



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

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

(11) 
1-0021671

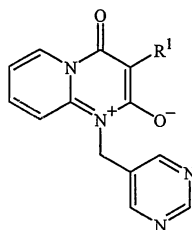
(51)⁷ **C07D 471/04, A01N 43/90**

(13) **B**

-
- (21) 1-2013-01313 (22) 22.12.2011
(86) PCT/US2011/066798 22.12.2011 (87) WO2012/092115 05.07.2012
(30) 61/427,855 29.12.2010 US
61/550,675 24.10.2011 US
(45) 25.09.2019 378 (43) 25.10.2013 307
(73) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898, United States of America
(72) PAHUTSKI, Thomas, Francis., Jr. (US)
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)
-

(54) **HỢP CHẤT PYRIDO[1,2-A]PYRIMIDIN MESOION TRỪ DỊCH HẠI**

(57)



1

Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức 1, trong đó: R¹ là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng Q và lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ R²; mỗi R² độc lập là halogen, xyano, SF₅, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio hoặc C₁-C₄ haloalkylthio; và Q là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng lên tới 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm chứa các hợp chất có công thức 1 và phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế. Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt được phát triển từ cây trồng này hoặc khu vực sống của cây trồng tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế.

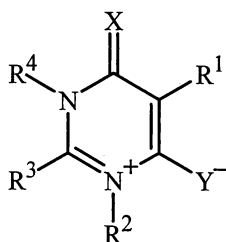
Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các hợp chất pyrimidin nhất định, chế phẩm chứa chúng thích hợp để dùng trong các lĩnh vực nông nghiệp, phi nông nghiệp, và các phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống như các động vật chân khớp trong cả môi trường nông nghiệp lẫn môi trường phi nông nghiệp bằng cách sử dụng chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống là vô cùng quan trọng để đạt được năng suất thu hoạch cao. Thiệt hại do các loài gây hại không xương sống gây ra đối với cây trồng đang sinh trưởng và nông sản trong quá trình bảo quản có thể làm giảm đáng kể năng suất và do đó dẫn đến tăng chi phí cho người tiêu dùng. Việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong lâm nghiệp, cây trồng nhà kính, cây trồng trang trí, vườn ươm cây trồng, lương thực bảo quản và các sản phẩm sợi, gia súc, đồ gia dụng, bãi cỏ, các sản phẩm gỗ, và trong y tế cũng rất quan trọng. Nhiều sản phẩm đáp ứng được các mục đích này hiện có bán trên thị trường, nhưng vẫn cần có các hợp chất mới có hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, độc tính thấp hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có vị trí tác động khác.

Công bố đơn quốc tế số WO 09/099929 bộc lộ các hợp chất pyrimidin mesoion nhất định có công thức i để dùng làm thuốc trừ sâu:

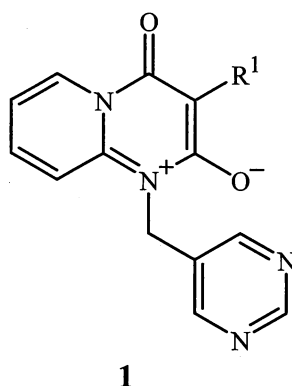


i

trong đó, ngoài các gốc khác, X và Y là O, R¹ là phenyl được thế, R² là CH₂Q và Q là nhân 5 hoặc 6 cạnh dị thơm tùy ý được thế, và R³ và R⁴ cùng với nhau để tạo ra nhân 6 cạnh tùy ý được thế.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức 1, chế phẩm chứa chúng và phương pháp phòng trừ các loài gây hại không xương sống:



trong đó:

R^1 là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng Q và lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ R^2 ;

mỗi R^2 độc lập là halogen, xyano, SF_5 , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, C_1-C_4 alkylthio hoặc C_1-C_4 haloalkylthio; và

Q là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng lên tới 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy.

