhóm 1,2,3-triazol-4-yl, nhóm 1,2,3-triazol-5-yl, nhóm 1,2,4-triazol-1-yl, nhóm 1,2,4-triazol-3-yl, nhóm 1,2,4-triazol-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm oxadiazolyl như nhóm 1,2,4-oxadiazol-3-yl, nhóm 1,2,4-oxadiazol-5-yl, nhóm 1,3,4-oxadiazol-2-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm thiadiazolyl như nhóm 1,2,4-thiadiazol-3-yl, nhóm 1,2,4-thiadiazol-5-yl, nhóm 1,3,4-thiadiazol-2-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm tetrazolyl như nhóm tetrazol-1-yl, nhóm tetrazol-2-yl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về nhóm heteroaryl 6 cạnh bao gồm nhóm pyridyl như nhóm pyridin-2-yl, nhóm pyridin-3-yl, nhóm pyridin-4-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm pyrazinyl như nhóm pyrazin-2-yl, nhóm pyrazin-3-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm pyrimidinyl như nhóm pyrimidin-2-yl, nhóm pyrimidin-4-yl, nhóm pyrimidin-5-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm pyridazinyl như nhóm pyridazin-3-yl, nhóm pyridazin-4-yl hoặc các nhóm tương tự; nhóm triazinyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về nhóm heteroaryl được ngưng tụ bao gồm nhóm indol-1-yl, nhóm indol-2-yl, nhóm indol-3-yl, nhóm indol-4-yl, nhóm indol-5-yl, nhóm indol-6-yl, nhóm indol-7-yl; nhóm benzofuran-2-yl, nhóm benzofuran-3-yl, nhóm benzofuran-4-yl, nhóm benzofuran-5-yl, nhóm benzofuran-6-yl, nhóm benzofuran-7-yl; nhóm benzothiophen-2-yl, nhóm benzothiophen-3-yl, nhóm benzothiophen-4-yl, nhóm benzothiophen-5-yl, nhóm benzothiophen-6-yl, nhóm benzothiophen-7-yl; nhóm benzimidazol-1-yl, nhóm benzimidazol-2-yl, nhóm benzimidazol-4-yl, nhóm benzimidazol-5-yl, nhóm benzoxazol-2-yl, nhóm benzoxazol-4-yl, nhóm benzoxazol-5-yl, nhóm benzothiazol-2-yl, nhóm benzothiazol-4-yl, nhóm benzothiazol-5-yl; nhóm quinolin-2-yl, nhóm quinolin-3-yl, nhóm quinolin-4-yl, nhóm quinolin-5-yl, nhóm quinolin-6-yl, nhóm quinolin-7-yl, nhóm quinolin-8-yl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về các nhóm heterocyclyl khác bao gồm nhóm aziridin-1-yl, nhóm aziridin-2-yl, nhóm epoxy; nhóm pyrrolidin-1-yl, nhóm pyrrolidin-2-yl, nhóm pyrrolidin-3-yl, nhóm tetrahydrofuran-2-yl, nhóm tetrahydrofuran-3-yl; nhóm [1,3]dioxiran-2-yl, nhóm [1,3]dioxiran-4-yl; nhóm piperidin-1-yl, nhóm piperidin-2-yl, nhóm piperidin-3-yl, nhóm piperidin-4-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm piperazin-2-yl, nhóm morpholin-2-yl, nhóm morpholin-3-yl, nhóm

morpholin-4-yl; nhóm 1,3-benzodioxol-4-yl, nhóm 1,3-benzodioxol-5-yl, nhóm 1,4-benzodioxan-5-yl, nhóm 1,4-benzodioxan-6-yl, nhóm 3,4-dihydro-2H-1,5-benzodioxepin-6-yl, nhóm 3,4-dihydro-2H-1,5-benzodioxepin-7-yl, nhóm 2,3-dihydrobenzofuran-4-yl, nhóm 2,3-dihydrobenzofuran-5-yl, nhóm 2,3-dihydrobenzofuran-6-yl, nhóm 2,3-dihydrobenzofuran-7-yl; hoặc các nhóm tương tự.

Trong số các nhóm này, nhóm heterocyclyl của Cy^1 hoặc Cy^2 ưu tiên là nhóm heteroaryl 5 cạnh hoặc nhóm heteroaryl 6 cạnh, ưu tiên nữa nếu là nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl, hoặc nhóm pyridazinyl.

Trong hợp chất amin vòng theo sáng chế, Cy^1 ưu tiên là nhóm phenyl, Cy^2 ưu tiên là nhóm pyridyl.

$[R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} \text{ và } R^{5a}]$

Trong công thức (I), $R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b}$ và R^{5a} (sau đây, có thể được gọi là " R^{1a} hoặc các nhóm tương tự") độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế; R^{1a} và R^{2a} , hoặc R^{3a} và R^{4a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$, hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl chưa được thế hoặc được thế). Ngoài ra, nhóm được tạo thành bằng cách liên kết R^{1a} với R^{2a} , R^{3a} với R^{4a} có thể được gọi là "nhóm chức liên kết ngang".

“Nhóm C_{1-6} alkyl” của R^{1a} hoặc các nhóm tương tự có thể là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc nhóm alkyl mạch nhánh. Ví dụ về nhóm alkyl bao gồm nhóm methyl, nhóm ethyl, nhóm n-propyl, nhóm n-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm n-hexyl, nhóm i-propyl, nhóm i-butyl, nhóm s-butyl, nhóm t-butyl, nhóm i-pentyl, nhóm neopentyl, nhóm 2-methyl butyl, nhóm 2,2-dimethyl propyl, nhóm i-hexyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về “nhóm C_{1-6} alkyl được thế” của R^{1a} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkyl như nhóm xyclopropyl methyl, nhóm 2-xyclopropyl ethyl, nhóm xyclopentyl methyl, nhóm 2-xyclohexyl ethyl, nhóm 2-xyclooctyl ethyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} haloalkyl như nhóm flomethyl, nhóm clomethyl, nhóm bromomethyl, nhóm diflomethyl, nhóm diclomethyl, nhóm dibromomethyl, nhóm triflomethyl, nhóm triclomethyl, nhóm tribromomethyl, nhóm 2,2,2-tolufloethyl, nhóm 2,2,2-tricloethyl, nhóm pentaflloethyl, nhóm 4-fllobutyl, nhóm 4-cllobutyl, nhóm 3,3,3-triflopropyl, nhóm 2,2,2-triflo-1-triflomethyl ethyl, nhóm perfllohexyl, nhóm perclohexyl, nhóm perfllooctyl, nhóm perclooctyl, nhóm 2,4,6-triclohexyl, nhóm hexaflloisopropyl, nhóm pentaflloisopropyl, nhóm perfllometoxy hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm hydroxy C_{1-6} alkyl như nhóm hydroxymethyl, nhóm 2-hydroxyethyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl như nhóm metoxymethyl, nhóm etoxymethyl, nhóm metoxyethyl, nhóm etoxyethyl, nhóm metoxy-n-propyl, nhóm n-propoxymethyl, nhóm i-propoxymethyl, nhóm i-propoxyethyl, nhóm s-butoxymethyl, nhóm t-butoxyethyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl như nhóm metoxymetoxymethyl, nhóm 1-metoxyetoxymethyl, nhóm 2-metoxyetoxymethyl, nhóm 2-(1-metoxyetoxy)ethyl, nhóm 2-(2-metoxyetoxy)ethyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm di C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl như nhóm dimetoxymethyl, nhóm dietoxymethyl, nhóm 2,2-dimetoxethyl, nhóm

1,2-dimetoxyetyl, nhóm 3,3-dimetoxy n-propyl, nhóm 2,2-dietoxyetyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-7} alyloxy C_{1-6} alkyl như nhóm formyloxyetyl, nhóm axetoxyetyl, nhóm 2-axetoxyetyl, nhóm propionyloxyetyl, nhóm propionyloxyetyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkyl được thế imino như nhóm iminometyl, nhóm (1-imino)etyl, nhóm (1-imino)propyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm C_{1-6} alkyl được thế hydroxyimino như nhóm hydroxyiminometyl, nhóm (1-hydroxyimino)etyl, nhóm (1-hydroxyimino)-n-propyl, nhóm metoxyiminometyl, nhóm (1-metoxyimino)etyl hoặc các nhóm tương tự;

Nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế như nhóm benzyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm phenetyl chưa được thế hoặc được thế hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về “nhóm C_{3-6} alkylen” được tạo thành bằng cách liên kết R^{1a} với R^{2a} , hoặc R^{3a} với R^{4a} bao gồm nhóm trimetylen, nhóm tetrametylen, nhóm propylen hoặc các nhóm tương tự. Trong số các nhóm này, nhóm C_{3-4} alkylen được ưu tiên.

Ngoài ra, ví dụ về “nhóm C_{3-6} alkenylen” bao gồm nhóm propenylen, nhóm 2-butenylen hoặc các nhóm tương tự. Trong số các nhóm này, nhóm C_{3-4} alkenylen được ưu tiên.

Ví dụ về “phần tử thế” có thể có bao gồm nguyên tử halogen như nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iot hoặc các nguyên tử tương tự; nhóm C_{1-6} alkyl như nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm n-hexyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{3-6} xycloalkyl như nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxy như nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm

i-propoxy, nhóm n-butoxy, nhóm s-butoxy, nhóm i-butoxy, nhóm t-butoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm hydroxy; nhóm C₁₋₆ haloalkyl như nhóm clometyl, nhóm cloetyl, nhóm triflometyl, nhóm 1,2-điclo-n-propyl, nhóm 1-flo-n-butyl, nhóm perflo-n-pentyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Trong công thức -CH₂NR⁶CH₂-, R⁶ biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₁₋₇ axyl chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm C₁₋₆ alkoxyacetyl chưa được thế hoặc được thế.

Ví dụ về “nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế” của R⁶ giống như các nhóm được liệt kê làm ví dụ về R^{1a} hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về “nhóm C₁₋₇ axyl” của R⁶ bao gồm nhóm formyl, nhóm axetyl, nhóm propionyl, nhóm benzoyl, nhóm xyclohexyl cacbonyl hoặc các nhóm tương tự. Ví dụ về “nhóm C₁₋₇ axyl được thế” của R⁶ bao gồm nhóm cloaxetyl, nhóm trifloaxetyl, nhóm tricloaxetyl, nhóm 4-clobenzoyl hoặc các nhóm tương tự.

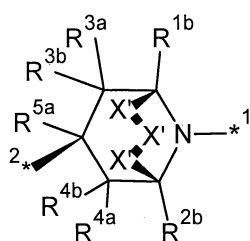
Ví dụ về “nhóm C₁₋₆ alkoxyacetyl” của R⁶ bao gồm nhóm metoxyacetyl, nhóm etoxyacetyl, nhóm n-propoxyacetyl, nhóm i-propoxyacetyl, nhóm n-butoxyacetyl, nhóm t-butoxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về “nhóm C₁₋₆ alkoxyacetyl được thế” của R⁶ bao gồm: nhóm C₃₋₈ xycloalkyl C₁₋₆ alkoxyacetyl như nhóm xyclopropyl metoxyacetyl, nhóm xyclobutyl metoxyacetyl, nhóm xyclopentyl metoxyacetyl, nhóm xyclohexyl metoxyacetyl, nhóm 2-metyl xyclopropyl metoxyacetyl, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl metoxyacetyl, nhóm 2-cloxypropyl metoxyacetyl, nhóm 2-xyclopropyl etoxyacetyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ haloalkoxyacetyl như nhóm flometoxyacetyl, nhóm clometoxyacetyl, nhóm brommetoxyacetyl, nhóm điflometoxyacetyl, nhóm đicometoxyacetyl, nhóm dibrommetoxyacetyl, nhóm

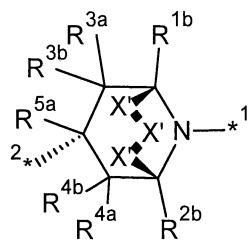
triflometoxycacbonyl, nhóm triclometoxycacbonyl, nhóm
 tribrommetoxycacbonyl, nhóm 2,2,2-trifloetoxycacbonyl, nhóm
 2,2,2-tricloetoxycacbonyl, nhóm pentaflorietoxycacbonyl, nhóm
 4-flobutoxycacbonyl, nhóm 3,3,3-triflopropoxycacbonyl, nhóm
 2,2,2-triflo-1-triflometyl etoxycacbonyl, nhóm perflohexyloxycacbonyl hoặc các
 nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Các công thức cấu trúc một phần (a1)-(a4) sau đây được thể hiện để giải thích gốc liên kết ngang một cách cụ thể. Trong các công thức (a1)-(a4), *1 biểu thị vị trí liên kết với Y, *2 biểu thị vị trí liên kết với nguyên tử oxy. Các X' độc lập biểu thị -CH₂-, nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, -NR⁶-, nhóm cacbonyl hoặc các nhóm tương tự. Sáng chế còn bao gồm các chất đồng phân trong đó gốc liên kết ngang có liên hệ ngoại sinh hoặc liên hệ nội sinh với R^{5a}, hoặc hỗn hợp của chúng.

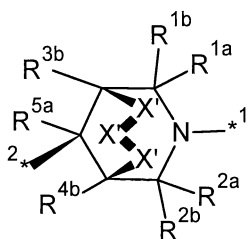
[Công thức hóa học 7]



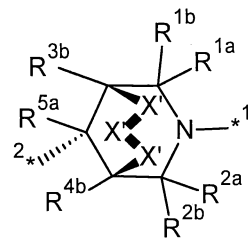
(a1)



(a2)



(a3)



(a4)

[R¹⁰, R¹¹, R²⁰, R²¹]

Trong công thức (I), R^{10} , R^{11} , R^{20} và R^{21} (sau đây, có thể được gọi là " R^{10} hoặc các nhóm tương tự") độc lập biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm hydroxy, nhóm oxo, nhóm C_{1-6} alkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm carboxyl, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyloxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryloxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyloxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyloxycarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxycarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxycarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyl aminocarbonyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm aminooxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyloxy

chưa được thế hoặc được thế, nhóm sulfonyloxy được thế, nhóm amino, nhóm C_{1-6} alkyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm hydroxyamino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkoxyacarbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacarbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacarbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryloxyacarbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyloxyacarbonyl amino chưa được thế hoặc được thế, nhóm sulfonyl amino được thế, nhóm aminocarbonyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm mercapto, nhóm C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-8} xycloalkyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{2-6} alkynyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{6-10} aryl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm heteroxyclyl thio chưa được thế hoặc được thế, nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkoxy chưa được thế hoặc được thế), nhóm carbonyl(C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm thiocarbonyl(C_{1-6} alkyl thio chưa được thế hoặc được thế), nhóm sulfinyl được thế, nhóm sulfonyl được thế, nhóm pentafluorosulfonyl, nhóm silyl được thế tri C_{1-6} alkyl, nhóm silyl được thế tri C_{6-10} aryl, nhóm xyano, nhóm nitro hoặc nguyên tử halogen.

R^{10} và R^{11} của Cy^1 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^1 để tạo thành vòng; R^{20} và R^{21} của Cy^2 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^2 để tạo thành vòng.

m biểu thị số lượng R^{10} và là số nguyên nằm trong khoảng 0-5, ưu tiên nếu bằng 1. Khi m bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau.

n biểu thị số lượng R^{11} và là số nguyên nằm trong khoảng 0-5, ưu tiên nếu bằng 1. Khi n bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{11} có thể giống nhau hoặc khác nhau.

p biểu thị số lượng R^{20} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, ưu tiên nếu bằng 1. Khi p bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{20} có thể giống nhau hoặc khác nhau.

r là số lượng R^{21} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, ưu tiên nếu bằng 1. Khi r bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{21} có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự giống như các nhóm được liệt kê làm ví dụ về R^{1a} hoặc các nhóm tương tự.

Ngoài ra, khác với các ví dụ về R^{1a} hoặc các nhóm tương tự, ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế" còn bao gồm nhóm C_{3-8} xycloalkoxy C_{1-6} alkyl được thế như nhóm cloxyclohexyloxymetyl, nhóm bromxyclohexyloxymetyl, nhóm 2-metyl xyclopropyloxymetyl, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyloxymetyl, nhóm spiro[2,2] penta-1-yloxymetyl, nhóm 1-metyl-spiro[2,2] penta-1-yloxymetyl, nhóm 1-hydroxymetyl spiro[2,2] penta-1-yloxymetyl, nhóm 4,4-điflo-spiro[2,2] penta-1-yloxymetyl, nhóm bixyclopropyl-2-yl, nhóm oxymetyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl được thế như nhóm cloxyclohexyl metoxymetyl, nhóm bromxyclohexyl metoxymetyl, nhóm 2-metyl xyclopropyl metoxymetyl, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl metoxymetyl, nhóm spiro[2,2] penta-1-yl metoxymetyl, nhóm 1-metyl-spiro[2,2] penta-1-yl metoxymetyl, nhóm

1-hydroxymethyl spiro[2,2] penta-1-yl metoxymethyl, nhóm 4,4-điflo-spiro[2,2] penta-1-yl metoxymethyl, nhóm bixyclopropyl-2-yl, nhóm metoxymethyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{3-8} xycloalkyl" của R^{10} bao gồm nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl, nhóm xycloheptyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{3-8} xycloalkyl được thế " bao gồm nhóm cloxyclohexyl, nhóm bromxyclohexyl, nhóm 2-metyl xyclopropyl, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl, nhóm spiro[2,2] penta-1-yl, nhóm 1-metyl-spiro[2,2] penta-1-yl, nhóm 1-hydroxymethyl spiro[2,2] penta-1-yl, nhóm 4,4-điflo-spiro[2,2] penta-1-yl, nhóm bixyclopropyl-2-yl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkenyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyl, nhóm 1-propenyl, nhóm 2-propenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 3-butenyl, nhóm 1-metyl-2-propenyl, nhóm 2-metyl-2-propenyl, nhóm 1-pentenyl, nhóm 2-pentenyl, nhóm 3-pentenyl, nhóm 4-pentenyl, nhóm 1-metyl-2-butenyl, nhóm 2-metyl-2-butenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 2-hexenyl, nhóm 3-hexenyl, nhóm 4-hexenyl, nhóm 5-hexenyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkenyl được thế " của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{2-6} haloalkenyl như nhóm 2-clo-1-propenyl, nhóm 2-flo-1-butenyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkynyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butynyl, nhóm 2-butynyl, nhóm 3-butynyl, nhóm 1-metyl-2-propynyl, nhóm 2-metyl-3-butynyl, nhóm 1-pentynyl, nhóm 2-pentynyl, nhóm 3-pentynyl, nhóm 4-pentynyl, nhóm 1-metyl-2-butynyl, nhóm 2-metyl-3-pentynyl, nhóm 1-hexynyl, nhóm 1,1-đimetyl-2-butynyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkynyl được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{2-6} haloalkynyl như nhóm 4,4-điclo-1-butynyl, nhóm 4-flo-1-pentynyl, nhóm 5-brom-2-pentynyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkoxy" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm i-propoxy, nhóm n-butoxy, nhóm i-butoxy, nhóm s-butoxy, nhóm t-butoxy, nhóm n-pentyloxy, nhóm i-pentyloxy, nhóm 2-metyl butoxy, nhóm neopentyl, nhóm n-hexyloxy hoặc các nhóm tương tự. Trong số các nhóm alkoxy này, nhóm C_{3-6} alkoxy được ưu tiên.

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkoxy được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{1-6} haloalkoxy như nhóm flometoxy, nhóm clometoxy, nhóm brommetoxy, nhóm điflometoxy, nhóm điclometoxy, nhóm dibrommetoxy, nhóm triflometoxy, nhóm triclometoxy, nhóm tribrommetoxy, nhóm 2,2,2-trifloetoxi, nhóm 2,2,2-tricloetoxi, nhóm pentaflorotoxi, nhóm 4-flobutoxy, nhóm 3,3,3-trifloropropoxy, nhóm 2,2,2-triflo-1-triflometyl etoxy, nhóm perflorhexyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm hydroxy C_{1-6} alkoxy như nhóm 2-hydroxyetoxi, nhóm 2-hydroxypropoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy như nhóm metoxymetoxi, nhóm 1-metoxietoxi, nhóm 2-metoxietoxi, nhóm etoxymetoxi, nhóm 1-etoxietoxi, nhóm 2-etoxietoxi, nhóm 1-metoxi-n-propoxy, nhóm 2-metoxi-n-propoxy, nhóm 3-metoxi-n-propoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy như nhóm xyclopropyl metoxi, nhóm xyclobutyl metoxi, nhóm xyclopentyl metoxi, nhóm xyclohexyl metoxi, nhóm 2-metyl xyclopropyl metoxi, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl metoxi, nhóm 2-xyclopropyl etoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{7-11} aralkyloxy như nhóm benzyloxy, nhóm phenyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy như nhóm axetyl metoxi, nhóm 2-axetyl etoxy hoặc

các nhóm tương tự; nhóm xyano C_{1-6} alkoxy như nhóm xyanometoxy, nhóm 2-xyanoetoxo hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy được thế như nhóm cloxyclohexyl metoxy, nhóm bromxyclohexyl metoxy, nhóm 2-metyl xyclopropyl metoxy, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl metoxy, nhóm spiro[2,2] penta-1-yl metoxy, nhóm 1-metyl-spiro[2,2] penta-1-yl metoxy, nhóm 1-hydroxymetyl spiro[2,2] penta-1-yl metoxy, nhóm 4,4-điflo-spiro[2,2] penta-1-yl metoxy, nhóm bixyclopropyl-2-yl metoxy hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{3-8} xycloalkoxy" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm xyclopropyloxy, nhóm xyclobutyloxy, nhóm xyclopentyloxy, nhóm xyclohexyloxy, nhóm xycloheptyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{3-8} xycloalkyloxy được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm cloxyclohexyloxy, nhóm bromxyclohexyloxy, nhóm 2-metyl xyclopropyloxy, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyloxy, nhóm spiro[2,2] penta-1-yloxy, nhóm 1-metyl-spiro[2,2] penta-1-yloxy, nhóm 1-hydroxymetyl spiro[2,2] penta-1-yloxy, nhóm 4,4-điflo-spiro[2,2] penta-1-yloxy, nhóm bixyclopropyl-2-yloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkenyloxy" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyloxy, nhóm 1-propenyloxy, nhóm 2-propenyloxy, nhóm 1-butenyloxy, nhóm 2-butenyloxy, nhóm 3-butenyloxy, nhóm 1-metyl-2-propenyloxy, nhóm 2-metyl-2-propenyloxy, nhóm 1-pentenyloxy, nhóm 2-pentenyloxy, nhóm 1-metyl-2-butenyloxy, nhóm 2-metyl-2-butenyloxy, nhóm 3-metyl-2-butenyloxy, nhóm 1-hexenyloxy, nhóm 2-hexenyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkenyloxy được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy như nhóm 2-clo-1-propenyloxy, nhóm

3,3-điclo-2-propenyloxy, nhóm 2-flo-1-butenyloxy hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkynyloxy" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyloxy, nhóm 1-propynyloxy, nhóm 2-propynyloxy, nhóm 1-butyloxy, nhóm 2-butyloxy, nhóm 3-butyloxy, nhóm 1-metyl-2-propynyloxy, nhóm 2-metyl-3-butyloxy, nhóm 1-pentyloxy, nhóm 2-pentyloxy, nhóm 1-metyl-2-butyloxy, nhóm 2-metyl-3-pentyloxy, nhóm 1-hexynyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkynyloxy được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy như nhóm 4,4-điclo-1-butyloxy, nhóm 4-flo-1-pentyloxy, nhóm 5-brom-2-pentyloxy hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{1-7} axyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm formyl, nhóm axetyl, nhóm propionyl, nhóm benzoyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{1-7} axyl được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{1-7} axyl được thế halogen như nhóm cloaxetyl, nhóm trifloaxetyl, nhóm tricloaxetyl, nhóm 4-clobenzoyl hoặc các nhóm tương tự;

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metoxyacbonyl, nhóm etoxyacbonyl, nhóm n-propoxyacbonyl, nhóm i-propoxyacbonyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxyacbonyl như nhóm xyclopropyl metoxyacbonyl, nhóm xyclobutyl metoxyacbonyl, nhóm xyclopentyl metoxyacbonyl, nhóm xyclohexyl metoxyacbonyl, nhóm 2-metyl xyclopropyl metoxyacbonyl, nhóm 2,3-đimetyl xyclopropyl metoxyacbonyl,

nhóm 2-cloxypropyl metoxycarbonyl, nhóm 2-xylopropyl etoxycarbonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ haloalkoxycarbonyl như nhóm flometoxycarbonyl, nhóm clometoxycarbonyl, nhóm brommetoxycarbonyl, nhóm điflometoxycarbonyl, nhóm điclometoxycarbonyl, nhóm dibrommetoxycarbonyl, nhóm triflometoxycarbonyl, nhóm triclometoxycarbonyl, nhóm tribrommetoxycarbonyl, nhóm 2,2,2-trifloetoxycarbonyl, nhóm 2,2,2-tricloetoxycarbonyl, nhóm pentaflorietoxycarbonyl, nhóm 4-florobutoxycarbonyl, nhóm 3,3,3-trifloropropoxycarbonyl, nhóm 2,2,2-trifloro-1-triflorometyl etoxycarbonyl, nhóm perflorohexyloxy carbonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ aryl C₁₋₆ alkyloxy carbonyl như nhóm benzyloxy carbonyl, nhóm 1-phenyl etoxycarbonyl hoặc các nhóm tương tự;

nhóm heterocyclus C₁₋₆ alkoxyacetyl như nhóm tetrahydrofuran-2-yl
methoxyacetyl, nhóm pyrazolyl methoxyacetyl, nhóm thiadiazolyl
methoxyacetyl, nhóm pyridyl methoxyacetyl, nhóm pyrimidinyl
methoxyacetyl, nhóm pyridazinyl methoxyacetyl hoặc các nhóm tương tự;

Ví dụ về "nhóm C₃₋₈ xycloalkyloxycarbonyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm xyclopropyloxycarbonyl, nhóm xyclobutoxycarbonyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyloxyacetyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etenyloxyacetyl, nhóm 2-propenyloxyacetyl, nhóm 1-propenyloxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyloxyacetyl được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm 1-metyl-2-propenyloxyacetyl, nhóm 2-metyl-1-propenyloxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyloxyacetyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyloxyacetyl, nhóm propargyloxyacetyl, nhóm 2-butyloxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyloxyacetyl được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm 1-metyl propargyloxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryloxyacetyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm phenyloxyacetyl, nhóm naphthoxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heterocycloxyloxyacetyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyloxyacetyl, nhóm pyridazinyloxyacetyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₇ alkoxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm formyloxy, nhóm acetyloxy, nhóm propionyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₇ alkoxy được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C₁₋₇ alkoxy được thế halogen như nhóm cloacetyloxy, nhóm trifloacetyloxy, nhóm tricloacetyloxy, nhóm 4-clobenzoyloxy; hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₆ alkoxyacetyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metoxyacetyloxy, nhóm etoxyacetyloxy, nhóm i-propoxyacetyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₃₋₈ cycloalkoxyacetyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm cyclopropyloxyacetyloxy, nhóm cyclobutyloxyacetyloxy, nhóm cyclopentyloxyacetyloxy, nhóm cyclohexyloxyacetyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyloxycarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyloxycarbonyloxy, nhóm 1-propenyloxycarbonyloxy, nhóm 2-propenyloxycarbonyloxy, nhóm 1-butenyloxycarbonyloxy, nhóm 2-butenyloxycarbonyloxy, nhóm 3-butenyloxycarbonyloxy, nhóm 1-metyl-2-propenyloxycarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyloxycarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyloxycarbonyloxy, nhóm 1-propynyloxycarbonyloxy, nhóm 2-propynyloxycarbonyloxy, nhóm 1-butynyloxycarbonyloxy, nhóm 2-butynyloxycarbonyloxy, nhóm 3-butynyloxycarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₆ alkyl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metyl aminocarbonyloxy, nhóm đimetyl aminocarbonyloxy, nhóm dietyl aminocarbonyloxy, nhóm i-propyl aminocarbonyloxy, nhóm i-butyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₃₋₈ xycloalkyl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm xyclopropyl aminocarbonyloxy, nhóm xyclobutyl aminocarbonyloxy, nhóm xyclopentyl aminocarbonyloxy, nhóm xyclohexyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyl aminocarbonyloxy, nhóm 1-propenyl aminocarbonyloxy, nhóm 2-propenyl aminocarbonyloxy, nhóm 1-butenyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyl aminocarbonyloxy, nhóm 1-propynyl aminocarbonyloxy, nhóm 2-propynyl aminocarbonyloxy, nhóm 1-butynyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm anilincarbonyloxy, nhóm naphthyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heterocyclyl aminocarbonyloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyl aminocarbonyloxy, nhóm pyridazinyl aminocarbonyloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm aminooxy được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C₁₋₆ alkyl aminooxy như nhóm methyl aminooxy, nhóm ethyl aminooxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₇ axyl aminooxy như nhóm formyl aminooxy, nhóm acetyl aminooxy hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₆ alkyliden aminooxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm methyliden aminooxy, nhóm ethyliden aminooxy, nhóm n-propyliden aminooxy, nhóm i-propyliden aminooxy, nhóm n-butyliden aminooxy, nhóm i-butyliden aminooxy, nhóm s-butyliden aminooxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự là giống như các nhóm được liệt kê làm ví dụ về Cy¹ hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heterocyclyl" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự là giống như các nhóm được liệt kê làm ví dụ về Cy¹ hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm phenoxy, nhóm naphthoxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heterocycliloxy" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyloxy, nhóm pyridaziniloxy hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm sulfonyloxy được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C₁₋₆ alkyl sulfonyloxy như nhóm methyl sulfonyloxy, nhóm ethyl sulfonyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ haloalkyl sulfonyloxy như nhóm

triflometyl sulfonyloxy, nhóm 2,2,2-trifloetyl sulfonyloxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ aryl sulfonyloxy như nhóm phenyl sulfonyloxy hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₆ alkyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm methyl amino, nhóm dimethyl amino, nhóm diethyl amino, nhóm i-butyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₃₋₈ xycloalkyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm xyclopropyl amino, nhóm xyclobutyl amino, nhóm xyclopentyl amino, nhóm xyclohexyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyl amino, nhóm 1-propenyl amino, nhóm 2-propenyl amino, nhóm 1-butenyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyl amino, nhóm 1-propynyl amino, nhóm 2-propynyl amino, nhóm 1-butylnyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm anilino, nhóm naphtyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heteroxyclyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyl amino, nhóm pyridazinyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm hydroxyamino được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C₁₋₆ alkoxyamino như nhóm metoxyamino, nhóm etoxyamino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₇ axyloxyamino như nhóm axetoxyamino, nhóm propionyloxyamino hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₇ axyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm formyl amino, nhóm axetyl amino, nhóm propanoyl amino, nhóm

butyryl amino, nhóm i-propyl cacbonyl amino, nhóm benzoyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₁₋₆ alkoxycarbonyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metoxycarbonyl amino, nhóm etoxycarbonyl amino, nhóm n-propoxycarbonyl amino, nhóm i-propoxycarbonyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkenyloxycarbonyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyl aminocarbonyl amino, nhóm 1-propenyl aminocarbonyl amino, nhóm 2-propenyl aminocarbonyl amino, nhóm 1-butenyl aminocarbonyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₂₋₆ alkynyloxycarbonyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyl aminocarbonyl amino, nhóm 1-propynyl aminocarbonyl amino, nhóm 2-propynyl aminocarbonyl amino, nhóm 1-butylnyl aminocarbonyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C₆₋₁₀ aryloxycarbonyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm anilincarbonyl amino, nhóm naphtyl aminocarbonyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heterocyclyloxycarbonyl amino" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyl aminocarbonyl amino, nhóm pyridazinyl aminocarbonyl amino hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm sulfonyl amino được thế" của R¹⁰ hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C₁₋₆ alkyl sulfonyl amino như nhóm methyl sulfonyloxy, nhóm ethyl sulfonyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₁₋₆ haloalkyl sulfonyl amino như nhóm triflometyl sulfonyl amino, nhóm 2,2,2-trifloethyl sulfonyl amino hoặc các nhóm tương tự; nhóm C₆₋₁₀ aryl sulfonyl amino như nhóm phenyl sulfonyl amino hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về “nhóm aminocacbonyl được thế” của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm đimetyl aminocacbonyl, nhóm phenyl aminocacbonyl, nhóm N-phenyl-N-metyl aminocacbonyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{1-6} alkyl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metyl thio, nhóm etyl thio, nhóm n-propyl thio, nhóm i-propyl thio, nhóm n-butyl thio, nhóm i-butyl thio, nhóm s-butyl thio, nhóm t-butyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{3-8} xycloalkyl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm xyclopropyl thio, nhóm xyclobutyl thio, nhóm xyclopentyl thio, nhóm xyclohexyl thio, nhóm xycloheptyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkenyl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm vinyl thio, nhóm 1-propenyl thio, nhóm 2-propenyl thio, nhóm 1-butenyl thio, nhóm 2-butenyl thio, nhóm 3-butenyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{2-6} alkynyl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm etynyl thio, nhóm 1-propynyl thio, nhóm 2-propynyl thio, nhóm 1-butynyl thio, nhóm 2-butynyl thio, nhóm 3-butynyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm C_{6-10} aryl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm phenyl thio, nhóm naphtyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm heteroxyclyl thio" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm pyridyl thio, nhóm pyridazinyl thio hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm $(C_{1-6}$ alkyl)thiocacbonyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metyl(thiocacbonyl), nhóm etyl(thiocacbonyl), nhóm n-propyl(thiocacbonyl), nhóm i-propyl(thiocacbonyl), nhóm

n-butyl(thiocarbonyl), nhóm i-butyl(thiocarbonyl), nhóm s-butyl(thiocarbonyl), nhóm t-butyl(thiocarbonyl) hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm (C_{1-6} alkoxy)thiocarbonyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm metoxy(thiocarbonyl), nhóm etoxy(thiocarbonyl), nhóm n-propoxy(thiocarbonyl), nhóm i-propoxy(thiocarbonyl), nhóm n-butoxy(thiocarbonyl), nhóm i-butoxy(thiocarbonyl), nhóm s-butoxy(thiocarbonyl), nhóm t-butoxy(thiocarbonyl) hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm (C_{1-6} alkyl thio)cacbonyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm (metyl thio)cacbonyl, nhóm (etyl thio)cacbonyl, nhóm (n-propyl thio)cacbonyl, nhóm (i-propyl thio)cacbonyl, nhóm (n-butyl thio)cacbonyl, nhóm (i-butyl thio)cacbonyl, nhóm (s-butyl thio)cacbonyl, nhóm (t-butyl thio)cacbonyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm (C_{1-6} alkyl thio)thiocarbonyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm (metyl thio)thiocarbonyl, nhóm (etyl thio)thiocarbonyl, nhóm (n-propyl thio)thiocarbonyl, nhóm (i-propyl thio)thiocarbonyl, nhóm (n-butyl thio)thiocarbonyl, nhóm (i-butyl thio)thiocarbonyl, nhóm (s-butyl thio)thiocarbonyl, nhóm (t-butyl thio)thiocarbonyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm sulfinyl được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{1-6} alkyl sulfinyl như nhóm metyl sulfinyl, nhóm etyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfinyl như nhóm triflometyl sulfinyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl sulfinyl như nhóm phenyl sulfinyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm sulfonyl được thế" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm C_{1-6} alkyl sulfonyl như nhóm metyl sulfonyl, nhóm etyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyl như nhóm triflometyl sulfonyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{6-10} aryl sulfonyl

như nhóm phenyl sulfonyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxysulfonyl như nhóm metoxysulfonyl, nhóm etoxysulfonyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm silyl được thế tri C_{1-6} alkyl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm trimetyl silyl, nhóm trietyl silyl, nhóm t-butyl đimetyl silyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nhóm silyl được thế tri C_{6-10} aryl" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nhóm triphenyl silyl hoặc các nhóm tương tự.

Ví dụ về "nguyên tử halogen" của R^{10} hoặc các nhóm tương tự bao gồm nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử flo, nguyên tử iot hoặc các nguyên tử tương tự.

R^{10} và R^{11} của Cy^1 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^1 để tạo thành vòng; R^{20} và R^{21} của Cy^2 có thể độc lập tạo thành vòng, hoặc liên kết với nhau để tạo ra vòng, hoặc có thể liên kết với nguyên tử cấu thành Cy^2 để tạo thành vòng.

Ví dụ về vòng có thể được tạo thành bao gồm vòng hydrocacbon thơm như vòng benzen hoặc các vòng tương tự; vòng C_{5-7} xycloalken như vòng xyclopenten, vòng xyclohexen, vòng xyclohepten hoặc các vòng tương tự; vòng thơm khác loại có từ 5 đến 7 cạnh như vòng furan, vòng thiophen, vòng pyrol, vòng imidazol, vòng pyrazol, vòng thiazol, vòng oxazol, vòng isoxazol, vòng pyridin, vòng pyrazin, vòng pyrimidin, vòng pyridazin, vòng azepin, vòng diazepin hoặc các vòng tương tự; vòng khác loại có từ 5 đến 7 cạnh không no như vòng dihydro-2H-pyran, vòng dihydro-2H-thiopyran, vòng tetrahydropyridin hoặc các vòng tương tự; hoặc các vòng tương tự.

Các vòng này có thể bao gồm phân tử thế.

Ví dụ về phần tử thế bao gồm nguyên tử halogen như nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iot hoặc các nguyên tử tương tự; nhóm C_{1-6} alkyl như nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm n-hexyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{3-6} xycloalkyl như nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, nhóm xyclohexyl hoặc các nhóm tương tự; nhóm C_{1-6} alkoxy như nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm i-propoxy, nhóm n-butoxy, nhóm s-butoxy, nhóm i-butoxy, nhóm t-butoxy hoặc các nhóm tương tự; nhóm hydroxy; nhóm C_{1-6} haloalkyl như nhóm clometyl, nhóm cloetyl, nhóm triflometyl, nhóm 1,2-điclo-n-propyl, nhóm 1-flo-n-butyl, nhóm perflo-n-pentyl hoặc các nhóm tương tự; hoặc các nhóm tương tự.

Trong công thức (I), R^{10} ưu tiên biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm xyano C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy, nhóm hydroxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacbonyl, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl, nhóm C_{1-6} alkyl aminocacbonyl, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heteroxycyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio, hoặc nhóm nitro.

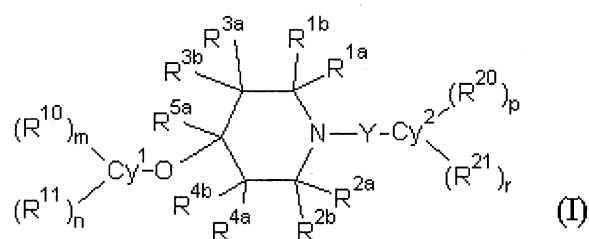
Trong công thức (I), R^{11} ưu tiên biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentaflorsulfanyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl, hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl.

Trong công thức (I), R^{20} ưu tiên biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentaflorsulfanyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl, hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl.

Trong công thức (I), R^{21} ưu tiên biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxyacetyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxyacetyl, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm nitro.

Trong công thức (I), Y biểu thị nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh.

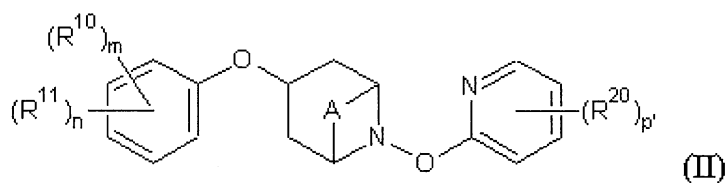
[Công thức hóa học 8]



Trong hợp chất amin vòng theo sáng chế, Cy^1 ưu tiên là nhóm phenyl, Cy^2 là nhóm pyridin-2-yl, R^{1b} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} , và R^{5a} là nguyên tử hydro, R^{1a} và R^{2a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$, hoặc nhóm được biểu thị bằng

công thức: $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ (với điều kiện R^6 là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế), Y là nguyên tử oxy, r bằng 0, và p là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4. Tức là, hợp chất amin vòng theo sáng chế ưu tiên là hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (II).

[Công thức hóa học 9]



Ngoài ra, R^{10} , m, R^{11} , n và R^{20} có công thức (II) giống như đã được xác định trước đây trong công thức (I). Trong công thức (II), p' biểu thị số lượng R^{20} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4. Khi p' bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{20} có thể giống nhau hoặc khác nhau. Trong công thức (II), A biểu thị nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế).

[Muối của hợp chất amin vòng]

Không có giới hạn cụ thể đối với các muối của hợp chất amin vòng theo sáng chế miễn là nó là muối được cho phép trong nông nghiệp và trong nghề làm ươm. Ví dụ về muối bao gồm các muối của axit vô cơ như axit clohydric hoặc axit sulfuric; các muối của axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit lactic; các muối của

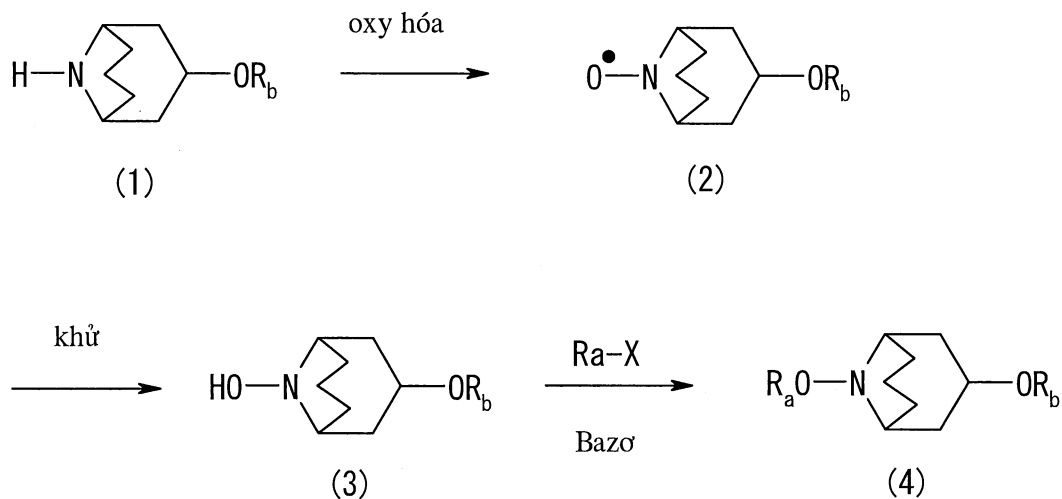
kim loại kiềm như lithi, natri hoặc kali; các muối của kim loại kiềm thổ như canxi hoặc magie; các muối của kim loại chuyển tiếp như sắt hoặc đồng; và các muối của các bazơ hữu cơ như amoniac, trietylamin, tributylamin, pyridin hoặc hydrazin. Muối của hợp chất amin vòng theo sáng chế có thể được sản xuất bởi phương pháp đã được biết rõ sử dụng hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc (II).

[Phương pháp sản xuất]

Không có giới hạn cụ thể đối với phương pháp sản xuất hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng.

Trước tiên, phương pháp sản xuất hợp chất hydroxyl amin theo sáng chế, trong đó Y là nguyên tử oxy sẽ được giải thích. Khi Y là nguyên tử oxy, phương pháp sản xuất thông qua hợp chất được biểu thị bằng Công thức (3) sau đây làm hợp chất trung gian được ưu tiên.

[Công thức hóa học 10]



Trước tiên, hợp chất amin bậc hai được biểu thị bằng công thức (1) (sau đây, có thể được gọi là "hợp chất (1)") được điều chế. Hợp chất aminoxyl được biểu thị bằng công thức (2) (sau đây, có thể được gọi là "hợp chất (2)") sau đó có thể được tổng hợp bằng cách oxy hoá hợp chất (1) với chất oxy hóa thích hợp. Ví

dụ cụ thể về phương pháp phản ứng oxy hóa bao gồm phương pháp trong đó chất oxy hóa như hydro peroxit, natri hypoclorit hoặc chất oxy hóa hữu cơ có thể phản ứng được trong dung môi thích hợp như rượu khan hoặc ngâm nước như metanol, etanol, propanol hoặc isopropanol, ete như dioxan hoặc tetrahydrofuran (THF) hoặc axetonitril, và phương pháp trong đó phức chất vonframmat-hydro peroxit ure có thể phản ứng được. Ngoài ra, ví dụ khác về phương pháp có thể được sử dụng bao gồm thổi khí chứa oxy hoặc oxy hoạt tính như ozon vào hỗn hợp phản ứng.