Sáng chế đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng. Theo một phương án, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất có công thức 1 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này còn bao gồm ít nhất một hoạt chất hoặc tác nhân sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng hữu hiệu sinh học (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được nêu trong phần mô tả). Sáng chế còn đề xuất phương pháp trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó được cho tiếp xúc với chế phẩm bao gồm hợp chất có công thức 1 với lượng hữu hiệu sinh học và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn bao gồm ít nhất một hoạt chất hoặc tác nhân sinh học bổ sung với lượng hữu hiệu sinh học.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với chế phẩm bất kỳ trong số các chế phẩm nêu trên với lượng hữu hiệu sinh học trong đó môi trường này là thực vật.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với chế phẩm bất kỳ trong số các chế phẩm nêu trên với lượng hữu hiệu sinh học trong đó môi trường này là hạt.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho hạt này tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng hữu hiệu sinh học (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được nêu trong phần mô tả). Sáng chế cũng đề xuất hạt được xử lý (tức là hạt được tiếp xúc với hợp chất có công thức 1).

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt được phát triển từ cây trồng này hoặc khu vực sống (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của cây trồng tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng hữu hiệu sinh học (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được nêu trong phần mô tả).

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả này, các thuật ngữ “bao gồm”, “gồm”, “kể cả”, “chứa”, “có”, “đặc trưng bởi” hoặc biến thể khác bất kỳ của nó, được dự định để bao hàm phương án không mang tính loại trừ, tùy thuộc vào giới hạn được chỉ ra một cách rõ ràng. Ví dụ, khi chế phẩm, hỗn hợp, quy trình, phương pháp, vật phẩm, hoặc dụng cụ bao gồm một số phần tử thì nó không nhất thiết chỉ giới hạn ở các phần tử này mà có thể bao gồm các phần tử khác được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có đối với các chế phẩm, hỗn hợp, quy trình, hoặc phương pháp này.

Thuật ngữ “cấu thành” không gồm phần tử, bước hoặc thành phần bất kỳ không được định rõ. Nếu trong yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ này có thể khoanh vùng giới hạn yêu cầu bảo hộ để không bao gồm các chất liệu khác với chất liệu được nêu trừ các tạp chất thường đi kèm với chúng. Khi thuật ngữ “cấu thành” xuất hiện trong một mệnh đề của phần khác biệt yêu cầu bảo hộ, chứ không phải ngay sau phần giới hạn, thì nó chỉ giới hạn phần tử được chỉ ra trong mệnh đề này; các phần tử khác không bị loại trừ khỏi toàn bộ yêu cầu bảo hộ này.

Thuật ngữ “cấu thành chủ yếu từ” được dùng để xác định thành phần hoặc phương pháp bao gồm các chất liệu, các bước, các dấu hiệu, các hợp phần hoặc các nguyên tố, ngoài các loại đã được mô tả cụ thể, còn bao gồm các chất liệu, các bước, các dấu hiệu,

các hợp phân hoặc các nguyên tố bổ sung không ảnh hưởng tới các đặc tính mới và cơ bản của sáng chế được yêu cầu bảo hộ. Thuật ngữ “cấu thành chủ yếu từ” nằm trung gian giữa “bao gồm” và “cấu thành”.

Khi sáng chế hoặc một phần của nó được xác định bằng thuật ngữ mở “bao gồm”, thì cần hiểu rằng (trừ khi có chỉ dẫn khác được nêu ra cụ thể) phân mô tả này cũng mô tả sáng chế bằng cách các thuật ngữ “cấu thành chủ yếu là” hoặc “cấu thành”.

Ngoài ra, trừ khi chỉ có dẫn khác, “hoặc” được dùng để chỉ hoặc bao hàm chứ không phải hoặc loại trừ. Ví dụ, điều kiện “A hoặc B” được thoả mãn trong các trường hợp sau: A đúng (hoặc có mặt) và B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Ngoài ra, các mạo từ không xác định “một” đứng trước phân tử hoặc thành phần theo sáng chế cũng không bị giới hạn để chỉ một số trường hợp (hay số lần xuất hiện) của phân tử hoặc thành phần này. Vì vậy, “một” phải được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của phân tử hoặc thành phần cũng dùng để chỉ cả số nhiều trừ khi số này có nghĩa rõ ràng là số ít.