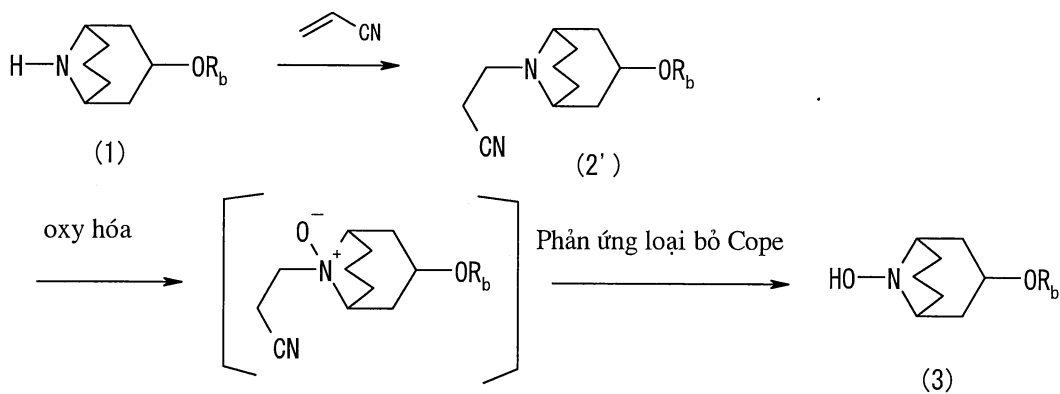
Sau đó, nhóm aminoxyl được chuyển hóa thành nhóm hydroxyamino bằng cách khử hợp chất (2) trong các điều kiện thích hợp. Hợp chất hydroxyamin được biểu thị bằng công thức (3) (sau đây, có thể được gọi là "hợp chất (3)") được tạo ra bằng phản ứng khử này.

Sau phản ứng khử, heteroxyclyl halogenua được phản ứng với hợp chất (3) với sự có mặt của bazơ. Do đó, có thể thu được hợp chất heteroxyclyloxyamin được biểu thị bằng công thức (4). Ví dụ, phản ứng này được mô tả trong patent Mỹ số 5286865.

Hơn nữa, trong các công thức từ (1) đến (4) nêu trên, R_b biểu thị nhóm phenyl được thế, R_a biểu thị nhóm heteroxyclyl được thế, và X biểu thị nguyên tử halogen.

Ngoài ra, hợp chất (3) cũng có thể thu được bằng phương pháp khác, ví dụ, phương pháp sản xuất được biểu thị dưới đây.

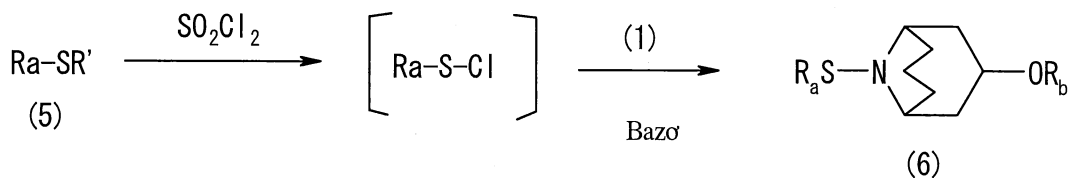
[Công thức hóa học 11]



Hợp chất alkylamino được biểu thị bằng công thức (2') (sau đây, có thể được gọi là "hợp chất (2')") thu được bằng cách N-alkyl hóa hợp chất (1) nêu trên với acrylonitril. Tiếp theo, hợp chất (3) có thể thu được bằng cách oxy hoá với chất oxy hóa thích hợp để thu được dạng N-oxit trong hệ phản ứng và sau đó cho dạng N-oxit này qua phản ứng loại bỏ của Cope. Ví dụ, phản ứng này được mô tả trong Tetrahedron Letters, 48 (2007), pp. 1683-1686.

Mặt khác, hợp chất theo sáng chế, trong đó Y là nguyên tử lưu huỳnh có thể được sản xuất theo phương pháp sản xuất sau.

[Công thức hóa học 12]



Trước tiên, hợp chất sulfenyl được biểu thị bằng công thức (5) (sau đây, có thể được gọi là "hợp chất (5)") (trong công thức này, R' biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm benzyl) được điều chế. Sau đó, sulfuryl clorua được thêm vào và phản ứng với hợp chất (5) để thu được hợp chất sulfenyl clorua, sau đó tiếp tục cho phản ứng với hợp chất (1) với sự có mặt của bazơ để thu được hợp chất heterocyclithioxyamin được biểu thị bằng công thức (6). Phương pháp sản xuất hợp chất sulfenyl clorua được mô tả trong Synthesis 1994; volume 1994 (1): 21-22 hoặc các tài liệu tương tự.

[Hợp chất hydroxyamin]

Hợp chất hydroxyamin theo sáng chế là hợp chất được biểu thị bằng công thức (III). Ngoài ra, muối của hợp chất hydroxyamin theo sáng chế là muối của hợp chất được biểu thị bằng công thức (III). Hợp chất được biểu thị bằng công thức (III) hoặc muối của hợp chất đó được ưu tiên là hợp chất trung gian để sản xuất hợp chất được biểu thị bằng công thức (I) hoặc công thức (II) hoặc muối của hợp chất đó.

Trong công thức (III), Cy^1 , R^{10} , R^{11} , m , n , R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} và R^{5a} giống như đã được xác định trước đây trong công thức (I).

Trong công thức (III), R^{1a} và R^{2a} , hoặc R^{3a} và R^{4a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$, hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm C_{1-6} alkoxyacetyl chưa được thế hoặc được thế). Ví dụ về các nhóm hữu cơ có hoá trị hai này giống như đã được xác định trước đây trong công thức (I).

Trong công thức (III), Cy^1 ưu tiên là nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl hoặc nhóm pyridazinyl.

Trong công thức (III), R^{10} ưu tiên biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkoxy, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} xycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm xyano C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-7} axyl C_{1-6} alkoxy, nhóm hydroxy C_{1-6}

alkoxy, nhóm C_{1-7} alkyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxy, nhóm C_{2-6} alkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyl aminocarbonyloxy, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heterocyclyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio, hoặc nhóm nitro.

Trong công thức (III), R^{11} ưu tiên biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluoranyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl, hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl.

Không có giới hạn cụ thể đối với muối của hợp chất hydroxyamin theo sáng chế miễn là nó không ức chế phản ứng với heterocyclyl halogenua với sự có mặt của bazơ. Ví dụ về các muối này bao gồm các muối của kim loại kiềm như muối lithi, muối natri hoặc muối kali. Muối của hợp chất hydroxyamin theo sáng chế có thể thu được bằng phương pháp đã được biết rõ sử dụng hợp chất hydroxyamin được biểu thị bằng công thức (III).

Vì hợp chất amin vòng theo sáng chế, hoặc muối của hợp chất này, thể hiện được tác dụng diệt côn trùng trên côn trùng trưởng thành, côn trùng còn non, ấu trùng, trứng côn trùng và các dạng tương tự, chúng có thể được sử dụng để khống chế sinh vật gây hại như côn trùng gây hại trên cây trồng nông nghiệp, ve bét, con tích, côn trùng có hại về mặt vệ sinh, côn trùng gây hại cho ngũ cốc đã được bảo quản, côn trùng có hại cho quần áo và côn trùng gây hại cho gia đình.

Ví dụ về côn trùng như vậy bao gồm các côn trùng sau:

các loài gây hại thuộc côn trùng vảy cánh ví dụ, như *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, sâu xám *agrotis ipsilon*, sâu bướm màu xanh lá cây, *Autographa nigrisigna*, *Plutella xylostella*, *Adoxophyes honmai*, *Homona*

magnanima, *Carposina sasakii*, *Grapholita molesta*, *Phyllocnistis citrella*, *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoniella*, *Lymantria dispar*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Hyphantria cunea*, *Cadra cautella*, giống *Heliothis*, giống *Helicoverpa*, giống *Agrothis*, *Tinea translucens*, *Cydia pomonella*, và *Pectinophora gossypiella*;

các loài gây hại thuộc côn trùng cánh nửa ví dụ, như *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Lipaphis erysimi*, *Rhopalosiphum padi*, *Riptortus clavatus*, *Nezara antennata*, *Unaspis yanonensis*, *Pseudococcus comstocki*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Bemisia argentifolii*, *Psylla pyrisuga*, *Stephanitis nashi*, *Nilaparvata lugens*, *Laodelphax striatella*, *Sogatella furcifera*, và *Nephotettix cincticeps*;

các loài gây hại thuộc bộ cánh cứng ví dụ, như *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Sitophilus zeamais*, *Callosobruchus chinensis*, *Popillia japonica*, *Anomala rufocuprea*, genus *Diabrotica*, *Lasioderma serricorne*, *Lyctus brunneus*, *Monochamus alternatus*, *Anoplophora malasiaca*, genus *Agriotis*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Tenebroides mauritanicus*, và *Anthonomus grandis*;

các loài gây hại thuộc bộ côn trùng hai cánh ví dụ, như *Musca domestica*, *Calliphora lata*, *Boettcherisca peregrine*, *Zeugodacus cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Delia platura*, *Agromyza oryzae*, *Drosophila melanogaster*, *Stomoxys calcitrans*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Aedes aegypti*, và *Anopheles sinensis*;

các loài gây hại thuộc bộ cánh tơ ví dụ, như *Thrips palmi*, và *Scirtothrips dorsalis*;

các loài gây hại thuộc bộ côn trùng cánh màng ví dụ, như *Monomorium pharaonis*, *Vespa simillima xanthoptera*, và *Athalia rosae ruficornis*;

các loài gây hại thuộc bộ côn trùng cánh thẳng ví dụ, như *Locusta migratoria*, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, và *Periplaneta fuliginosa*;

các loài gây hại thuộc bộ côn trùng cánh đều ví dụ, như *Coptotermes formosanus* và *Reticulitermes speratus*;

các loài gây hại thuộc bộ siphonaptera (bọ chét) ví dụ, như *Pulex irritans* và *Ctenocephalides felis*; các loài gây hại thuộc bộ phthiraptera (chấy rận) ví dụ, như *Pediculus humanus*;

giun tròn ký sinh ở cây như *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus spp.*, *Heterodera glycines*, *Aphelenchoides besseyi*, và *Bursaphelenchus xylophilus*; và bộ ve bét.

Trong số các côn trùng này, hợp chất amin vòng theo sáng chế hoặc muối của hợp chất đó hiệu quả để làm hoạt chất của thuốc diệt ve bét vì nó đặc biệt hữu hiệu trong việc khống chế bộ ve bét.

Ví dụ về các đối tượng bộ ve bét mà sáng chế nhắm tới để khống chế được chỉ ra dưới đây:

bộ ve bét thuộc họ Tetranychidae, bao gồm *Brevipalpus lewisi*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia praetiosa*, *Bryobia rubrioculus*, *Dolichotetranychus floridanus*, *Eotetranychus boreus*, *Eotetranychus geniculatus*, *Eotetranychus pruni*, *Eotetranychus sexmanaculatus*, *Eotetranychus smithi*, *Eotetranychus uncatus*, *Oligonychus hondoensis*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus karamatus*, *Oligonychus shinkajii*, *Panonychus citri*, *Panonychus mori*, *Panonychus ulmi*, *Tenuipalpus zhizhilashviliae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus viennensis* hoặc *Tuckerella pavoniformis*;

bộ ve bét thuộc họ Eriophyidae, như *Acaphylla theavagrans*, *Aceria paradianthi*, *Aceria tulipae*, *Aculops lycopersici*, *Aculops pelekassi*, *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Calacarus carinatus*, *Calepitrimerus vitis*, *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Eriophes kuko* hoặc *Eriophyes chibaensis*;

bộ ve bét thuộc họ Astigmata, như *Acarus siro*, *Aleuroglyphus ovatus*, *Carpoglyphus lactis*, *Lardoglyphus konoi*, *Rhizoglyphus echinopus*, *Rhizoglyphus robini*, *Tyrophagus putrescentiae* hoặc *Tyrophagus similis*;

bộ ve bét thuộc họ Tarsonemidae, như *Phytonemus pallidus*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Tarsonemus bilobatus* hoặc *Tarsonemus waitei*;

bộ ve bét thuộc họ Eupodidae, như *Penthaleus erythrocephalus* hoặc *Penthaleus major*;

bộ ve bét thuộc họ Ixodidae, như *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis japonica*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor taiwanensis*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Dermacentor reticulatus* hoặc các nhóm tương tự.

Ngoài ra, bộ ve bét có khả năng kháng có tính kháng các thuốc diệt ve bét thông thường đã biết cũng được bao gồm trong các ví dụ về bộ ve bét trên đây.

Hợp chất amin vòng theo sáng chế hoặc muối của hợp chất đó gây ra ít tổn hại hóa học, chúng tỏ mức độc tính thấp ở cá và động vật máu nóng, và là hợp chất có mức độ an toàn đặc biệt cao.

[Thuốc diệt ve bét]

Thuốc diệt ve bét theo sáng chế chứa hoạt chất là ít nhất một loại được chọn từ nhóm bao gồm hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc công thức (II) hoặc muối của chúng. Trong thuốc diệt ve bét theo sáng chế, một loại hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc công thức (II) hoặc

muối của chúng có thể được chứa riêng rẽ, hoặc hai hoặc nhiều loại có thể được chứa trong hỗn hợp.

Ngoài ra, mặc dù thuốc diệt ve bét theo sáng chế có thể chỉ chứa hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc công thức (II) theo sáng chế, hoặc muối của chúng, thuốc này còn có thể chứa chất mang như chất mang rắn, chất mang lỏng hoặc chất mang dạng khí. Ngoài ra, thuốc diệt ve bét theo sáng chế có thể có hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc công thức (II), hoặc muối của chúng, được thấm vào vật liệu nền như đĩa gốm xốp hoặc vải không dệt. Hơn nữa, chất hoạt động bề mặt hoặc chất bổ sung khác có thể được bổ sung khi cần thiết.

Thuốc diệt ve bét theo sáng chế có thể được bào chế thành dạng có khả năng được chấp nhận một cách thông thường như các hóa chất nông nghiệp, cụ thể ở dạng bột dễ phân tán trong nước, hạt, bột, nhũ tương, bột tan trong nước, hỗn dịch, bột dễ phân tán trong nước dạng hạt, chế phẩm chảy được, khí dung, chế phẩm phun mù, chất làm thoát nhiệt, thuốc xông, bả độc hoặc vi nang.

Ví dụ về các chất phụ gia và chất mang được sử dụng khi bào chế chế phẩm rắn gồm bột thực vật như bột đậu tương hoặc bột mì, bột khoáng mịn như đất tảo silic, apatit, thạch cao, bột talc, bentonit, pyrophyllit hoặc đất sét; và hợp chất hữu cơ và vô cơ như natri benzoat, ure hoặc natri sulfat.

Ví dụ về dung môi được sử dụng khi bào chế chế phẩm lỏng bao gồm các phân đoạn dầu mỏ như kerosen, xylen hoặc naphta dung môi; xyclohexan, xyclohexanon, dimetylformamit, dimetylsulfoxit, rượu, axeton, metyl isobutyl keton, dầu khoáng, dầu thực vật và nước.

Ví dụ về chất mang dạng khí được sử dụng khi bào chế các chất đẩy bao gồm khí butan, LPG, dimetyl ete và khí cacbon đioxit.

Ví dụ về vật liệu nền của bả độc bao gồm các thành phần bả như bột ngũ cốc, dầu thực vật, đường hoặc xenluloza tinh thể, chất chống oxy hóa như dimethylhydroxytoluen hoặc axit nordihydroguaiaretic, chất bảo quản như axit dehydroaxetic, chất cản nuốt ngẫu nhiên cho trẻ nhỏ và vật nuôi như bột tiêu ốt cayen, hương thơm hấp dẫn côn trùng như mùi thơm của phomát hoặc mùi thơm của hành.

Chất hoạt động bề mặt có thể được bổ sung để thu được dạng đồng đều và ổn định trong quá trình bào chế chế phẩm. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt bao gồm chất hoạt động bề mặt không ion như polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen este của axit béo bậc cao, polyoxyetylen sorbitan este của axit béo bậc cao hoặc polyoxyetylen tristyryl phenyl ete, sulfat este của polyoxyetylen alkyl phenyl ete, alkylnaphtalen sulfonat, polycarboxylat, lignin sulfonat, phân ngưng formaldehyt của alkylnaphtalen sulfonat và copolyme isobutylen-anhydrit maleic.

Trong trường hợp sử dụng thuốc diệt ve bét theo sáng chế trong các ứng dụng nông nghiệp, hàm lượng hợp chất amin vòng theo sáng chế hoặc muối của chúng trong chế phẩm tốt hơn nếu nằm trong khoảng từ 0,01% khối lượng đến 90% khối lượng và tốt hơn nữa nếu nằm trong khoảng từ 0,05% khối lượng đến 85% khối lượng.

Thuốc diệt ve bét để ứng dụng trong nông nghiệp mà được cung cấp ở dạng bột dễ phân tán trong nước, nhũ tương, hỗn dịch, chế phẩm chảy được, bột tan được trong nước hoặc bột dễ phân tán trong nước dạng hạt có thể được điều chế dưới dạng dung dịch, hỗn dịch hoặc nhũ tương bằng cách pha loãng đến nồng độ định sẵn bằng nước và sau đó được phun lên trên cây hoặc đất. Ngoài ra, thuốc diệt ve bét để ứng dụng trong nông nghiệp mà được cung cấp ở dạng bột hoặc hạt có thể được phun trực tiếp lên trên cây hoặc đất.

Ngoài ra, thuốc diệt ve bét để ngăn ngừa bệnh dịch mà được cung cấp ở dạng nhũ tương, bột dễ phân tán trong nước hoặc chế phẩm chảy được và dạng tương tự có thể được áp dụng bằng cách pha loãng đến nồng độ định sẵn bằng nước. Ngoài ra, thuốc diệt ve bét để ngăn ngừa bệnh dịch mà được cung cấp ở dạng dung dịch dầu, khí dung, chế phẩm phun mù, bả độc hoặc tấm diệt bét ve có thể được sử dụng một cách trực tiếp.

Trong trường hợp sử dụng thuốc diệt ve bét theo sáng chế để khống chế bộ ve bét ký sinh trên động vật ở vật nuôi như bò hoặc lợn và các vật nuôi như chó hoặc mèo, hợp chất amin vòng theo sáng chế có thể được sử dụng ở tỷ lệ nằm trong khoảng từ 0,01 mg đến 1000 mg cho mỗi 1 kg động vật chủ.

Thuốc diệt ve bét để khống chế bộ ve bét ký sinh ở động vật có thể được áp dụng bằng cách sử dụng các phương pháp thú y đã biết. Ví dụ về phương pháp này bao gồm phương pháp trong đó thuốc diệt ve bét được đưa vào cơ thể động vật bằng viên nén, viên nang, chất lỏng ngậm, chất phụ gia thực phẩm, thuốc đạn hoặc tiêm (tiêm trong cơ, dưới da, tĩnh mạch hoặc trong ổ bụng) khi được sử dụng nhằm mục kiểm soát hệ thống, phương pháp trong đó chế phẩm lỏng dạng dầu hoặc chứa nước được sử dụng bằng cách phun, rót lên trên hoặc chấm tại chỗ khi được sử dụng nhằm mục đích kiểm soát không hệ thống, và phương pháp trong đó thuốc diệt ve bét được trộn với nhựa và sản phẩm đã được nhào trộn để đúc thành hình dạng thích hợp như hình dạng vòng cổ hoặc miếng đeo tai mà sau đó được gắn vào cơ thể động vật.

Thuốc diệt ve bét theo sáng chế có thể được trộn hoặc được sử dụng kết hợp với thuốc diệt nấm, các thuốc diệt côn trùng hoặc thuốc diệt ve bét khác, thuốc diệt giun tròn, thuốc trừ loài gây hại ở đất, chất điều hòa cây, chất hiệp đồng, phân bón, chất cải thiện đất hoặc thức ăn cho động vật và các dạng tương tự.

Phần dưới đây liệt kê các ví dụ tiêu biểu về thuốc diệt nấm, các thuốc diệt côn trùng hoặc thuốc diệt ve bét khác, thuốc diệt giun tròn, thuốc trừ loài gây hại ở đất và chất điều hòa cây có khả năng được sử dụng để trộn với hợp chất theo sáng chế.

Thuốc diệt nấm:

1) gốc benzimidazol: benomyl, carbendazim, fuberidazol, thiabendazol, metyl thiophanat hoặc các chất tương tự;

2) thuốc diệt nấm gốc dicarboxyimit: chlozolinat, iprodion, procymidon, vinclozolin hoặc các chất tương tự;

3) thuốc diệt nấm DMI: imdazalil, oxpoconazol, pefurazoat, prochloraz, triflumizol, triforin, pyrifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromconazol, cyproconazol, difenoconazol, điniconazol, epoxyconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipuconazol, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, etaconazol, furconazol-cis hoặc các chất tương tự;

4) gốc phenylamit: benalaxyl, furalaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M, oxadixyl, ofurace hoặc các chất tương tự;

5) gốc amin: aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidine, piperalin, spiroxamin hoặc các chất tương tự;

6) gốc phosphothiolat: EDDP, iprobenfos, pyrazophos hoặc các chất tương tự;

7) gốc dithiolan: isoprothiolan hoặc các chất tương tự;

8) gốc carboxamit: benodanil, boscalid, carboxin, fenfuran, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad, thifluzamit hoặc các chất tương tự;

9) gốc hydroxy(2-amino)pyrimidin: bupirimat, dimethirimol, ethirimol hoặc các chất tương tự;

10) thuốc diệt nấm AP (gốc anilinopyrimidin): xyprodinil, mepanipyrim, pyrimetanil hoặc các chất tương tự;

11) gốc N-phenylcarbamat: dietofencarb hoặc các chất tương tự;

12) thuốc diệt nấm QoI (gốc chất ức chế Qo): azoxystrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin, orysastrobin, famoxadon, fluoxastrobin, fenamidon, metominofen hoặc các chất tương tự;

13) thuốc diệt nấm PP (gốc phenylpyrol): fenpiconil, fludioxonil hoặc các chất tương tự;

14) gốc quinolin: quinoxifen hoặc các chất tương tự;

15) thuốc diệt nấm AH (gốc hydrocacbon thơm): biphenyl, chloroneb, dichloran, quintozen, tecnazen, tolclofos-metyl hoặc các chất tương tự;

16) gốc MBI-R: fthalide, pyroquilon, trixyclozol hoặc các chất tương tự;

17) gốc MBI-D: carpropamit, diclocymet, fenoxanil hoặc các chất tương tự;

18) chất SBI: fenhexamid, pyributicarb, terbinafin hoặc các chất tương tự;

19) phenylure: pencycuron hoặc các chất tương tự;

20) thuốc diệt nấm Qil (chất ức chế Qi): cyazofamid hoặc các chất tương tự;

21) gốc benzamit: zoxamit hoặc các chất tương tự;

22) gốc enopyranuron: blasticidin, mildiomyxin hoặc các chất tương tự;

23) gốc hexopyranosyl: kasugamyxin hoặc các chất tương tự;

24) gốc glucopyranosyl: streptomycin, validamycin hoặc các chất tương tự;

- 25) gốc xyanoaxetoamit: xymoxanil hoặc các chất tương tự;
- 26) gốc carbamat: idocarb, propamocarb, prothiocarb, polycarbamat hoặc các chất tương tự;
- 27) chất khử liên hợp: binapacryl, dinocap, ferimzon, fluazinam hoặc các chất tương tự;
- 28) hợp chất thiếc hữu cơ: triphenyl thiếc axetat, triphenyl thiếc clorua, triphenyl thiếc hydroxit hoặc các chất tương tự;
- 29) phosphat este: axit phosphonic, tolclofos-metyl, fosetyl hoặc các chất tương tự;
- 30) gốc phtalamit: tecloftalam hoặc các chất tương tự;
- 31) gốc benzotriazin: triazoxit hoặc các chất tương tự;
- 32) gốc benzen sulfonamit: flusulfamit hoặc các chất tương tự;
- 33) pyridazinon: diclomezin hoặc các chất tương tự;
- 34) gốc thuốc diệt nấm CAA (carboxylic amit): đimetomorph, flumorph, benthiavalicarb, iprovalicarb, mandipropamit hoặc các chất tương tự;
- 35) tetracyclin: oxytetracyclin hoặc các chất tương tự;
- 36) gốc thiocarbamat: methasulfocarb hoặc các chất tương tự; và,
- 37) các hợp chất khác: etridiazol, polyoxin, axit oxolinic, hydroxyisoxazol, octinolin, silthiofam, diflumetorim, acibenzolar-s-metyl, probenazol, tiadinil, ethaboxam, cyflufenamid, proquinazid, metrafenon, fluopicolit, đồng hydroxit, đồng hữu cơ, lưu huỳnh, ferbam, manzeb, maneb, metiram, propineb, thiuram, zineb, ziram, captan, captafol, folpet, clothalonil, dichlofluanid, tolylfluanid, đodín, guazatin, iminoctadin axetat, iminoctadin dodecylbenzen sulfonat, anilazin, dithianon, clopicrin, dazomet, muối metam natri, chinomethionat, cyprofuram, silthiofam, agrobacterium, floimit.

Ví dụ về thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt giun tròn và thuốc diệt loài gây hại ở đất bao gồm:

1) gốc (thio)phosphat hữu cơ: như axephat, azamethiphos, azinphos-metyl, chlorpyriphos, chlorpyriphos-metyl, chlorfenvinphos, diazinon, dichlorvos, dicrotophos, đimetoat, disulfoton, ethion, EPN, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, isoxathion, malathion, methamidophos, metidation, metyl parathion, mevinphos, monocrotopho, oxydemeton-metyl, paraoxon, parathion, phenthoat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phorat, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, prothiofos, sulprofos, tetraclovinphos, terbufos, triazophos, trichlorfon, fosthiazat, phosphocarb, cadusafos, disulfoton, demeton-s-metyl, BRP, CYAP, etoprophos, quinalphos, đimetylvinphos, vamidothion, pyraclofos, hoặc các chất tương tự; [0158]

2) gốc carbamat: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, fenoxycarb, fenothiocarb, methiocarb, metomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamat, ethiofencarb, fenobucarb, MIPC, MPMC, MTMC, pyridafenthion, furathiocarb, XMC hoặc các chất tương tự;

3) gốc pyrethroid: allethrin, bifenthrin, xyfluthrin, xyhalothrin, cyphenothrin, xypermetrin, alphaxypermetrin, betaxypermetrin, zetaxypermetrin, deltamethrin, esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, imiprothrin, lambda xyhalothrin, permethrin, prallethrin, pyrethrin I và II, resmethrin, silafluofen, tau-fluvalinat, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, profluthrin, dimefluthrin, acrinathrin, xycloprothrin, halfenprox, fluxythrinate hoặc các chất tương tự;

4) chất điều hòa sinh trưởng:

a) chất ức chế tổng hợp chitin: clorfluazuron, diflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron,

triflumuron, bistrifluron, nobifumuron, buprofezin, điofenolan, hexythiazox, etoxazol, clofentezin hoặc các chất tương tự;

b) chất đối kháng ecdyson: halofenozit, metoxyfenozit, tebufenozit, azadiractin, cromfenozit hoặc các chất tương tự;

c) các chất giống như hormon kích sâu non: pyriproxyfen, metopren hoặc fenoxycarb;

d) chất ức chế sinh tổng hợp lipid: spirotetramat hoặc các chất tương tự;

[0160]

5) hợp chất chất chủ vận/chất đối kháng thụ thể nicotin: axetamiprit, clothianidine, dinotefuran, imidacloprit, nitenpyram, thiacloprid, thiametoxam hoặc các chất tương tự;

6) Hợp chất chất đối kháng GABA: axetoclo, endosulfan, ethiprol, fipronil, vaniliprole, pyrafluprol, pyriprol hoặc các chất tương tự;

7) thuốc diệt côn trùng lacton vòng lớn: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad, ivermectin hoặc các chất tương tự;

8) hợp chất METI I: fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenirim hoặc các chất tương tự;

9) hợp chất METI II và III: acequinocyl, fluacyprim, hydrametylnon hoặc các chất tương tự;

10) hợp chất chất khử liên hợp: clorfenapyr hoặc các chất tương tự;

11) hợp chất chất ức chế phosphoryl hóa oxy hóa: cyhexitin, diafenthiuron, fenbutatin oxit, propargit hoặc các chất tương tự;

12) hợp chất chống lột xác: xyromazin hoặc các chất tương tự;

13) hợp chất chất ức chế oxidaza chức năng hỗn hợp: piperonyl butoxit hoặc các chất tương tự;

14) hợp chất phong bế kênh natri: indoxacarb, metaflumizon;

15) thuốc diệt loài gây hại dạng vi khuẩn: chất BT, chất thuộc virus có tác dụng gây bệnh côn trùng, chất thuộc nấm có tác dụng gây bệnh côn trùng, chất thuộc nấm có tác dụng gây bệnh giun tròn hoặc các chất tương tự;

16) các hợp chất khác: benclorbutaz, bifenthiat, carbofenthiat, flonicamid, pyradalyl, pymetrozin, lưu huỳnh, thiocyclam, flubendiamid, cyenopirafen, flupyraxofos, cyflumetofen, amidoflomet, bensultap, dicofol, tetradifon, fenpyroximat, amitraz, chlordimeform, triazamat, pymetrozin, pyrimidifen, 1,3-diclopropen, clofentenzin, fluacrypyrim, rotenon, DCIP, phenisobromlat, benzomat, methaldehyt, chlorantraniliprol, spinetoram, pyrifluquinazon hoặc các chất tương tự.

Ví dụ về chất điều hòa sinh trưởng cây bao gồm:

Axit abscisic, axit indol butyric, uniconazol, ethepthon, cloxyfonic, chlormequat, chất chiết rong tiểu cầu, canxi peroxit, xyanamid, dicloprop, gibberellin, daminozyl, rượu dexylic, trinexapac-ethyl, mepiquat-clorua, paclobutrazol, sáp parafin, piperonyl butoxit, pyraflufen etyl, flurprimidol, prohydrojasmon, prohexadion-canxi, benzylaminopurin, pendimethalin, forchlorfenuron, kali hydrazit maleat, 1-naphtylaxetamid, 4-CPA, MCPB, cholin, oxyquinolin sulfat, ethepthon, butralin, 1-metylcyclopropen, aviglyxin hydroclorua và các chất tương tự.

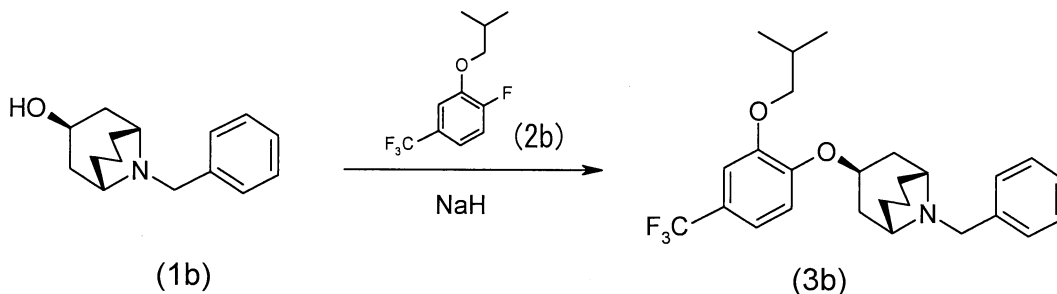
Ví dụ thực hiện sáng chế

Phần ví dụ sau nhằm mục đích giải thích chi tiết hơn về sáng chế bằng cách đưa ra các ví dụ của sáng chế. Tuy nhiên, phạm vi của sáng chế không bị giới hạn bởi các ví dụ sau.

Ví dụ 1

Điều chế 3-endo-[2-i-butoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[5-(triflometyl)-2-pyridyloxy]-9-azabixyclo[3.3.1]nonan (hợp chất số H-1)

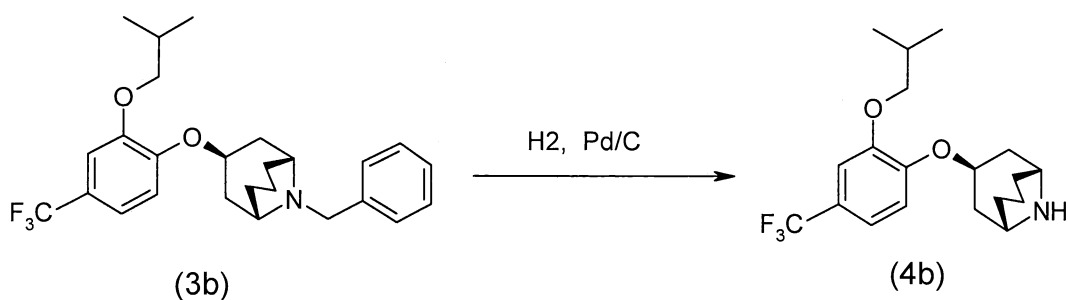
[Công thức hóa học 13]



3-endo-9-benzyl-9-azabixyclo[3.3.1]nonan-3-ol (Hợp chất (1b)) được tổng hợp bằng phương pháp được mô tả trong WO 2007/039563.

Dung dịch N,N-đimetyl formamit (14 ml) của hợp chất (1b) (1,35 g) và 4-fluoro-3-i-butoxybenzotriflorua (hợp chất (2b)) (1,38 g) được gia nhiệt tới 90°C, tiếp đó được bổ sung natri hydrua 60% (0,35 g) và khuấy trong 2 giờ. Hỗn hợp thu được sau đó được làm nguội tới nhiệt độ trong phòng, được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích (3b) (2,04 g).

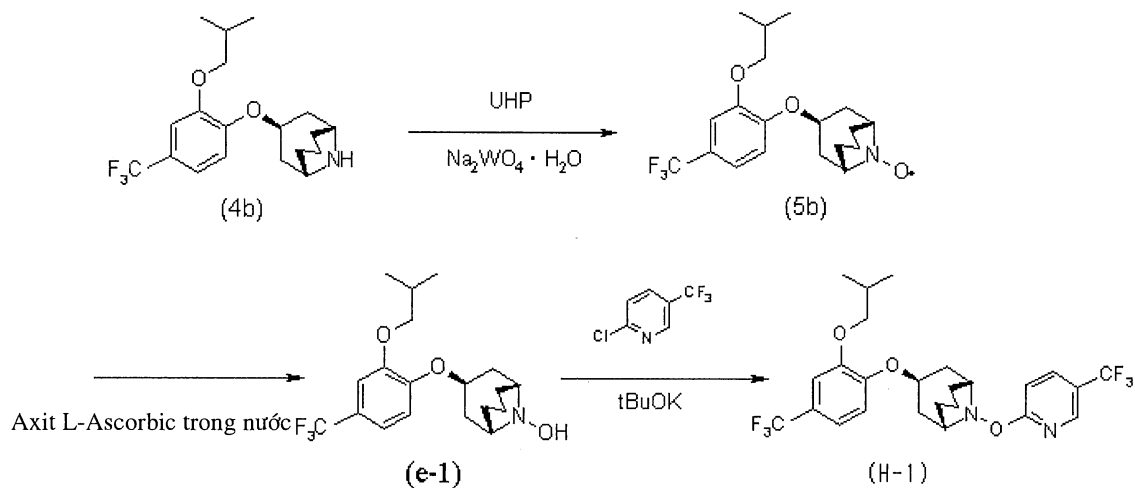
[Công thức hóa học 14]



Paladi-cacbon 10% (0,4 g) được bổ sung vào dung dịch etanol (20 ml) của hợp chất (3b) (2,04 g). Hỗn dịch thu được được gia nhiệt ở 50°C trong môi trường khí hydro trong 5 giờ. Hỗn dịch sau đó được làm nguội và được lọc qua

elit, và phân dịch lọc được chưng cất dưới áp suất giảm. Hợp chất (4b) thu được được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

[Công thức hóa học 15]



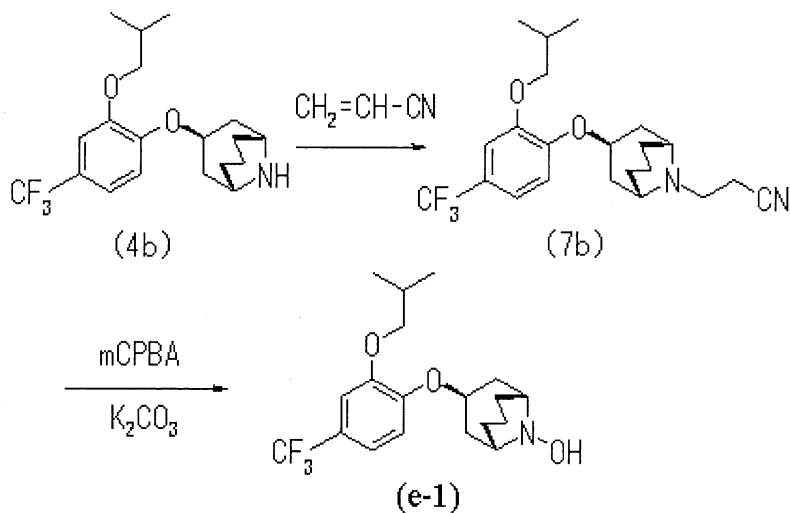
Natri hydrat của axit vonframic (0,13 g) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (14 ml) của hợp chất thô (4b) (1,41 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó được khuấy trong 30 phút. Hỗn hợp thu được sau đó được làm lạnh tới 0°C , sau đó được bổ sung sản phẩm cộng ure-hydro peroxit (UHP, 0,75 g). Hỗn hợp thu được được khuấy ở 0°C trong 45 phút và được khuấy tiếp ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ. Nước được bổ sung vào hỗn hợp, sau đó được chiết bằng clorofom. Lớp hữu cơ được làm khô và được cô bằng kali cacbonat khan. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (5b) (0,57). Hợp chất (5b) sau đó được pha loãng bằng clorofom và được xử lý bằng axit ascorbic trong nước để thu được hợp chất (e-1) thô (0,37 g). Tiếp theo, t-butoxykali (1M tetrahydrofuran, 1,11 ml) được bổ sung vào dung dịch tetrahydrofuran (4 ml) của hợp chất thô (e-1) (0,37 g) và 2-clo-5-(triflometyl)pyridin (0,18 g) ở 0°C trong môi trường nitơ, tiếp đó được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và được khuấy trong 2 giờ. Nước được bổ sung vào hỗn hợp thu được, và hỗn hợp thu được được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan,

được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích H-1 (0,27 g).

Ví dụ 2

Điều chế 3-endo-[2-i-butoxy-4-(triflormetyl) phenoxy]-9-hydroxy-9-azabixyclo [3.3.1]nonan (hợp chất số e-1)

[Công thức hóa học 16]



Acrylonitril (9,07 g) được bổ sung vào dung dịch metanol (300 ml) của hợp chất thô (4b) (30,23 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó được khuấy qua đêm. Dung môi được cô dưới áp suất giảm, và phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột silicagel (hexan:etyl axetat = 4:1 đến 6:4) để thu được hợp chất (7b) (30,4 g, dầu nhớt).

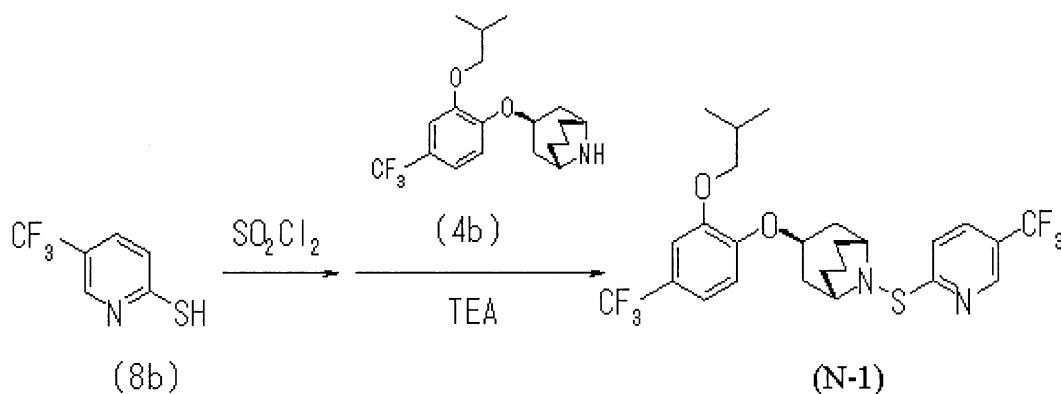
Kali cacbonat (15,5 g) và axit metacloperbenzoic (độ tinh khiết 70%, 23,71 g) được bổ sung vào dung dịch metylen clorua (600 ml) của hợp chất (7b) (30,4 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó hỗn hợp thu được được khuấy trong 4 giờ. Magie sulfat khan (10 g) được bổ sung vào hỗn hợp và hỗn hợp được lọc, tiếp đó dung môi được cô đặc dưới áp suất giảm. Phần cặn được pha loãng bằng etyl axetat, được rửa bằng axit ascorbic trong nước, sau đó bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Hexan được bổ

sung vào phần cặn để xử lý và nhờ đó thu được hợp chất (e-1) thô (17,79 g). Ngoài ra, dịch cái của chúng được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất tinh thể (e-1) (8,12 g, nhiệt độ tan chảy nằm trong khoảng từ 112 đến 115°C).

Ví dụ 3

Điều chế 3-endo-[2-i-butoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[5-(triflometyl)-2-pyridyl thio]-9-azabicyclo[3.3.1]nonan (hợp chất số N-1)

[Công thức hóa học 17]

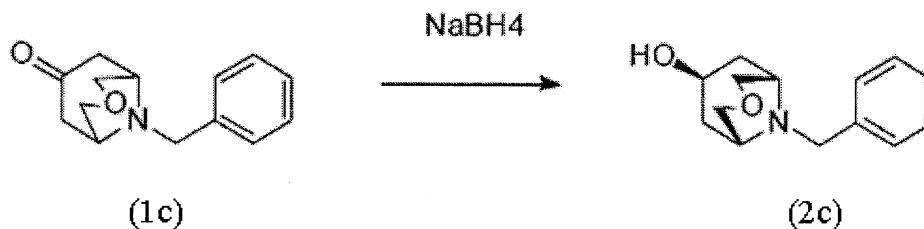


Dung dịch metylen clorua (10 ml) của hợp chất (8b) (0,55 g) mà có thể được điều chế bởi phương pháp đã biết được làm lạnh xuống 0°C trong môi trường nitơ sau đó được bổ sung sulfryl clorua (0,46 g). Hỗn hợp thu được được khuấy trong 1 giờ, tiếp đó được cô đặc dưới áp suất giảm. Dung dịch thu được bằng cách pha loãng phần cặn bằng metylen clorua (10 ml) được nhỏ giọt vào dung dịch metylen clorua (10 ml) của hợp chất thô (4b) (1,0 g) và trietylamin (0,34 g) trong khi dung dịch này đang được làm lạnh bằng đá, tiếp đó được làm ấm từ từ tới nhiệt độ trong phòng và chỉ được khuấy qua đêm. Hỗn hợp thu được được rót vào nước, sau đó được chiết bằng clorofom. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột silicagel (hexan:etyl axetat = 9:1) để thu được hợp chất đích (N-1) (1,36 g, dầu nhớt).

Ví dụ 4

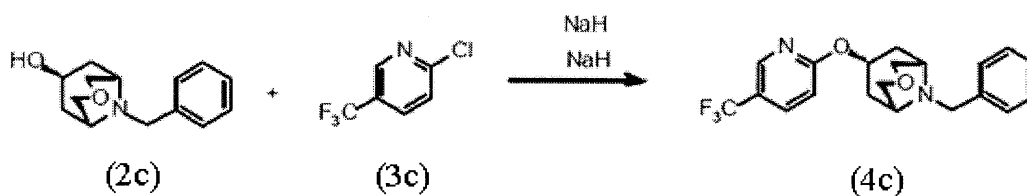
Điều chế 3-oxa-7-endo-[5-(triflometyl)-2-pyridyloxy]-9-[2-isopropoxycacbonyl]-4-(triflometyl)phenoxy]-9-azabixyclo[3.3.1]nonan (hợp chất số (K-12))

[Công thức hóa học 18]



9-benzyl-3-oxa-9-azabixyclo[3.3.1]nonan-7-on (1c) được tổng hợp bằng phương pháp được mô tả trong WO2007/022502. Natri bo hydrua (0,785 g) được bổ sung vào dung dịch ethanol (50 ml) của hợp chất (1c) (4 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó hỗn hợp thu được được khuấy trong 3 giờ. Hỗn hợp sau đó được làm nguội, và được cô dưới áp suất giảm, sau đó được rót vào nước và chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (2c) (3,62 g).