Trong bản mô tả này, thuật ngữ “loài gây hại không xương sống” bao gồm động vật chân khớp, động vật chân bụng, giun tròn và giun sán gây ảnh hưởng về mặt kinh tế như các loài gây hại. Thuật ngữ “động vật chân khớp” bao gồm côn trùng, bét, nhện, bọ cạp, rết, động vật nhiều chân, rệp tròn và loài chân rết. Thuật ngữ “động vật chân bụng” bao gồm ốc sên, sên và các loài thuộc bộ ốc cạn (Stylommatophora) khác. Thuật ngữ “giun tròn” bao gồm các chi của ngành Nematoda, như giun tròn ăn thực vật và các loài giun sán ký sinh trên động vật. Thuật ngữ “giun sán” bao gồm tất cả các loại giun ký sinh, như giun tròn (phylum Nematoda), giun tim (phylum Nematoda, lớp Secernentea), sán (phylum Platyhelminthes, lớp Tematoda), giun đầu gai (phylum Acanthocephala), và sán dây (phylum Platyhelminthes, lớp Cestoda).

Trong bản mô tả này “phòng trừ loài gây hại không xương sống” nghĩa là ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (bao gồm gây tử vong, làm giảm sự tiếp nhận thức ăn và/hoặc phá vỡ giao cấu); các thuật ngữ liên quan được xác định tương tự.

Thuật ngữ “nông nghiệp” được dùng để chỉ việc sản xuất cây trồng trên cánh đồng dùng làm lương thực và sợi và bao gồm sự gieo trồng ngô, đậu tương và các cây họ đậu khác, lúa, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, ngô và gạo), các loại rau lấy lá (ví dụ, rau diếp, cải bắp, và các cây trồng bao cánh khác), các loại rau lấy quả (ví dụ, cà chua, hồ tiêu, cà, cải bắp và bầu bí), khoai tây, khoai tây ngọt, nho, bông, các cây ăn quả (ví dụ, táo, quả hột cứng và cam quýt), quả nhỏ (trứng cá, anh đào) và cây trồng đặc sản khác (ví dụ, cây cải dầu, cây hướng dương, oliu).

Thuật ngữ "phi nông nghiệp" được dùng để chỉ các cây trồng không phải trên cánh đồng, như các cây trồng trong vườn (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây dùng để trang trí không trồng ngoài đồng), các công trình thương mại và nhà ở thành phố và các khu công nghiệp, lớp đất mặt (trong lĩnh vực thương mại, sân gôn, nhà ở, khu vui chơi giải trí, v.v.), các sản phẩm gỗ, sản phẩm bảo quản trong nông lâm nghiệp và các ứng dụng trong lĩnh vực y tế (tức là người) và thú y (tức là vật nuôi cảnh như gia súc, gia cầm, các động vật không thuần hoá như động vật hoang dại).

Thuật ngữ "sức sống của cây trồng" được dùng để chỉ tốc độ sinh trưởng hoặc khả năng tích tụ sinh khối của cây trồng. "Làm tăng sức sống" được dùng để chỉ việc làm tăng khả năng sinh trưởng hoặc khả năng tích tụ sinh khối ở cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý. Thuật ngữ "năng suất cây trồng" được dùng để chỉ giá trị thu lại từ cây trồng, cả về số lượng lẫn chất lượng, thu được sau khi thu hoạch cây trồng. "Làm tăng năng suất cây trồng" được dùng để chỉ việc làm tăng năng suất cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý.

Thuật ngữ "lượng hữu hiệu sinh học" được dùng để chỉ lượng hoạt chất sinh học (ví dụ, hợp chất có công thức 1) đủ để tạo ra tác dụng sinh học mong muốn khi được đưa lên (tức được cho tiếp xúc với) loài gây hại không xương sống cần kiểm soát hoặc môi trường xung quanh nó, hoặc lên thực vật, hạt thu được từ thực vật, hoặc khu vực sống của thực vật (ví dụ, môi trường sinh trưởng) để bảo vệ thực vật khỏi tổn hại gây ra bởi loài gây hại không xương sống hoặc tạo ra tác dụng mong muốn khác (ví dụ, làm tăng sức sống của thực vật).