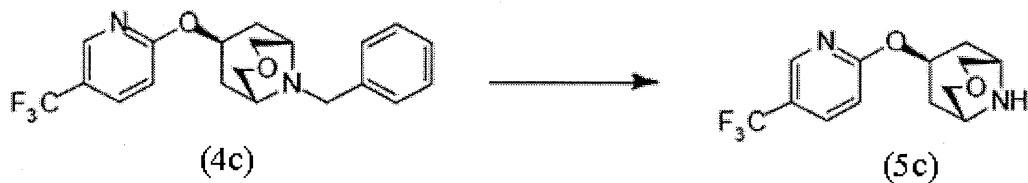
[Công thức hóa học 19]



Dung dịch DMF (30 ml) của hợp chất (2c) (2,45 g) và 2-chloro-5-(triflometyl)pyridin (2,86 g) được gia nhiệt tới 80°C, sau đó được bổ sung natri hydrua 60% (0,42 g). Hỗn hợp thu được được khuấy trong 30 phút, sau đó được bổ sung natri hydrua 60% (0,42 g). Hỗn hợp thu được sau đó chỉ được khuấy trong 2 giờ. Sau đó, hỗn hợp được làm nguội tới nhiệt độ trong phòng, được rót vào nước, sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng

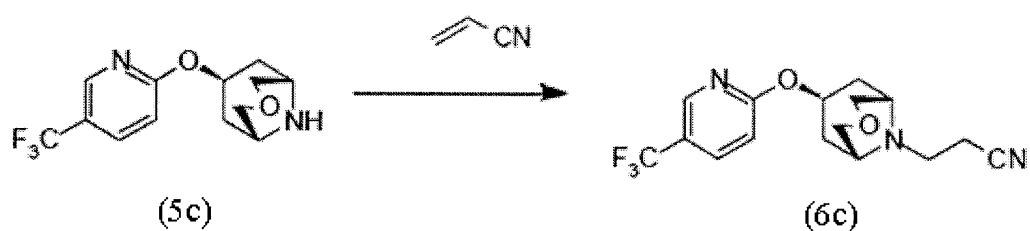
nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (4c) (3,05 g).

[Công thức hóa học 20]



Paladi hydroxit-cacbon 20% (0,92 g) được bổ sung vào dung dịch ethanol (50 ml) của hợp chất (4c) (3,05 g), sau đó hỗn dịch thu được được gia nhiệt ở 50°C trong 6 giờ. Hỗn hợp thu được sau đó được làm nguội và lọc qua xelit, và phần dịch lọc được chưng cất dưới áp suất giảm. Hợp chất thu được (5c) được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế tiếp.

[Công thức hóa học 21]

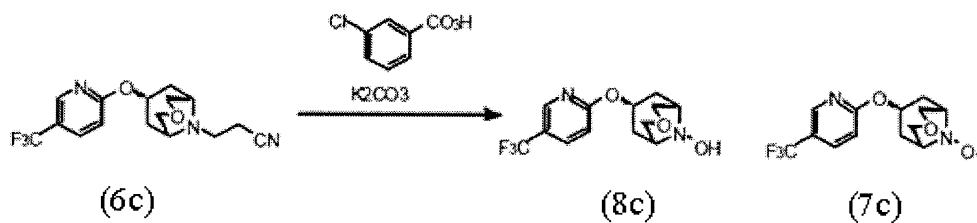


Acrylonitril (1,06 g) được bổ sung vào dung dịch metanol (50 ml) của hợp chất thô (5c) (2,3 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó được khuấy qua đêm. Dung môi được cô dưới áp suất giảm, và phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột silicagel để thu được hợp chất (6c) (2,11 g).

Hợp chất (6c): mp. 87-90°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 8,41(s, 1H), 7,73(d, 1H), 6,81(d, 1H), 5,47-5,40(m, 1H), 3,87(d, 2H), 3,60(d, 2H), 2,98(t, 2H), 2,84(d, 2H), 2,50-2,42(m, 4H), 1,87(d, 1H), 1,82(d, 1H)

[Công thức hóa học 22]

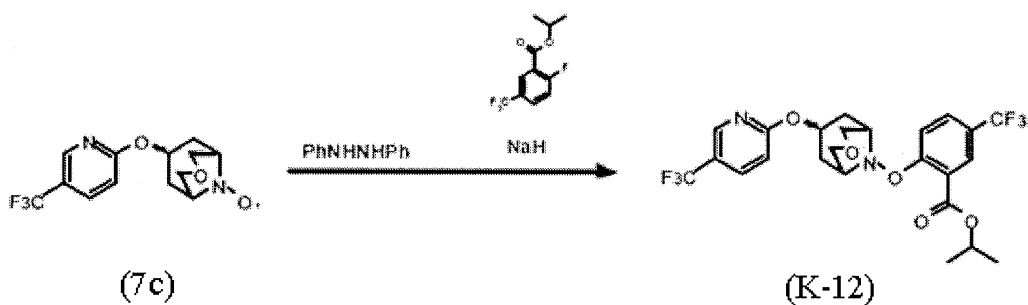


Axit meta-cloperbenzoic (độ tinh khiết 70%, 0,58 g) và kali cacbonat (0,4 g) được bổ sung vào dung dịch metylen clorua (20 ml) của hợp chất (6c) (0,76 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó được khuấy trong một giờ. Magie sulfat khan được bổ sung vào hỗn hợp và hỗn hợp được lọc qua xelit, tiếp đó dung môi được cô đặc dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (7c) (0,38) và hợp chất (8c) (0,2 g).

Hợp chất (8c): mp. 110-113°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm, nhiệt độ xác định 21,2 °C) 8,43(s, 1H), 7,73(d, 1H), 6,80(d, 1H), 5,68-5,61(m, 0,7H), 5,39-5,36(m, 0,3H), 4,38(d, 0,5H), 3,79(s, 3H), 3,37(d, 0,5H), 3,24(d, 1,5H), 3,11(d, 0,5H), 2,75-2,53(m, 2H), 2,17-2,05(brd, 0,5H), 1,78-1,72(d,d, 1,5H)

[Công thức hóa học 23]



1,2-diphenyl hydrazin (0,14 g) được bổ sung vào dung dịch THF (5 ml) của hợp chất (7c) (0,38 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó hỗn hợp thu được được khuấy trong 30 phút. natri hydrua 60% (0,06 g) được bổ sung vào hỗn hợp, sau đó được khuấy trong 10 phút. Sau đó, dung dịch THF (5 ml) của isopropyl của axit 2-flo-5-(triflometyl) benzoic (0,314 g) được bổ sung vào hỗn hợp thu được,

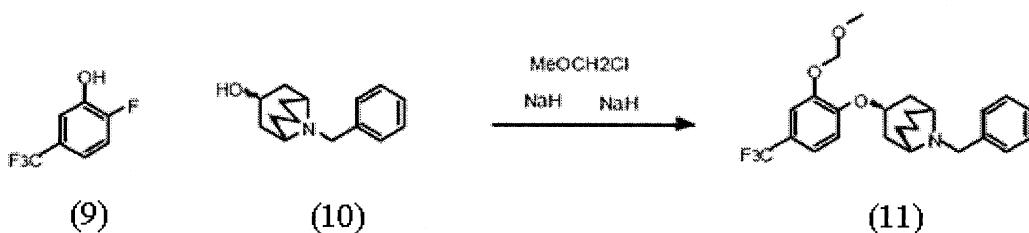
sau đó được khuấy trong một giờ. Hỗn hợp sau đó được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích (hợp chất số (K-12)) (0,27 g, dầu nhớt).

Ví dụ 5

Điều chế 3-endo-[2-butoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-

9-[5-(triflometyl)-2-pyridyloxy]-9-azabicyclo[3.3.1]nonan (hợp chất số (H-54))

[Công thức hóa học 24]



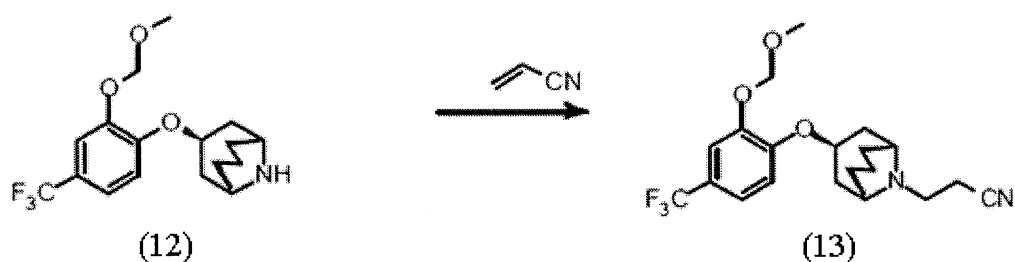
Natri hydrua 60% (0,75 g) được bổ sung vào dung dịch DMF (20 ml) của 2-flu-5-(triflometyl)phenol (2,83 g) trong khi được làm lạnh bằng đá. Hỗn hợp thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 30 phút, và clometylete (1,39 g) được nhỏ giọt vào hỗn hợp trong khi được làm lạnh bằng đá. Hỗn hợp sau đó được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và được khuấy trong 30 phút, và sau đó được gia nhiệt tới 80°C và được khuấy tiếp trong một giờ. Hợp chất (10) (4 g) và natri hydrua 60% (0,94 g) được bổ sung vào hỗn hợp thu được, sau đó được khuấy trong 3 giờ. Hỗn hợp sau đó được làm nguội tới nhiệt độ trong phòng, được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích (11) (6,29 g).

[Công thức hóa học 25]



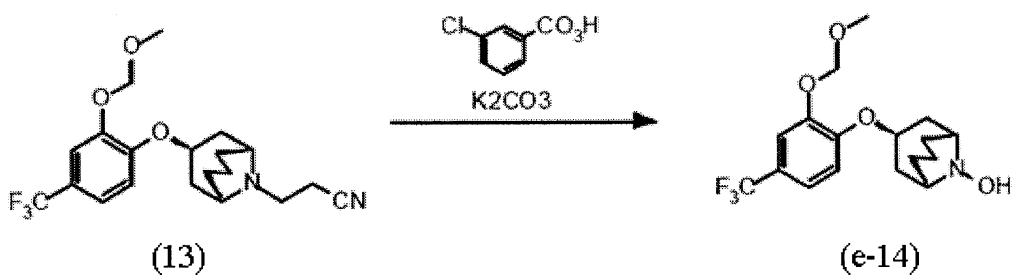
Paladi hydroxit-cacbon 20% (1,25 g) được bổ sung vào dung dịch ethanol (100 ml) của hợp chất (11) (6,27 g). Hỗn dịch thu được được gia nhiệt ở 50°C trong môi trường khí hydro trong 2 giờ, sau đó được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Hỗn hợp sau đó được lọc qua xelit, và phần dịch lọc được chưng cất dưới áp suất giảm. Hợp chất (12) thu được được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế tiếp.

[Công thức hóa học 26]



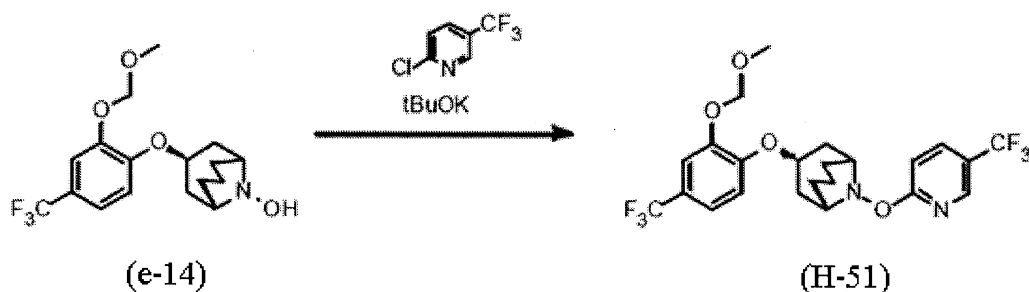
Acrylonitril (1,45 g) được bổ sung vào dung dịch metanol (50 ml) của hợp chất thô (12) (4,71 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó được khuấy qua đêm. Dung môi được cô dưới áp suất giảm, và phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột silicagel để thu được hợp chất (13) (5,09 g, dầu nhớt).

[Công thức hóa học 27]



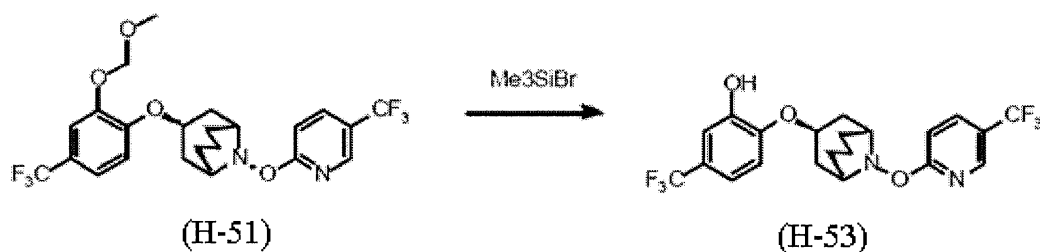
Axit meta-cloperbenzoic (độ tinh khiết 70%, 1,2 g) và kali cacbonat (0,78 g) được bổ sung vào dung dịch metylen clorua (30 ml) của hợp chất (13) (1,5 g) ở nhiệt độ trong phòng, sau đó hỗn hợp thu được được khuấy trong 2 giờ. Magie sulfat khan (10 g) được bổ sung vào hỗn hợp, và hỗn hợp được lọc, tiếp đó dung môi được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được pha loãng bằng metylen clorua, được rửa bằng axit ascorbic trong nước, sau đó được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (e-14) (1,35 g).

[Công thức hóa học 28]



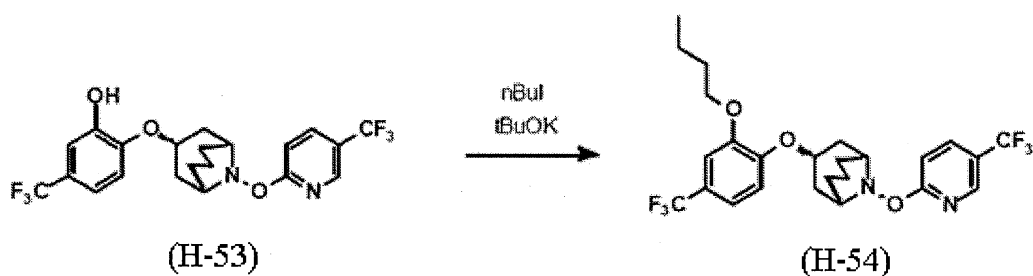
t-butoxykali (1M THF, 3,6 ml) được bổ sung vào dung dịch THF (20 ml) của hợp chất (e-14) (1,3 g) và 2-clo-5-(triflometyl)pyridin (0,65 g) ở 0°C trong môi trường nitơ, tiếp đó được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và được khuấy trong 2 giờ. Hỗn hợp thu được sau đó được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (H-51) (0,67g, dầu nhớt).

[Công thức hóa học 29]



Brom trimetyl silan (0,302 g) được bổ sung từ từ vào dung dịch metylen clorua (5 ml) của hợp chất (H-51) (0,25 g) trong môi trường nitơ ở -30°C . Hỗn hợp thu được sau đó được khuấy ở -30°C trong một giờ, tiếp đó được làm ấm lên tới 0°C trong 2 giờ. Hỗn hợp sau đó được rót vào nước lạnh, sau đó được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (H-53) (0,13g, mp $141-144^{\circ}\text{C}$).

[Công thức hóa học 30]

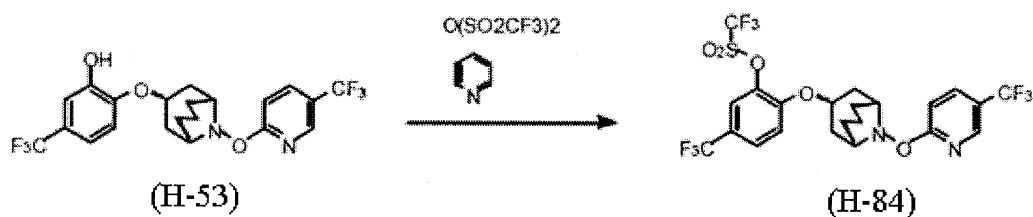


t-butoxykali (0,085 g) được bổ sung vào dung dịch THF (6 ml) của hợp chất (H-53) (0,35 g) và 1-iodobutan (0,14 g) trong khi được làm lạnh bằng đá. Sau đó, hỗn hợp được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng, và tiếp tục được gia nhiệt tới 50°C và được khuấy qua đêm. Hỗn hợp thu được sau đó được làm nguội tới nhiệt độ trong phòng, được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích (hợp chất số (H-54)) (0,24 g, dầu nhớt).

Ví dụ 6

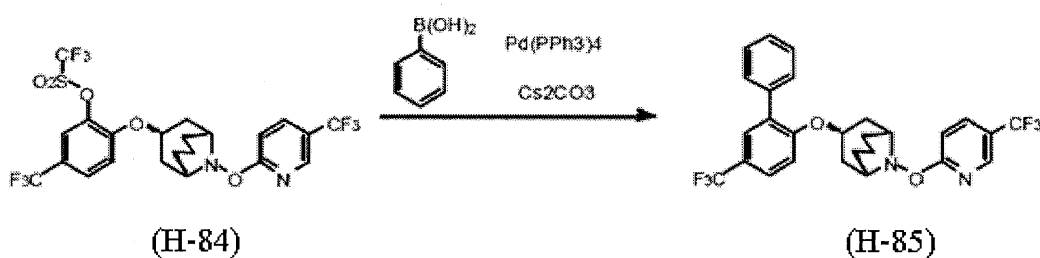
Điều chế 3-endo-[2-phenyl-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[5-(triflometyl)-2-pyridyloxy]-9-azabixyclo[3.3.1]nonan (hợp chất số(H-85))

[Công thức hóa học 31]



Axit triflometan sulfonic khan (3,66 g) được bổ sung từ từ vào dung dịch metylen clorua (50 ml) của hợp chất (H-53) (5 g) và pyridin (2,14 g) trong khi được làm lạnh bằng đá. Sau đó, hỗn hợp được làm ấm tới nhiệt độ trong phòng và được khuấy qua đêm. Hỗn hợp thu được sau đó được rót vào nước lạnh và được chiết bằng emtylen clorua. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất (H-84) (3,7 g, mp 127-130°C).

[Công thức hóa học 32]



Nước (2 ml), xesi cacbonat (0,88 g), axit phenyl boronic (0,098 g) và tetrakis(triphenyl phosphin)paladi (0) (0,078 g) được bổ sung vào dung dịch THF (4 ml) của hợp chất (H-84) (0,4 g) trong môi trường nitơ. Hỗn hợp thu được sau đó được gia nhiệt tới 80°C và được khuấy qua đêm. Hỗn hợp sau đó được làm nguội tới nhiệt độ trong phòng, được rót vào nước, và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ được rửa bằng nước, được làm khô bằng magie sulfat khan, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được hợp chất đích (hợp chất số (H-85)) (0,2 g, dầu nhớt).

Hợp chất amin vòng theo sáng chế, có thể được điều chế bởi phương pháp điều chế nêu trên được thể hiện trong các bảng 1-5.

Ngoài ra, $(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, và $Cy^2-(R^{20})_p$ trong bảng 1 biểu thị phần tử thể của hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (Ig).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, và $Cy^2-(R^{20})_p$ trong bảng 2 biểu thị phần tử thể của hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (Ih).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , và $(R^{20})_p$ trong bảng 3 biểu thị phần tử thể của hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (Ii).

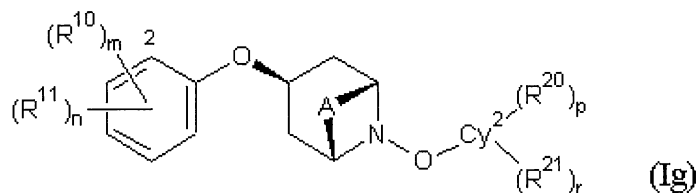
$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , và $(R^{20})_p$ trong bảng 4 biểu thị phần tử thể của hợp chất vòng được biểu thị bằng công thức (Ij).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , và $(R^{20})_p$ trong bảng 5 biểu thị phần tử thể của hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (Ik).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , và $(R^{20})_p$ trong bảng 6 biểu thị phần tử thể của hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (Il).

Ngoài ra, trong các bảng 1-6, các giá trị bằng số được ghi trước phần tử thể biểu thị vị trí thế. Ngoài ra, Et biểu thị nhóm etyl, Me biểu thị nhóm metyl, ⁿBu biểu thị nhóm n-butyl, ⁱBu biểu thị nhóm i-butyl, ^sBu biểu thị nhóm s-butyl, ^tBu biểu thị nhóm t-butyl, ⁿPen biểu thị nhóm n-pentyl, ⁿHex biểu thị nhóm n-hexyl, [°]Pr biểu thị nhóm xyclopropyl, [°]Bu biểu thị nhóm xyclobutyl, [°]Pen biểu thị nhóm xyclopentyl, [°]Hex biểu thị nhóm xyclohexyl.

[Công thức hóa học 33]



[Bảng 1]

Bảng 1

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_q$
H-1	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-2	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-3	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-4	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-5	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-6	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-7	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-8	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-9	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-10	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-11	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-12	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-13	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-14	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-15	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-16	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-17	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-18	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-19	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-20	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-21	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-22	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-23	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-24	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-25	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-

[Bảng 2]

Bảng 1 (tiếp)

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_r$
H-26	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-27	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-28	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
H-29	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-30	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-31	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-32	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
H-33	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-34	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-35	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-36	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
H-37	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-38	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-39	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-40	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
H-41	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-pyridin-2-yl	-
H-42	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-43	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-44	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-pyridin-2-yl	-
H-45	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-pyridin-2-yl	-
H-46	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-pyridin-2-yl	-
H-47	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-
H-48	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-
H-49	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-
H-50	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-

[Bảng 3]

Bảng 1 (tiếp)

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_r$
H-51	2-(OCH ₂ OMe)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-52	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-
H-53	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-54	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-55	2-([1,3]Dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-56	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-57	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-58	2-(CH ₂ OE ^t)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-59	2-(NH ⁱ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-60	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-61	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-62	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-63	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-64	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-65	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-66	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-67	2-(OCH ₂ CH=CCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-68	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-69	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-70	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-71	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-72	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-73	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-74	2-(CO ₂ E ^t)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-75	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -6-Cl-pyridin-2-yl	-

[Bảng 4]

Bảng 1 (tiếp)

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_r$
H-76	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	3-CF ₃ -6-Cl-pyridin-2-yl	–
H-77	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-78	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ⁱ Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-79	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-80	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-81	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-82	2-(O ⁱ Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-83	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-84	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-85	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-86	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-87	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-88	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-89	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-90	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₈	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–
H-91	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	–

[Bảng 5]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-92	2-(OCH ₃), 3- ⁿ Pr	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-93	2-(OCH(CH ₃)CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-94	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-95	2- ⁱ Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-96	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-97	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-98	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-99	2-(CO ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-100	2-(OCH ₂ OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-101	2-(OCH ₂ CH(O CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-102	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-103	2-(OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-104	2-(OCH ₂ -(pyridin -3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-105	2-(OCH ₂ - [tetrahydrofuran -2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-106	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-107	2-(OCH ₂ CON(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-108	2-(OC ₂ H ₄ NO ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-109	2-(OC ₂ H ₄ Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-110	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-111	2-(SCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-112	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 6]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-113	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-114	2-(OPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-115	2-(O-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-116	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-117	2-(N(CH ₃) ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-118	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-119	2-(NHCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-120	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-121	2-(NHSO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-122	2-(NHSO ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-123	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-124	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-125	2-(SPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-126	2-(S-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-127	2-(CS ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-128	2-(CO(S ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-129	2-(CS(O ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-130	2-(CS ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-131	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-132	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-133	2-(OCH ₂ CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-134	2-(OCH ₂ CH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-135	2-(OCH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-136	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-137	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 7]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-138	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-139	2-(CH ₂ OCH ₂ O ^C Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-140	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-141	2-(CH ₂ OCH ₂ CH (OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-142	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-143	2-(CH ₂ OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-144	2-(CH ₂ OCH ₂ -(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-145	2-(CH ₂ OCH ₂ - [tetrahydrofuran -2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-146	2-(CH ₂ SCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-147	2-(CH ₂ SCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-148	2-(CH ₂ SCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-149	2-(CH ₂ SCH ₂ O ^C Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-150	2-(CH ₂ SCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-151	2-(CH ₂ SCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-152	2-(CH ₂ SCH ₂ -(pyridin -3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-153	2-(CH ₂ SCH ₂ - [tetrahydrofuran -2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 8]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-154	2-(CO ₂ CH ₂ [tetrahydrofuran -2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-155	2-(Spiro[2,2]pent -1-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	
H-156	2-(1-CH ₃ -spiro[2,2] pent-1-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	
H-157	2-(1-HOCH ₂ -spiro [2,2]pent-1-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	
H-158	2-(Spiro[2,2]pent-1 -yloxy)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-159	2-(Spiro[2,2]pent -1-ylmetoxy)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-160	2-(2-°Pr-°Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-161	2-(2-°Pr-°PrO)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-162	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-163	2-(OCH ₂ °Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-164	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-165	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-166	2-(O°Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-167	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-168	2-(OCH ₂ °Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-169	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 9]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-170	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-171	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-172	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-173	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-174	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-175	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-176	2-(O ⁿ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-177	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-178	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-179	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-180	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-181	2-(O ⁿ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -pyridin-2-yl	-
H-182	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-183	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-184	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-185	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-186	2-(O ⁿ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-187	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-pyridin-2-yl	-
H-188	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-pyridin-2-yl	-
H-189	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-pyridin-2-yl	-
H-190	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-pyridin-2-yl	-

[Bảng 10]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-191	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-pyridin-2-yl	-
H-192	2- ⁿ Bu	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-193	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-194	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-195	2-(CH ₂ OEt)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-196	2-(OEt)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-197	2-(O ⁿ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-198	2-(O ⁱ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-199	2-(O ⁿ Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-200	2-(O ^s Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-201	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-202	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-203	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-204	2-(OCH ₂ CN)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-205	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-206	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) CH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-207	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-208	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-209	2-(OCH ₂ Ac)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-210	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-211	2-(OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-212	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 11]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-213	2-(OAc)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-214	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-215	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-216	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-217	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-218	2-(CO ₂ Et)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-219	2-(S ⁿ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-220	2-([1,3]dioxolan -2-yl)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-221	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CH(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-222	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CH(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-223	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-224	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-225	2-(O ⁿ Pr)	4-C(CF ₃) ₂ OCH ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-226	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-227	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-228	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-229	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-230	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-231	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-232	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-233	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-234	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-235	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 12]

Bảng 1(tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-236	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-237	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-238	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-239	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-240	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-241	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-242	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-243	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-244	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-245	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-246	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-247	2-(OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-248	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-249	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-250	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-251	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-252	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-253	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-254	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-255	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-256	2-(S ^r Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 13]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-257	2-([1,3]dioxolan -2-yl)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-258	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-259	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-260	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-261	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-262	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-263	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-264	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-265	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-266	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-267	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-268	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-269	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-270	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-271	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-272	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-273	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-274	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-275	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-276	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-277	2-(OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 14]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-278	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-279	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-280	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-281	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-282	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-283	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-284	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-285	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-286	2-([1,3]dioxolan -2-yl)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-287	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-288	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-289	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-290	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-291	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-292	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-293	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-294	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-295	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-296	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-297	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-298	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-299	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-300	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-301	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 15]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-302	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-303	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-304	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-305	2-(OCH(CH ₃)O CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-306	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-307	2-(OCH ₂ CH= CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-308	2-(OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-309	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-310	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-311	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-312	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-313	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-314	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-315	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-316	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-317	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-318	2-([1,3]dioxolan -2-yl)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-319	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-320	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 16]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-321	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-322	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-323	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-324	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-325	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-326	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-327	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-328	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-329	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-330	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-331	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-332	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-333	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-334	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-335	2-(OCH(CH ₃)O CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-336	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-337	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-338	2-(OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-339	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-340	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-341	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 17]

Bảng 1 (tiếp)

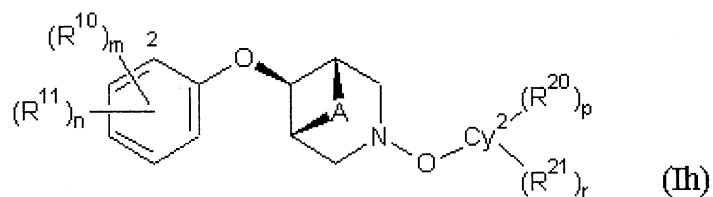
Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-342	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-343	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-344	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-345	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-346	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-347	2-([1,3]dioxolan -2-yl)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-348	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-349	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-350	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-351	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-352	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-353	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-354	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-355	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-356	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-357	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-358	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-359	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-360	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-361	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-362	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-363	2-(OCH ₂ CH(OH) CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 18]

Bảng 1 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-364	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-365	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-366	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-367	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-368	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-369	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-370	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-371	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-372	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-373	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-374	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-375	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-376	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-377	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-378	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
H-379	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Công thức hóa học 34]



[Bảng 19]

Bảng 2

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_r$
J-21	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-22	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-23	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-24	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-25	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-26	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-27	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-28	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-29	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-30	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-31	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-32	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-33	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-34	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-35	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-36	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-37	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-38	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-39	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-40	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-41	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-42	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-43	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-44	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-45	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-

[Bảng 20]

Bảng 2 (tiếp)

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_k$	$(R^{21})_r$
J-46	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-47	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-48	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -pyridazin-3-yl	-
J-49	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-50	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-51	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-52	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyrimidin-2-yl	-
J-53	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-54	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-55	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-56	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -thiazol-2-yl	-
J-57	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-58	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-59	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-
J-60	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ - [1,3,4]thiadiazol-2-yl	-

[Bảng 21]

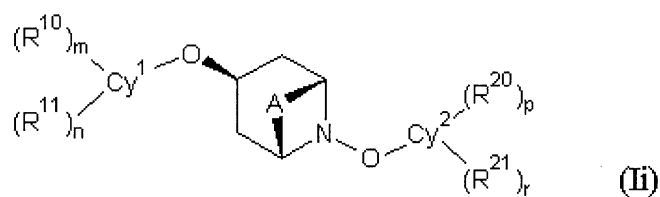
Bảng 2 (tiếp)					
Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
J-61	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-62	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-pyridin-2-yl	-
J-63	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-64	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-65	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-66	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-pyridazin-3-yl	-
J-67	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-68	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-69	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-70	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-71	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-72	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-73	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-74	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-75	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-76	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-77	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-78	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-79	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-80	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-81	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-82	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-83	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-84	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-85	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-86	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-87	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Bảng 22]

Bảng 2 (tiếp)

J-88	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-89	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-90	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-91	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-92	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-93	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-94	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-95	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-96	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-97	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-98	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-99	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-100	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-101	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₈	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-
J-102	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	-

[Công thức hóa học 35]



[Bảng 23]

Bảng 3

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-5	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-6	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-7	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-8	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-9	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-10	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-11	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-12	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-18	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-19	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-20	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-21	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-22	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-23	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-24	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-25	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-30	pyridin-2-yl	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-31	pyridin-2-yl	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-32	pyridin-2-yl	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-33	pyridin-2-yl	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-34	pyridin-2-yl	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-35	pyridin-2-yl	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
K-36	pyridin-2-yl	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-37	pyridin-2-yl	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃

[Bảng 24]

Bảng 3 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-38	pyridin-3-yl	2-(O ⁿ Pr)	6-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-39	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-40	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ ⁱ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-41	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ ^c Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-42	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-43	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-44	pyrazol-5-yl	1-(CH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-45	pyrazol-5-yl	1-(CO ₂ ⁱ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-46	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-47	pyrazol-5-yl	1-([1,3]dioxolan-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-48	pyrazol-5-yl	2-(CH ₂ ⁱ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-49	pyrazol-5-yl	2-(CH ₂ ^c Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-50	pyrazol-5-yl	2- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-51	pyrazol-5-yl	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-52	pyrazol-5-yl	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-53	pyrazol-5-yl	2-(CH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-54	pyrazol-5-yl	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-55	pyrazol-5-yl	2-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-56	pyrazol-5-yl	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-57	pyrazol-5-yl	1,3-(CH ₃) ₂	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-58	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-CH ₃	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-59	pyrazol-5-yl	1-CH ₃	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-60	pyrazol-5-yl	1-Et	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-61	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-62	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 25]

Bảng 3 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _p	(R ²⁰) _p
K-63	pyrazol-5-yl	1-"Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-64	pyrazol-5-yl	1-"iPr	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-65	pyrazol-5-yl	1-"Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-66	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-67	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-68	pyrazol-5-yl	1-((CH ₂) ₃ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-69	pyrazol-5-yl	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-70	pyrazol-5-yl	1-(2-Cl-Bn)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-71	pyrazol-5-yl	1-Ph	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-72	pyrazol-5-yl	1-(3-Cl-Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-73	pyrazol-5-yl	1-(3,5-Cl ₂ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-74	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-75	pyrazol-5-yl	1-"Bu	3-CF ₃ 4-Cl	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-76	pyrazol-5-yl	1-"Bu	3-CF ₃ 4-Br	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-77	pyrazol-5-yl	1-"Bu-4-Ph	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-78	pyrazol-5-yl	1-CH ₃ -4-(CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-79	pyrazol-5-yl	1-CH ₃ -4-(CH=NOCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-80	pyrazol-5-yl	1-"Bu-4-(CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-81	pyrazol-5-yl	1-"Bu-3-Ph	–	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-82	pyrazol-5-yl	1-"Bu-3-(3-Cl-Ph)	–	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-83	pyrazol-5-yl	1-"Bu-3-(4-Cl-Ph)	–	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-84	pyrazol-5-yl	1-"Bu-3-(3,4-Cl ₂ -Ph)	–	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃
K-85	pyrazol-5-yl	1-"Bu-3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	–	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃

[Bảng 26]

Bảng 3 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-86	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CN
K-87	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	5-NO ₂	-
K-88	pyrazol-5-yl	1-(3-CF ₃ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-89	pyrazol-5-yl	1-(3-CH ₃ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-90	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl) 3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-91	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl) 3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-92	pyrazol-5-yl	1-(3-Cl-Py-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-93	pyrazol-5-yl	1-(6-CH ₃ -Py-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-94	pyrazol-5-yl	1-(4-CF ₃ -thiazol-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-95	pyrazol-5-yl	1,4-(CH ₃) ₂	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-96	pyrazol-5-yl	1-CH ₃ -4-(CH ₂ OH)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-97	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-4-CH ₃	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-98	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu 3-(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-99	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-100	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-101	pyrazol-5-yl	1,4-(CH ₃) ₂ -3-(CO ₂ Et)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-102	pyrazol-5-yl	1-CH ₃	4-Cl 3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-103	pyrazol-5-yl	-	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-104	pyrazol-5-yl	1-(C(=O) ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-105	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl) 3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-106	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 27]

Bảng 3 (tiếp)

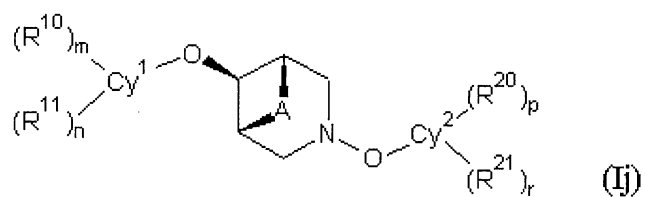
Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-107	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-108	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-109	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-110	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-111	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-112	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-113	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-yl))	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-114	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ (tetrahydro-furan-2-yl))	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-115	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-yl))	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-116	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ ([1,3]dioxan-2-yl))	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-117	pyrazol-5-yl	1-Ac	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-118	pyrazol-5-yl	1-(C(=O)Et)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-119	pyrazol-5-yl	1-(C(=O) ⁿ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-120	pyrazol-5-yl	1-(C(=O) ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-121	pyrazol-5-yl	1-(C(=O)Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-122	pyrazol-5-yl	1-(CO ₂ CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-123	pyrazol-5-yl	1-(CO ₂ Et)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-124	pyrazol-5-yl	1-(CO ₂ ⁿ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-125	pyrazol-5-yl	1-(CO ₂ ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-126	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-127	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 28]

Bảng 3 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²³) _p
K-128	pyrazol-5-yl	1-CH ₃ -4-(CH=NOH)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-129	pyrazol-5-yl	1-CH ₃ -4-(CH=NOEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-130	pyrazol-5-yl	3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-131	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)-3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-132	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ [[1,3]dioxolan-2-yl))-3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-133	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl)-3-(thiophen-2-yl)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-134	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-135	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(Et) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
K-136	pyrazol-5-yl	1-Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Công thức hóa học 36]



[Bảng 29]

Bảng 4

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-5	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₅	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-6	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
L-7	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-8	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-9	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-10	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
L-11	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-12	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-18	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-19	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
L-20	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-21	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₅	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-22	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
L-23	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
L-24	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-25	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃

[Bảng 30]

Bảng 4 (tiếp)

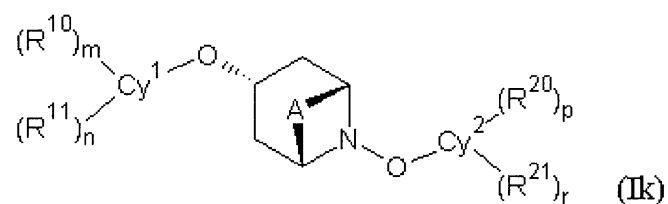
Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-26	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃
L-27	pyridin-2-yl	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-28	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OEt)	4-CF ₃
L-29	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-30	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃
L-31	pyridazin-3-yl	-	6-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-32	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-OH	4-CF ₃
L-33	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃
L-34	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃
L-35	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-36	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃
L-37	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃
L-38	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-39	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-40	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃
L-41	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-42	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃
L-43	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃
L-44	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃
L-45	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃
L-46	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃
L-47	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃
L-48	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃
L-49	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃
L-50	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃

[Bảng 31]

Bảng 4 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-51	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃
L-52	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃
L-53	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OAc)	4-CF ₃
L-54	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^c Pr])	4-CF ₃
L-55	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃
L-56	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃
L-57	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-58	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃
L-59	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-60	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃
L-61	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-Ph	4-CF ₃
L-62	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃
L-63	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-64	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃
L-65	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl
L-66	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₄ H ₈	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-67	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl

[Công thức hóa học 37]



[Bảng 32]

Bảng 5

S ^o	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-5	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-6	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-8	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-9	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-10	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-11	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-12	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-17	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-18	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-19	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-20	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-21	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-22	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-23	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃
M-24	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃

[Bảng 33]

Bảng 5 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-25	Ph	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-26	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CN
M-27	Ph	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-28	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-29	Ph	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-30	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridazin-3-yl	-	6-CN
M-31	Ph	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-32	Ph	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-33	Ph	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-34	Ph	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-35	Ph	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-36	Ph	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-37	Ph	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-38	Ph	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-39	Ph	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-40	Ph	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-41	Ph	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 34]

Bảng 5 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-42	Ph	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-43	Ph	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-44	Ph	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-45	Ph	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-46	Ph	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-47	Ph	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-48	Ph	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-49	Ph	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-50	Ph	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-51	Ph	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-52	Ph	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-53	Ph	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-54	Ph	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-55	Ph	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-56	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-57	Ph	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-58	Ph	2-(OCONH ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 35]

Bảng 5 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-59	Ph	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-60	Ph	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-61	Ph	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-62	Ph	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-63	Ph	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-64	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-65	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₈	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-66	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-67	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-68	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-69	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-70	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-71	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-72	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-73	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-74	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-75	Pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃

[Bảng 36]

Bảng 5 (tiếp)

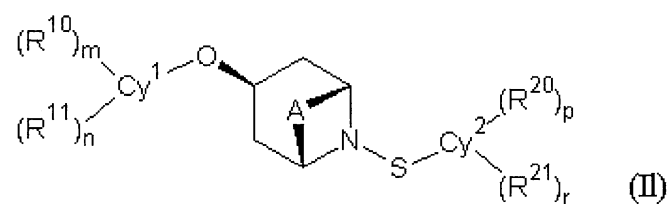
Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-76	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-77	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-78	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-79	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-80	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-81	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-82	Pyridazin -3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-83	Pyrazol-5 -yl	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-84	pyrazol-5 -yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-85	pyrazol-5 -yl	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-86	pyrazol-5 -yl	1- ⁿ Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-87	pyrazol-5 -yl	1- ⁱ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-88	pyrazol-5 -yl	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-89	pyrazol-5 -yl	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-90	pyrazol-5 -yl	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃
M-91	pyrazol-5 -yl	1-(Py ² -yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2 -yl	-	5-CF ₃

[Bảng 37]

Bảng 5 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-92	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-93	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-94	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu-3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-95	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-96	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-97	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-98	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-99	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-100	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-101	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-102	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-yl))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
M-103	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂) -3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Công thức hóa học 38]



[Bảng 38]

Bảng 6

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-1	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-2	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-3	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-4	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-5	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-6	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-8	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridin-2-yl	-	5-OF ₃
N-9	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-10	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-11	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-12	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	C ₃ H ₅	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-13	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-14	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃
N-15	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-OF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	-	6-OF ₃

[Bảng 39]

Bảng 6 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _l	(R ²⁰) _p
N-16	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃
N-17	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-18	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
N-19	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ COH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-20	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-21	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-22	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
N-23	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ COH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-24	pyridin-2-yl	–	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-25	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-26	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃
N-27	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ COH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-28	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-29	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-30	pyridazin-3-yl	–	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃

[Bảng 40]

Bảng 6 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²²) _p
N-31	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-32	pyridazin-3-yl	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
N-33	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-34	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-35	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-36	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-37	pyrazol-5-yl	1- ⁱ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-38	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-39	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-40	pyrazol-5-yl	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-41	pyrazol-5-yl	1-(Py-2-yl)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-42	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu 3-(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-43	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu 3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-44	pyrazol-5-yl	1- ⁿ Bu 3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-45	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

[Bảng 41]

Bảng 6 (tiếp)

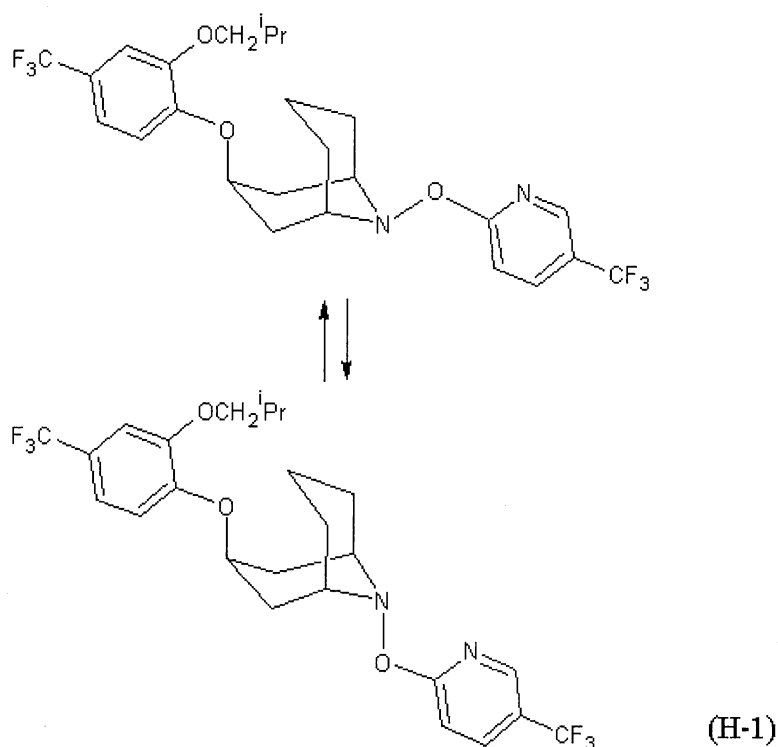
Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _p	(R ²²) _q
N-46	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-47	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-48	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-49	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-50	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-51	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-52	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ [[1,3]dioxolan-2-yl])	3-CF ₃	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃
N-53	pyrazol-5-yl	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂) 3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃

Các hằng số vật lý của một số hợp chất thể hiện trong Bảng 1-6 được biểu thị dưới đây. Ngoài ra, "vis" nghĩa là "dầu nhớt".

Hợp chất H-1: vis; ¹H-NMR(CDCl₃, δ ppm, nhiệt độ xác định 25 °C) 8,49(s, 1H), 7,90-7,86(m, 1H), 7,39(d, 0,8H), 7,26(d, 0,2H), 7,15(d, 1H), 7,08(s, 1H), 6,91(d, 1H), 4,91-4,89(m, 0,8H), 4,65(m, 0,2H), 3,78(d, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,76-2,30(m, 3H), 2,16-2,04(m, 3H), 1,83-1,67(m, 4H), 1,41-1,37(m, 1H), 1,07(giống như d, 6H)

Ngoài ra, theo ước tính, hợp chất H-1 là hỗn hợp của hai hợp chất, mà là các chất đồng phân cấu hình và được biểu thị bằng các công thức sau. Một trong hai hợp chất này là hợp chất trong đó khoảng cách giữa vị trí 7 của metylen và vị trí 9 của pyridyloxy trên vòng 9-azabixyclo[3,3,1]nonan là nhỏ hơn, và hợp chất còn lại là hợp chất trong đó khoảng cách giữa vị trí 7 của metylen và vị trí 9 của pyridyl oxyl trên vòng 9-azabixyclo[3,3,1]nonan là lớn hơn.