Các ứng dụng phi nông nghiệp bao gồm bảo vệ động vật khỏi loài ký sinh không xương sống bằng cách cho động vật cần được bảo vệ dùng lượng có tác dụng diệt ký sinh trùng hữu hiệu (tức là hữu hiệu sinh học) của hợp chất theo sáng chế, thường trong ở dạng chế phẩm được chế hoá để dùng cho thú y. Như được đề cập trong bản mô tả và phần yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ "diệt ký sinh trùng" và "có tác dụng diệt ký sinh trùng" được dùng để chỉ tác dụng đáng kể đối với loài ký sinh trùng không xương sống để tạo ra bảo vệ của động vật khỏi loài gây hại này. Tác dụng diệt ký sinh trùng thường là việc làm giảm sự xuất hiện hoặc hoạt động của loài ký sinh không xương sống đích. Tác dụng đối với loài gây hại bao gồm gây hoại tử, làm chết, làm chậm phát triển, làm giảm sự di động hoặc làm giảm khả năng tồn tại trên hoặc trong vật chủ, làm giảm ăn và ức chế sinh sản. Các tác dụng này đối với loài gây hại ký sinh không xương sống cho phép kiểm soát (bao gồm ngăn ngừa, làm giảm hoặc hạn chế) sự nhiễm trùng hoặc nhiễm ký sinh của động vật.

Trong các phần mô tả nêu trên, thuật ngữ “alkyl”, được sử dụng một mình hoặc trong hợp chất như “haloalkyl” bao gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như metyl, etyl, *n*-propyl, *i*-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl khác nhau.

Thuật ngữ “halogen”, được sử dụng một mình hoặc trong hợp chất như “haloalkyl”, bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Ngoài ra, khi được sử dụng trong hợp chất như “haloalkyl”, alkyl này có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng nguyên tử halogen có thể là giống nhau hoặc khác nhau. Ví dụ về “haloalkyl” bao gồm CF_3 , CH_2Cl , CH_2CF_3 và CCl_2CF_3 . Thuật ngữ “haloalkoxy” và “haloalkylthio” được định nghĩa tương tự như thuật ngữ “haloalkyl”. Ví dụ về “haloalkoxy” bao gồm CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ và $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Ví dụ về “haloalkylthio” bao gồm CCl_3S , CF_3S , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ và $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$.

“Alkoxy” bao gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, *n*-propoxy, isopropoxy và các chất đồng phân butoxy khác nhau.

Thuật ngữ “alkylthio” bao gồm các gốc alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metylthio, etylthio, và các chất đồng phân propylthio và butylthio khác nhau.