[Công thức hóa học 39]



Hợp chất H-2: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định } 20,2^\circ\text{C})$
 8,49(s,1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,08(s, 1H), 6,95(d, 1H),
 5,00-4,92(m, 0,8H), 4,67(m, 0,2H), 3,87(d, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,75-2,41(m, 3H),
 2,14-2,05(m, 2H), 1,83-1,71(m, 3H), 1,43-1,24(m, 3H), 0,66-0,60(m, 2H),
 0,39-0,35(m, 2H)

Hợp chất H-5: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,7^\circ\text{C})$
 7,77(d, 1H), 7,68(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,08(s, 1H), 6,91(d, 1H), 4,95-4,90(m,
 0,7H), 4,63(m, 0,3H), 3,78(d, 2H), 3,62(brs, 2H), 2,80-2,43(m, 2H), 2,19-2,03(m,
 2H), 1,85-1,75(m, 2H), 1,41-1,37(m, 1H), 1,05(d, 6H)

Hợp chất H-41: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 20,7^\circ\text{C})$
 8,53(d,1H), 7,90(dd, 1H), 7,40(d, 1H), 7,16(d, 1H), 7,08(s, 1H), 6,90(s, 1H),
 4,90-4,85(m, 0,7H), 4,60(m, 0,3H), 3,78(d, 2H), 3,58(brs, 2H), 2,74-2,40(m, 3H),
 2,18-2,05(m, 3H), 1,82-1,72(m, 3H), 1,41-1,34(m, 2H), 1,06(d, 6H)

Hợp chất H-42: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,3^\circ\text{C})$
 8,49(s,1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,09(s, 1H), 6,95(d, 1H),

4,98-4,94(m, 0,8H), 4,60(m, 0,2H), 4,10(q, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,74-2,40(m, 3H),
2,11-2,05(m, 2H), 1,81-1,69(m, 3H), 1,49-1,37(m, 5H)

Hợp chất H-43: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
8,49(s,1H), 7,87(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,09(s, 1H), 6,92(d, 1H),
4,95-4,90(m, 0,9H), 4,60(m, 0,1H), 3,98(t, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,75-2,40(m, 3H),
2,14-2,04(m, 2H), 1,89-1,69(m, 6H), 1,41-1,36(m, 1H), 1,08(t, 3H)

Hợp chất K-8: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,0^\circ\text{C})$
8,44(d,1H), 8,04(d, 1H), 7,79-7,63(m, 3H), 6,81(d, 1H), 5,78(m, 0,7H), 5,50(m,
0,3H), 5,32-5,24(m, 1H), 3,57(brs, 2H), 2,78-2,68(m, 2H), 2,42-1,90(m, 4H),
1,77-1,60(m, 2H), 1,45-1,26(m, 8H)

Hợp chất K-12: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 20,8^\circ\text{C})$
8,43(s,1H), 8,07(d, 1H), 7,76(dd, 1H), 7,68(d, 1H), 7,26(s, 1H), 6,84(d, 1H),
5,69-5,64(m, 0,7H), 5,51(m, 0,3H), 5,33-5,24(m, 1H), 4,47(d, 0,5H), 4,00(dd,
3,5H), 3,54-3,27(d, d, d, 2H), 2,85-2,68(m, 2H), 2,27(d, 0,3H), 1,91(d, 1,7H),
1,41(d, 6H)

Hợp chất H-51: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,2^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,40-7,35(d,d, tổng 2H), 7,26(s, 1H), 6,98(d, 1H),
5,22(s, 2H), 5,06-5,01(m, 1H), 3,62(brs, 2H), 3,53(s, 3H), 2,75-2,65(m, 2H),
2,50-2,39(m, 1H), 2,14-2,04(m, 2H), 1,79-1,67(m, 3H), 1,45-1,33(m, 2H)

Hợp chất H-52: nhiệt độ tan chảy [107-110°C]

Hợp chất H-53: nhiệt độ tan chảy [141-144°C]

Hợp chất H-54: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,17(d, H), 7,08(s, 1H), 6,92(d, 1H),
4,93-4,91(m, 1H), 4,01(t, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,74-2,40(m, 3H), 2,14-2,05(m,
2H), 1,86-1,74(m, 5H), 1,70-1,49(m, 2H), 1,41-1,39(m, 2H), 1,01(t, 3H)

Hợp chất H-55: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,80(s, 1H), 7,58(d, 1H), 7,36(d, 1H), 6,99(d, 1H),
 6,16(s, 1H), 5,12-5,09(m, 1H), 4,19-4,01(m, 4H), 3,64(brs, 2H), 2,77-2,03(m,
 3H), 1,80-1,66(m, 3H), 1,47-1,35(m, 2H)

Hợp chất H-56: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,1^\circ\text{C})$
 8,51(s, 1H), 7,89(dd, 1H), 7,71(s, 1H), 7,49(d, 1H), 7,38(d, 1H), 6,92(d, 1H),
 5,08-5,04(m, 1H), 4,57(s, 2H), 3,77-3,67(m, brs, tổng 3H), 2,79-2,69(m, 2H),
 2,44-2,02(m, 3H), 1,80-1,59(m, 3H), 1,48-1,44(m, 2H), 1,25(d, 6H)

Hợp chất H-57: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,66(s, 1H), 7,51(d, 1H), 7,39(d, 1H), 6,93(d, 1H),
 5,07-5,03(m, 1H), 4,52(s, 2H), 3,65(brs, 2H), 3,50(s, 3H), 2,79-2,68(m, 2H),
 2,40-2,02(m, 3H), 1,80-1,61(m, 3H), 1,40-1,30(m, 2H)

Hợp chất H-58: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(d, 1H), 7,69(s, 1H), 7,50(d, 1H), 7,38(d, 1H), 6,93(d, 1H),
 5,04(m, 1H), 4,57(s, 2H), 3,66-3,58(brs, q, tổng 4H), 2,78-2,68(m, 2H),
 2,40-2,04(m, 3H), 1,79-1,60(m, 3H), 1,40-1,33(m, 2H), 1,26(t, 3H)

Hợp chất H-59: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,36(s, 1H), 6,87(d, 1H), 6,78(s, 1H), 6,74(d, 1H),
 5,05-5,01(m, 1H), 4,41(brt, 1H), 3,64(brs, 2H), 2,98(t, 2H), 2,80-2,70(m, 2H),
 2,44-1,90(m, 4H), 1,80-1,65(m, 3H), 1,49-1,43(m, 2H), 1,01(d, 6H)

Hợp chất H-60: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,2^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,18(d, 1H), 7,13(s, 1H), 6,94(d, 1H),
 4,97-4,92(m, 1H), 4,59-4,50(m, 1H), 3,59(brs, 2H), 2,74-2,41(m, 3H),
 2,14-2,05(m, 2H), 1,81-1,69(m, 3H), 1,42-1,35(m,d, tổng 8H)

Hợp chất H-61: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,7^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,16(d, 1H), 7,10(d, 1H), 6,93(d, 1H),

4,95-4,91(m, 1H), 4,36-4,30(m, 1H), 3,58(brs, 2H), 2,74-2,40(m, 3H),
2,13-2,04(m, 2H), 1,81-1,56(m, 5H), 1,41-1,33(m, 2H), 1,31(d, 3H), 1,00(t, 3H)

Hợp chất H-62: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,6^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,48(d, 1H), 7,40(d, 1H), 7,36(s, 1H), 7,06(d, 1H),
5,09-5,06(m, 1H), 5,01-4,93(m, 1H), 3,62(brs, 2H), 2,76-2,66(m, 2H),
2,40-2,05(m, 3H), 1,77-1,61(m, 3H), 1,38(d, 6H), 1,45-1,33(m, 2H)

Hợp chất H-63: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 19,7^\circ\text{C})$
8,50(s, 1H), 7,89(d, 1H), 7,46(d, 1H), 7,41-7,38(d, s, tổng 2H), 7,19-7,02(m, 1H),
5,11-5,04(m, 1H), 4,45(d, 1H), 3,63(brs, 2H), 2,76-2,66(m, 2H), 2,44-2,20(m,
1H), 2,11-2,05(m, 2H), 1,80-1,63(m, 3H), 1,49-1,44(m, 2H)

Hợp chất H-64: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,2^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,20(d, 1H), 7,10(s, 1H), 6,96(d, 1H),
6,11-6,02(m, 1H), 5,49-5,28(m, 2H), 5,00-4,99(m, 1H), 4,60(d, 2H), 3,61(brs,
2H), 2,75-2,30(m, 3H), 1,82-1,69(m, 3H), 1,45-1,35(m, 2H)

Hợp chất H-65: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,0^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,87(d, 1H), 7,38(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,10(s, 1H), 6,96(d, 1H),
5,47(t, 2H), 5,01-4,95(m, 1H), 4,58(d, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,73-2,40(m, 3H),
2,14-2,02(m, 2H), 1,77(d, 6H), 1,79-1,68(m, 3H), 1,41-1,37(m, 2H)

Hợp chất H-66: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,7^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,16(d, 1H), 7,07(s, 1H), 6,88(d, 1H),
4,87-4,82(m, 1H), 3,65(s, 2H), 3,58(brs, 2H), 2,78-2,63(m, 2H), 2,50-2,41(m,
1H), 2,17-2,05(m, 2H), 1,82-1,71(m, 3H), 1,43-1,36(m, 2H), 1,08(s, 9H)

Hợp chất H-67: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,7^\circ\text{C})$
8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,24(d, 1H), 7,11(s, 1H), 6,97(d, 1H),
6,18(t, 1H), 5,08-5,00(m, 1H), 4,72(d, 2H), 3,62(brs, 2H), 2,74-2,64(m, 2H),
2,49-2,36(m, 1H), 2,15-2,04(m, 2H), 1,80-1,66(m, 3H), 1,45-1,33(m, 2H)

Hợp chất H-68: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,7^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,27-7,25(d, s, tổng 2H), 6,98(d, 1H),
 5,09-5,01(m, 1H), 4,77(s, 2H), 3,63(brs, 2H), 2,74-2,59(m, 2H), 2,54(s, 1H),
 2,53-2,35(m, 1H), 2,13-2,01(m, 2H), 1,81-1,67(m, 3H), 1,45-1,33(m, 2H)

Hợp chất H-69: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,9^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,10(s, 1H), 6,93(d, 1H),
 5,14(s, 1H), 5,00(s, 1H), 4,98-4,93(m, 1H), 4,48(s, 2H), 3,59(brs, 2H),
 2,76-2,40(m, 3H), 2,15-2,03(m, 2H), 1,85(s, 3H), 1,80-1,70(m, 3H), 1,43-1,34(m,
 2H)

Hợp chất H-70: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,5^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,16(d, 1H), 7,07(s, 1H), 6,90(d, 1H),
 4,90-4,88(m, 1H), 3,89-3,77(m, 2H), 3,59(brs, 2H), 2,76-2,30(m, 3H),
 2,20-2,05(m, 2H), 1,92-1,55(m, 6H), 1,40-1,26(m, 2H), 1,06(d, 3H), 0,97(t, 3H)

Hợp chất H-71: vis; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,8^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,89(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,30(s, 1H), 7,06(d, 1H), 5,17-5,13(m,
 1H), 4,86(s, 2H), 3,68(brs, 2H), 2,77-2,66(m, 2H), 2,46-2,02(m, 3H),
 1,80-1,62(m, 3H), 1,50-1,45(m, 2H)

Hợp chất H-72: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,1^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,32(s, 1H), 7,25(d, 1H), 6,98(d, 1H),
 5,33(q, 1H), 5,04-5,02(m, 1H), 3,63(brs, 2H), 3,44(s, 3H), 2,76-2,65(m, 2H),
 2,50-2,40(m, 1H), 2,17-2,07(m, 2H), 1,80-1,68(m, 3H), 1,53(d, 3H), 1,50-1,30(m,
 2H)

Hợp chất H-73: nhiệt độ tan chảy $[87-89^\circ\text{C}]$

Hợp chất H-74: nhiệt độ tan chảy $[93-97^\circ\text{C}]$

Hợp chất H-75: nhiệt độ tan chảy $[102-105^\circ\text{C}]$

Hợp chất H-76: nhiệt độ tan chảy $[114-117^\circ\text{C}]$

Hợp chất H-77: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,48(d, 1H), 7,37(d, 1H), 7,32(s, 1H), 7,04(d, 1H),
 5,30-5,01(m, 1H), 3,62(brs, 2H), 2,77-2,67(m, 2H), 2,46-2,10(m, 3H), 2,26(s,
 3H), 1,77-1,41(m, 5H)

Hợp chất H-78: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,2^\circ\text{C})$
 8,48(s, 1H), 7,86(dd, 1H), 7,38-7,23(m, 8H), 6,97(d, 1H), 4,99-4,95(m, 1H),
 4,50(q, 1H), 4,37(d, 2H), 3,56(brs, 2H), 2,73(d, 1H), 2,73-2,64(m, 2H),
 2,54-2,47(m, 1H), 2,09-1,99(m, 2H), 1,74-1,68(m, 3H), 1,47-1,35(m, 2H)

Hợp chất H-79: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,8^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,28(d, 1H), 7,04(s, 1H), 6,98(d, 1H),
 5,07-5,04(m, 1H), 4,57(s, 2H), 3,60(brs, 2H), 2,78-2,35(m, 3H), 2,35(s, 3H),
 2,27-2,07(m, 2H), 1,79-1,61(m, 3H), 1,58-1,40(m, 2H)

Hợp chất H-80: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,4^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,21(d, 1H), 7,14(s, 1H), 6,97(d, 1H),
 5,14-5,10(m, 1H), 4,23-4,19(m, 1H), 4,09-4,03(m, 1H), 3,87-3,82(m, 1H),
 3,63(brs, 2H), 2,96(d, 1H), 2,75-2,41(m, 3H), 2,13-2,06(m, 2H), 1,79-1,60(m,
 3H), 1,4

Hợp chất H-81: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 22,0^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,18(d, 1H), 7,10(s, 1H), 6,92(d, 1H),
 4,95-4,93(m, 1H), 4,04-4,01(m, 1H), 3,94-3,89(m, 1H), 3,78-3,73(m, 1H),
 3,60(brs, 2H), 3,46(s, 3H), 2,76-2,50(m, 3H), 2,11-2,04(m, 2H), 1,80-1,68(m,
 3H), 1,4

Hợp chất H-82: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,7^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,15(d, 1H), 7,13(s, 1H), 6,92(d, 1H),
 4,90-4,84(m, 1H), 4,83-4,79(m, 1H), 3,58(brs, 2H), 2,74-2,60(m, 2H),
 2,41-2,08(m, 3H), 1,91-1,63(m, 11H), 1,38-1,34(m, 2H)

Hợp chất H-83: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,2^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,44(d, 1H), 7,38-7,36(m, 2H), 7,03(d, 1H), 5,07(m, 1H), 4,95(d, 1H), 3,92-3,86(m, 1H), 3,62(brs, 2H), 2,75-2,65(m, 2H), 2,44-2,01(m, 3H), 1,77-1,61(m, 3H), 1,43-1,34(m, 2H). 1,30(d, 6H)

Hợp chất H-84: nhiệt độ tan chảy [127-130 $^\circ\text{C}$]

Hợp chất H-85: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 23,3^\circ\text{C})$
 8,48(s, 1H), 7,86(dd, 1H), 7,58-7,52(m, 4H), 7,49-7,33(m, 4H), 7,03(d, 1H), 5,02(m, 1H), 3,53(brs, 2H), 2,71-2,61(m, 2H), 2,25-1,89(m, 3H), 1,62-1,51(m, 3H), 1,50-1,40(m, 2H).

Hợp chất H-86: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 23,1^\circ\text{C})$
 8,79(s, 1H), 8,59(t, 1H), 8,49(s, 1H), 7,89-7,81(m, 1H), 7,65-7,57(dd, s, tổng 2H), 7,38-7,34(m, 2H), 7,09(d, 1H), 5,11(m, 1H), 3,56(brs, 2H), 2,74-2,64(m, 2H), 2,25-1,90(m, 3H), 1,70-1,54(m, 3H), 1,26-1,00(m, 2H).

Hợp chất H-87: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 21,8^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,89(dd, 1H), 7,41-7,36(d, d, s, tổng 3H), 6,90(d, 1H), 5,07-5,05(m, 1H), 3,64(brs, 2H), 2,87(t, 2H), 2,75-2,68(m, 2H), 2,45-2,08(m, 3H), 1,83-1,42(m, 7H). 1,08(t, 3H)

Hợp chất H-88: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 22,0^\circ\text{C})$
 8,33(s, 1H), 7,74(dd, 1H), 7,58(d, 1H), 7,47(s, 1H), 7,32(d, 1H), 7,18(d, 1H), 5,80-5,66(m, 1H), 5,30-5,05(m, 3H), 3,68(brs, 2H), 2,97-2,85(m, 2H), 2,77-2,39(m, 2H), 2,39-2,00(m, 3H), 1,79-1,26(m, 5H)

Hợp chất H-89: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 23,5^\circ\text{C})$
 8,48(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,37(d, 1H), 6,91-6,83(m, 3H), 4,82-4,77(m, 1H), 3,94(t, 2H), 3,57(brs, 2H), 2,69-2,30(m, 3H), 2,12-2,04(m, 2H), 1,89-1,60(m, 5H), 1,41-1,32(m, 2H), 1,07(t, 3H)

Hợp chất H-90: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 20,8^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,91(dd, 1H), 7,48(d, 1H), 7,17(d, 1H), 7,08(s, 1H), 6,99(d, 1H),
 5,02-4,98(m, 1H), 3,98(t, 2H), 3,60-3,58(m, 2H), 2,58-2,49(m, 2H), 2,30-2,20(m,
 2H), 1,91-1,75(m, 7H), 1,07(t, 3H)

Hợp chất H-29: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 20,4^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,89(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,16(d, 1H), 7,09(s, 1H), 7,03(d, 1H),
 4,97-4,95(m, 1H), 3,97(q, 4H), 3,79(d, 2H), 3,58-3,33(ddd, 2H), 2,74-2,65(m,
 2H), 2,19-2,12(m, 1H), 1,98(brd, 2H), 1,06(d, 6H)

[0309]

Hợp chất J-42: nhiệt độ tan chảy [170-172°C]

Hợp chất K-38: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,5^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,88(dd, 1H), 7,39(d, 1H), 7,19(d, 1H), 7,07(d, 1H), 4,98-4,93(m,
 1H), 4,34(t, 2H), 3,60(brs, 2H), 2,75-2,30(m, 3H), 2,14-2,07(m, 2H),
 1,86-1,67(m, 5H), 1,44-1,38(m, 2H), 1,04(t, 3H)

Hợp chất K-39: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 22,3^\circ\text{C})$
 8,51(s, 1H), 7,90(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 5,78(s, 1H), 5,10-4,80(m, 1H), 4,00(t,
 2H), 3,66(brs, 2H), 2,75-1,20(m, 14H), 0,97(t, 3H)

Hợp chất N-1: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 20,8^\circ\text{C})$
 8,64(s,1H), 7,85-7,81(m,1H), 7,74-7,69(m, 1H), 7,17(d, 1H), 7,08(s,1H),
 6,92(d,1H), 4,69(m, 1H), 3,80(d,2H), 3,36(brs,2H), 2,61-2,56(m,2H),
 2,17-2,05(m, 3H), 1,91-1,86(m, 1H), 1,65-1,53(m, 3H), 1,27-1,26(m, 2H), 1,08(d,
 6H)

Hợp chất H-92: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm, nhiệt độ xác định: } 21,3^\circ\text{C})$
 8,50(s, 1H), 7,88(d, 1H), 7,37(d, 1H), 7,31(d, 1H), 6,84(d, 1H), 5,11-5,07(m,
 0,8H), 4,75(m, 0,2H), 3,88(s, 3H), 3,66(brs, 2H), 2,77-2,67(m, 4H), 2,50-2,25(m,
 1H), 2,13-2,04(m, 3H), 1,80—1,48(m, 6H), 1,02(t, 3H)

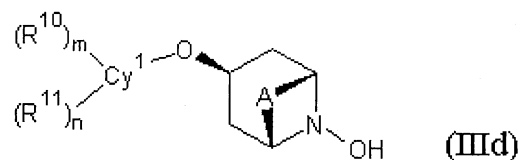
Hợp chất H-93: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định: } 20,2^\circ\text{C})$
 8,49(s, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,38(d, 1H), 7,05(d, 1H), 6,85(d, 1H), 5,20–4,80(m, 2H), 3,61(brs, 2H), 3,52-3,44(m, 1H), 3,01-2,90(m, 1H), 2,70-2,33(m, 3H), 2,10-2,01(m, 3H), 1,79-1,55(m, 4H), 1,48(d, 3H)

Tiếp theo, các ví dụ về hợp chất hydroxylamin thích hợp để dùng làm hợp chất trung gian để sản xuất hợp chất amin vòng theo sáng chế được thể hiện trong các bảng 15-20. Ngoài ra, các hợp chất hydroxylamin này là các chất được tạo thành ở bước trung gian của phương pháp tương tự với các phương pháp sản xuất được đề cập trong các ví dụ nêu trên.

Trong bảng 7, $(\text{R}^{10})_m$, $(\text{R}^{11})_n$ và A biểu thị phần tử thế trong hợp chất hydroxylamin được biểu thị bằng công thức (IIIId).

Trong bảng 8, $(\text{R}^{10})_m$, $(\text{R}^{11})_n$ và A biểu thị phần tử thế trong hợp chất hydroxylamin được biểu thị bằng công thức (IIIr).

[Công thức hóa học 40]



[Bảng 42]

Bảng 7

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-1	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-2	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-3	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-4	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-5	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-6	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-8	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-9	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-11	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆
e-12	pyridin-2-yl	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-13	Ph	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-14	Ph	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-15	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-16	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-17	pyridin-3-yl	2-(O ⁿ Pr)	6-CF ₃	C ₃ H ₆
e-18	pyrazol-5-yl	1-(ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 43]

Bảng 7 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-20	Ph	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-22	Ph	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-23	Ph	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-24	Ph	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-25	Ph	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-26	Ph	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-27	Ph	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-28	Ph	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-29	Ph	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-30	Ph	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-31	Ph	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-32	Ph	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-33	Ph	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-34	Ph	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-35	Ph	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-36	Ph	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-37	Ph	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-38	Ph	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-39	Ph	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-40	Ph	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-41	Ph	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-42	Ph	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-43	Ph	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-44	Ph	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^e Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-45	Ph	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-46	Ph	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-47	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 44]

Bảng 7 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-48	Ph	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-49	Ph	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-50	Ph	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-51	Ph	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-52	Ph	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-53	Ph	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-54	Ph	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-55	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆
e-56	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂
e-57	Ph	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-58	Ph	2- ⁱ Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-59	Ph	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-60	Ph	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-61	Ph	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-62	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-63	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-64	Ph	2-(OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-65	Ph	2-(OCH ₂ -(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-66	Ph	2-(OCH ₂ -[tetrahydrofuran-2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-67	Ph	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-68	Ph	2-(SCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-69	Ph	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-70	Ph	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-71	Ph	2-(OPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-72	Ph	2-(O-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-73	Ph	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-74	Ph	2-(N(CH ₃) ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 45]

Bảng 7 (tiếp)

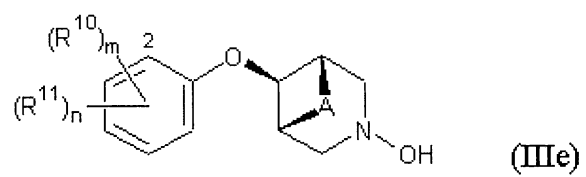
Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-75	Ph	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-76	Ph	2-(NHCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-77	Ph	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-78	Ph	2-(NHSO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-79	Ph	2-(NHSO ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-80	Ph	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-81	Ph	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-82	Ph	2-(SPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-83	Ph	2-(S-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-84	Ph	2-(CS ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-85	Ph	2-(CO(S ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-86	Ph	2-(CS(O ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-87	Ph	2-(CS ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-88	Ph	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-89	Ph	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-90	Ph	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-91	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-92	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-93	Ph	2-(OCH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-94	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-95	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-96	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-97	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-98	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-99	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-100	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-101	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 46]

Bảng 7 (tiếp)

Số	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-102	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ -(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-103	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ -[tetrahydrofuran-2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-104	Ph	3-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-105	Ph	3-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-106	Ph	3-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-107	Ph	3-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-108	Ph	3-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-109	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-110	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-111	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆
e-112	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-113	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆

[Công thức hóa học 41]



[Bảng 47]

Bảng 8

Số	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A
f-5	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅
f-6	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅
f-7	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅
f-8	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅
f-9	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-10	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-11	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-12	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂

[Bảng 48]

Bảng 8 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-13	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-14	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-15	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-16	2-([1,3]dioxolan-2-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-17	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-18	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-19	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-20	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-21	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-22	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-23	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-24	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-25	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-26	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-27	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-28	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-29	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-30	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-31	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-32	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-33	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-34	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-35	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-36	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-37	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-38	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 49]

Bảng 8 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-39	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-40	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-41	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-42	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-43	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-44	2-(pyridin-3-yl)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-45	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-46	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-47	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆
f-48	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂
f-49	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-50	2- ⁱ Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-51	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-52	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-53	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-54	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-55	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-56	2-(OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-57	2-(OCH ₂ -(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-58	2-(OCH ₂ -[tetrahydrofuran-2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-59	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-60	2-(SCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-61	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-62	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-63	2-(OPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 50]

Bảng 8 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-64	2-(O-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-65	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-66	2-(N(CH ₃) ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-67	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-68	2-(NHCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-69	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-70	2-(NHSO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-71	2-(NHSO ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-72	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-73	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-74	2-(SPh)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-75	2-(S-(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-76	2-(CS ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-77	2-(CO(S ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-78	2-(CS(O ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-79	2-(CS ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-80	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-81	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-82	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-83	2-(OCH ₂ CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-84	2-(OCH ₂ CH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-85	2-(OCH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-86	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-87	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-88	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-89	2-(CH ₂ OCH ₂ O ^C Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Bảng 51]

Bảng 8 (tiếp)

Số	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-90	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-91	2-(CH ₂ OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-92	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-93	2-(CH ₂ OCH ₂ Ph)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-94	2-(CH ₂ OCH ₂ -(pyridin-3-yl))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-95	2-(CH ₂ OCH ₂ -[tetrahydrofuran-2-yl])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-96	3-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-97	3-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-98	3-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-99	3-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-100	3-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-101	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-102	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-103	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆
f-104	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-105	2-(O ⁿ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆

Các hằng số vật lý của một số hợp chất trong bảng 7-8 được biểu thị dưới đây.

Hợp chất e-1: nhiệt độ tan chảy [112-115°C]

Hợp chất e-2: nhiệt độ tan chảy [118-123°C]

Hợp chất e-9: nhiệt độ tan chảy [94-100°C]

Hợp chất e-11: nhiệt độ tan chảy [105-110°C]

Hợp chất e-12: nhiệt độ tan chảy [110-113°C]

Hợp chất e-13: ¹H-NMR(CDCl₃, δ ppm, nhiệt độ xác định 20,2°C)
 8,02(s, 1H), 7,70(d, 1H), 7,05(d, 1H), 5,70-5,66(m, 1H), 3,96(s, 3H), 3,52(brs, 2H), 2,74-2,64(m, 2H), 2,37-2,34(m, 1H), 1,98-1,80(m, 2H), 1,71-1,34(m, 5H)

Hợp chất e-14: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định } 20,4^\circ\text{C})$
 7,34(s, 1H), 7,23(d, 1H), 6,95(d, 1H), 5,21(s, 2H), 5,08-5,00(m, 1H),
 3,56-3,51(brs, s, tổng 5H), 2,70-2,60(m, 2H), 2,38-2,26(m, 1H), 2,02-1,96(m,
 2H), 1,71-1,57(m, 3H), 1,40-1,33(m, 2H)

Hợp chất e-15: nhiệt độ tan chảy $[104-107^\circ\text{C}]$

Hợp chất e-16: nhiệt độ tan chảy $[112-115^\circ\text{C}]$

Hợp chất e-17: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định } 21,7^\circ\text{C})$
 7,17(d, 1H), 7,07(d, 1H), 5,01-4,97(m, 1H), 4,35(t, 2H), 3,47(brs, 2H),
 2,65-1,23(m, 12H), 1,03(t, 3H)

Hợp chất e-18: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm}, \text{nhiệt độ xác định } 22,6^\circ\text{C})$
 5,78(s, 1H), 5,30-4,90(m, 1H), 3,99(t, 2H), 3,50(brs, 2H), 2,66-2,29(m, 3H),
 1,96-1,15(m, 11H), 0,95(t, 3H)

Một số ví dụ về điều chế thuốc diệt ve bét theo sáng chế được nêu dưới đây. Tuy nhiên, các chất phụ gia và tỷ lệ bổ sung không bị giới hạn ở các ví dụ điều chế này, và có thể được cải biến trong khoảng rộng. Ngoài ra, thuật ngữ "phần" được sử dụng trong ví dụ điều chế biểu thị "phần khối lượng."

Ví dụ điều chế 1 bột thấm ướt

Hợp chất theo sáng chế	40 phần
Đất tảo cát	53 phần
Rượu sulfat béo	4 phần
Alkylnaphtalen sulfonat	3 phần

Các chất nêu trên được trộn đồng đều và được nghiền thành bột mịn để thu được bột thấm ướt bao gồm 40% hoạt chất.

Ví dụ điều chế 2 nhũ tương

Hợp chất theo sáng chế	30 phần
Xylen	33 phần

đimetylform amid 30 phần

Polyoxyetylen alkyl alyl ete 7 phần

Các chất nêu trên được trộn và được hòa tan để thu được nhũ tương bao gồm 30% hoạt chất.

Các ví dụ thử nghiệm sau chứng tỏ rằng hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế là hữu ích để làm hoạt chất của thuốc diệt ve bét.

Ví dụ thử nghiệm 1 Thử nghiệm công hiệu kháng *Tetranychus urticae*

Mười bảy ve bét *Tetranychus urticae* cái trưởng thành có khả năng kháng phospho hữu cơ được cấy lên trên những chiếc lá đầu tiên của cây đậu thận trồng trong chậu số 3 từ 7 đến 10 ngày sau khi nảy mầm. Tiếp theo, nhũ tương được điều chế có công thức được nêu trong Ví dụ điều chế 2 nêu trên. Nhũ tương này được pha loãng với nước đến nồng độ hợp chất bằng 125ppm, sau đó, các chất lỏng đã được pha loãng được phun lên trên cây đậu thận. Cây đậu thận sau đó được đặt trong phòng có nhiệt độ được kiểm soát ở mức 25°C và độ ẩm 65%. Tỷ lệ chết của côn trùng trưởng thành được nghiên cứu 3 ngày sau khi phun. Thử nghiệm được lặp lại hai lần.

Thử nghiệm nêu trên được tiến hành trên các nhũ tương lần lượt chứa hợp chất amin vòng là hợp chất số H-1, H-2, H-5, H-29, H-41, H-42, H-43, H-51, H-52, H-54, H-55, H-56, H-57, H-58, H-59, H-60, H-61, H-62, H-63, H-64, H-65, H-66, H-67, H-68, H-70, H-71, H-72, H-73, H-74, H-75, H-79, H-80, H-82, H-83, H-84, H-85, H-86, H-87, H-89, H-90, K-8, K-12, K-38, và K-39. Kết quả cho thấy đối với tất cả các hợp chất trong trường hợp pha loãng đến nồng độ bằng 125ppm, tỷ lệ chết của côn trùng là 80% hoặc cao hơn.

Ngoài ra, đối với hợp chất số H-81 trong trường hợp pha loãng đến nồng độ 31ppm, tỷ lệ chết của côn trùng cũng là 80% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 2 Thử nghiệm công hiệu kháng *Panonychus citri*

Mười ve bét *Panonychus citri* cái trưởng thành có khả năng kháng thuốc diệt ve bét được cấy lên trên lá quýt đặt trong đĩa Petri. Tiếp theo, nhũ tương được điều chế có công thức được nêu trong Ví dụ điều chế 2 nêu trên. Nhũ tương này được pha loãng với nước đến nồng độ hợp chất bằng 125ppm, sau đó, các chất lỏng đã được pha loãng được phun lên trên lá quýt bằng tháp phun dạng quay. Sau đó, lá quýt được đặt trong phòng có nhiệt độ được kiểm soát ở mức 25°C và độ ẩm 65%. Tỷ lệ chết của côn trùng trưởng thành được kiểm tra 3 ngày sau khi phun.

Thử nghiệm nêu trên được tiến hành trên nhũ tương lần lượt chứa hợp chất amin vòng là hợp chất số H-1, H-2, H-5, H-29, H-41, H-42, H-43, H-51, H-55, H-57, H-58, H-62, H-64, H-66, H-69, H-72, H-73, H-74, H-75, H-81, H-82, H-83, H-84, H-85, H-87, H-89, H-90, K-8, K-12, K-38 và K-39. Kết quả cho thấy đối với tất cả các hợp chất trong trường hợp pha loãng đến nồng độ bằng 125ppm, tỷ lệ chết của côn trùng là 80% hoặc cao hơn.

Ngoài ra, tỷ lệ chết của côn trùng đối với hợp chất số H-54, H-56, H-59, H-60, H-61, H-63, H-68, H-70, và H-80 trong trường hợp pha loãng đến nồng độ bằng 31ppm cũng bằng 80% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 3 Thử nghiệm hoạt tính diệt trứng đối với trứng của *Tetranychus urticae*

Ve bét *Tetranychus urticae* cái trưởng thành được cấy lên trên lá của cây đậu thận đặt trong đĩa Petri để ve bét có thể đẻ trứng trong 1 ngày. Tiếp theo, nhũ tương được điều chế có công thức được nêu trong Ví dụ điều chế 2 nêu trên. Nhũ tương này được pha loãng với nước đến nồng độ hợp chất bằng 125ppm, sau đó, chất lỏng đã được pha loãng được phun lên trên lá của cây đậu thận bằng tháp phun dạng quay. Lá của cây đậu thận sau đó được đặt trong phòng có nhiệt độ

được kiểm soát ở mức 25 °C và độ ẩm 65%. Tỷ lệ chết của trứng được tính toán bằng cách kiểm tra xem trứng đã được phun bằng nhũ tương có nở hay không.

Thử nghiệm nêu trên được tiến hành trên các nhũ tương chứa hợp chất amin vòng là hợp chất số: H-1, H-2, H-29, H-43, H-54, H-56, và H-73. Kết quả cho thấy đối với tất cả các hợp chất trong trường hợp pha loãng đến nồng độ bằng 125ppm, tỷ lệ chết của trứng là 80% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 4 Thử nghiệm hoạt tính diệt trứng đối với trứng của *Panonychus citri*

Ve bét *Panonychus citri* cái trưởng thành được cấy lên trên lá quýt được đặt trong đĩa Petri để ve bét có thể đẻ trứng trong 1 ngày. Tiếp theo, nhũ tương được điều chế có công thức được nêu trong Ví dụ điều chế 2 nêu trên. Nhũ tương này được pha loãng với nước đến nồng độ hợp chất bằng 125ppm, sau đó, chất lỏng đã được pha loãng được phun lên trên lá quýt bằng tháp phun dạng quay. Sau đó, lá quýt được đặt trong phòng có nhiệt độ được kiểm soát ở mức 25°C và độ ẩm 65%. Tỷ lệ chết của trứng được tính toán bằng cách kiểm tra xem trứng đã được phun bằng nhũ tương có nở hay không.

Thử nghiệm nêu trên được tiến hành trên các nhũ tương chứa hợp chất amin vòng là hợp chất số: H-1, H-2, H-29, H-43, H-54, H-56, và H-73. Kết quả cho thấy đối với tất cả các hợp chất trong trường hợp pha loãng đến nồng độ bằng 125ppm, tỷ lệ chết của trứng là 80% hoặc cao hơn.

Ví dụ thử nghiệm 5 Thử nghiệm công hiệu diệt côn trùng kháng *Haemaphysalis longicornis*

Hợp chất theo sáng chế được pha loãng với axeton để điều chế dung dịch thuốc có nồng độ 400ppm. 118 µL dung dịch thuốc này được phủ lên trên bề mặt bên trong của lọ thủy tinh nhỏ dung tích 20 mL, tiếp đó axeton được làm bay hơi để tạo thành màng mỏng của hợp chất theo sáng chế trên bề mặt bên trong của lọ

thủy tinh nhỏ. Vì diện tích của lọ thủy tinh nhỏ là 47 cm^2 , lượng phủ của dung dịch thuốc trên mỗi diện tích bề mặt bên trong là $1 \text{ } \mu\text{g}/\text{cm}^2$. Tám ấu trùng ve *Haemaphysalis longicornis* được đặt trong lọ thủy tinh nhỏ, tiếp đó lọ thủy tinh nhỏ được đóng kín và được đặt trong phòng có nhiệt độ được kiểm soát ở mức 25°C . Tỷ lệ chết của côn trùng được tính toán sau 5 ngày.

Tỷ lệ chết của côn trùng (%) = (số lượng ve bị chết / số lượng ve được giải phóng) $\times 100$

Kết quả cho thấy trong số các hợp chất thử nghiệm, các hợp chất sau đã chứng tỏ tỷ lệ chết của côn trùng bằng 80% hoặc cao hơn.

Hợp chất số: H-5, H-29, H-43, H-55, H-63, H-73, H-83, H-90, J-42, K-38, K-39.

Ví dụ thử nghiệm 6 Thử nghiệm công hiệu diệt côn trùng kháng bọ chét ở mèo

Hợp chất theo sáng chế được pha loãng với axeton để điều chế dung dịch thuốc có nồng độ 400ppm. 118 μL dung dịch thuốc này được phủ lên trên bề mặt bên trong của lọ thủy tinh nhỏ dung tích 20 mL, tiếp đó axeton được làm bay hơi để tạo ra màng mỏng của hợp chất theo sáng chế trên bề mặt bên trong của lọ thủy tinh nhỏ. Vì diện tích của lọ thủy tinh nhỏ là 47 cm^2 , lượng phủ của dung dịch thuốc trên mỗi diện tích bề mặt bên trong là $1 \text{ } \mu\text{g}/\text{cm}^2$. Tám ấu trùng bọ chét ở mèo được đặt trong lọ thủy tinh nhỏ, tiếp đó lọ thủy tinh nhỏ được đóng kín và được đặt trong phòng có nhiệt độ được kiểm soát ở mức 25°C . Tỷ lệ chết của côn trùng được tính toán sau 1 ngày.

Tỷ lệ chết của côn trùng (%) = (số lượng côn trùng bị chết / số lượng côn trùng được giải phóng) $\times 100$

Kết quả cho thấy trong số các hợp chất thử nghiệm, các hợp chất sau chứng tỏ tỷ lệ chết của côn trùng bằng 80% hoặc cao hơn.

Hợp chất số: H-73, K-38, K-39.

Các kết quả nêu trên cho thấy, rõ ràng là hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế có công hiệu diệt côn trùng vượt trội trong việc chống lại ve bét.

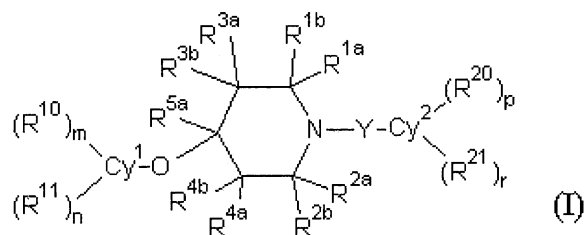
Khả năng áp dụng công nghiệp

Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế làm cho sáng chế có thể ngăn ngừa một cách hiệu quả các loại ve bét có hại đối với cây trồng nông nghiệp hoặc có hại đối với vấn đề vệ sinh.

Hợp chất hydroxylamin hoặc muối của chúng theo sáng chế làm cho sáng chế có thể dễ dàng tổng hợp hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo sáng chế. Do đó, sáng chế có hiệu quả trên quy mô công nghiệp.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất amin vòng được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của chúng:



trong công thức (I),

Cy¹ biểu thị nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl hoặc nhóm pyridazinyl;

Cy² biểu thị nhóm phenyl, nhóm pyrazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm pyridyl, nhóm pyrimidinyl, hoặc nhóm pyridazinyl;

R¹ᵇ, R²ᵇ, R³ᵇ, R⁴ᵇ và R⁵ᵃ độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế;

R¹ᵃ và R²ᵃ, hoặc R³ᵃ và R⁴ᵃ liên kết với nhau để tạo ra nhóm C₃ alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C₃ alkenylen chưa được thế hoặc được thế, hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: —CH₂C(=O)CH₂—;

khi R¹ᵃ và R²ᵃ liên kết với nhau, R³ᵃ và R⁴ᵃ độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế;

khi R³ᵃ và R⁴ᵃ liên kết với nhau, R¹ᵃ và R²ᵃ độc lập biểu thị nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₆ alkyl chưa được thế hoặc được thế;

R¹⁰ biểu thị nhóm C₁₋₆ alkyl, nhóm C₁₋₆ alkoxy C₁₋₆ alkyl, nhóm C₁₋₆ alkoxy C₁₋₆ alkoxy C₁₋₆ alkyl, nhóm C₂₋₆ alkenyl, nhóm hydroxy, nhóm C₁₋₆ alkoxy, nhóm C₁₋₆ haloalkoxy, nhóm C₃₋₈ xycloalkoxy, nhóm C₂₋₆ alkenyloxy, nhóm C₂₋₆ haloalkenyloxy, nhóm C₂₋₆ alkynyloxy, nhóm C₂₋₆ haloalkynyloxy, nhóm C₁₋₆ alkoxy C₁₋₆ alkoxy, nhóm C₃₋₈ xycloalkyl C₁₋₆ alkoxy, nhóm xyano C₁₋₆ alkoxy, nhóm C₁₋₇ axyl C₁₋₆ alkoxy, nhóm hydroxy C₁₋₆ alkoxy, nhóm C₁₋₇ axyloxy, nhóm

C_{1-6} alkoxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxycarbonyl, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyl aminocarbonyloxy, nhóm C_{6-10} aryl, nhóm heterocyclyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl sulfonyloxy, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-6} alkyl thio hoặc nhóm nitro;

R^{11} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluoranyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl;

R^{20} biểu thị nhóm xyano, nguyên tử halogen, nhóm pentafluoranyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, nhóm C_{2-6} haloalkenyl hoặc nhóm C_{2-6} haloalkynyl; và

R^{21} biểu thị nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkyl, nhóm hydroxy, nhóm C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} haloalkoxy, nhóm C_{2-6} haloalkenyloxy, nhóm C_{2-6} haloalkynyloxy, nhóm C_{1-6} alkoxy C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{3-8} cycloalkyl C_{1-6} alkoxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkenyloxycarbonyl, nhóm C_{2-6} alkynyloxycarbonyl, nhóm C_{1-6} alkyliden aminooxy, nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl amino, nhóm C_{7-11} aralkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{7-11} aralkyloxy chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm nitro;

m biểu thị số lượng R^{10} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi m bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{10} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

n biểu thị số lượng R^{11} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi n bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{11} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

p biểu thị số lượng R^{20} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi p bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{20} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

r biểu thị số lượng R^{21} và là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5, khi r bằng hoặc lớn hơn 2, các R^{21} có thể giống nhau hoặc khác nhau;

Y biểu thị nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh.

2. Hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo điểm 1, trong đó:

trong công thức (I), Cy^1 biểu thị nhóm phenyl;

R^{1b} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} và R^{5a} biểu thị nguyên tử hydro;

R^{1a} và R^{2a} liên kết với nhau để tạo ra nhóm C_{3-6} alkylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{3-6} alkenylen chưa được thế hoặc được thế, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2OCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2SCH_2-$, nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2C(=O)CH_2-$ hoặc nhóm được biểu thị bằng công thức: $-CH_2NR^6CH_2-$ (với điều kiện R^6 biểu thị nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl chưa được thế hoặc được thế, nhóm C_{1-7} axyl chưa được thế hoặc được thế hoặc nhóm C_{1-6} alkoxycarbonyl chưa được thế hoặc được thế);

Cy^2 biểu thị nhóm pyridin-2-yl;

Y biểu thị nguyên tử oxy;

r bằng 0; và

p là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4.

3. Chất diệt trừ loài gây hại chứa chất mang lỏng và ít nhất một hợp chất được chọn từ hợp chất amin vòng hoặc muối của chúng theo điểm 1 làm hoạt chất.