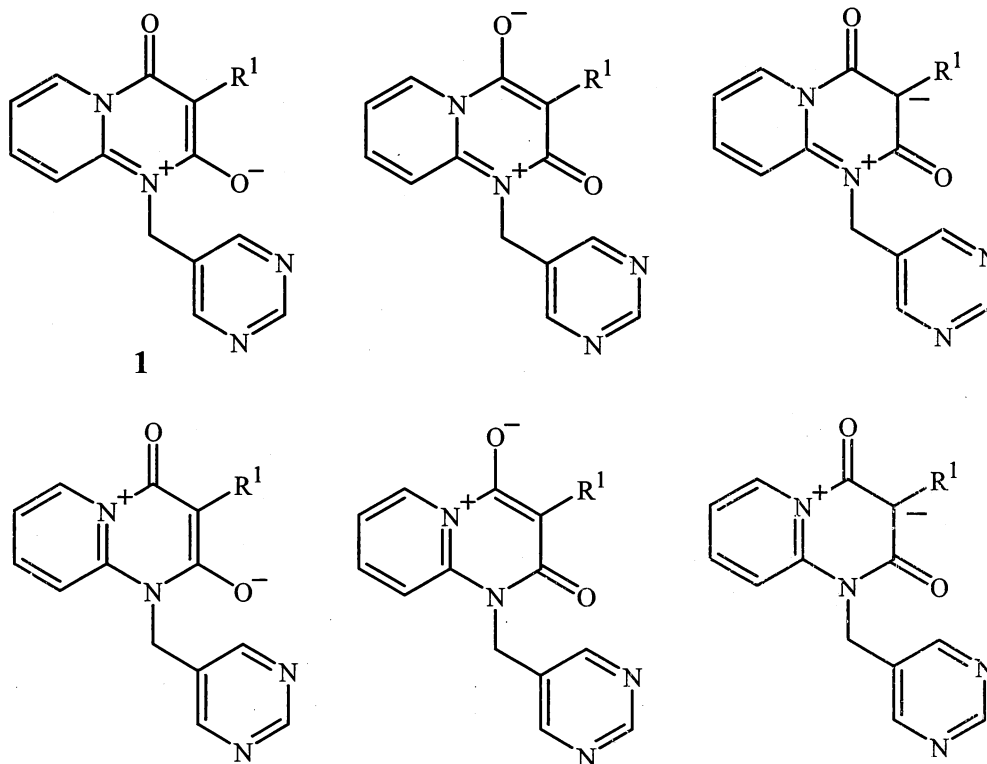
Tổng số nguyên tử cacbon trong nhóm thế được chỉ ra bằng tiền tố “ $\text{C}_i\text{—C}_j$ ” trong đó *i* và *j* là các số từ 1 đến 4. Ví dụ, $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkyl được dùng để chỉ gốc metyl đến butyl.

Khi gốc tùy ý được thế bằng các phân tử thế đã nêu với số phân tử thế được đề cập (ví dụ, “lên tới 3”), thì gốc này có thể không được thế hoặc được thế bằng số phân tử thế thay đổi lên tới số cao nhất như đã đề cập (ví dụ, “3”), và phân tử thế được gắn độc lập được chọn từ các phân tử thế đã nêu.

Số phân tử thế tùy chọn có thể được hạn chế trong một giới hạn được biểu hiện. Ví dụ, cụm từ “tùy ý được thế bằng lên tới 3 phân tử thế độc lập được chọn từ R^2 ” chỉ ra rằng 0, 1, 2 hoặc 3 phân tử thế có thể có mặt (nếu số điểm nối hiệu lực cho phép). Khi một khoảng được định rõ cho số phân tử thế vượt quá số vị trí có thể có mặt cho phân tử thế trên nhân, thì giới hạn cao nhất thực tế của khoảng này được ghi nhận là số vị trí có thể có mặt.

Hợp chất có công thức 1 là các muối nội mezo-ion. “Các muối nội”, cũng đã biết trong lĩnh vực này như “ion lưỡng tính”, là các phân tử trung hoà về mặt điện tích nhưng mang điện tích dương và âm trên các nguyên tử khác nhau trong mỗi cấu trúc liên kết hoá trị theo thuyết liên kết hoá trị. Ngoài ra, cấu tạo phân tử của hợp chất có công thức 1 có thể được thể hiện bằng sáu cấu trúc liên kết hoá trị như được thể hiện dưới đây, mỗi cấu trúc đặt điện tích dương và âm trên các nguyên tử khác nhau. Vì sự cộng hưởng này, hợp chất có công thức 1 cũng được mô tả là “mezo-ion”. Mặc dù để cho đơn giản, cấu tạo phân tử của hợp chất có công thức 1 được mô tả dưới dạng cấu trúc liên kết hoá trị đơn

trong bản mô tả và yêu cầu bảo hộ sáng chế, cấu trúc liên kết hoá trị cụ thể này được hiểu là minh hoạ cho toàn bộ sáu cấu trúc liên kết hoá trị liên quan đến sự liên kết trong phân tử của hợp chất có công thức 1. Do đó, công thức 1 trong bản mô tả đề cập đến toàn bộ sáu cấu trúc liên kết hoá trị và cấu trúc khác có thể sử dụng (ví dụ, thuyết quỹ đạo phân tử) trừ khi có quy định khác được định rõ.



Các hợp chất theo sáng chế có thể tồn tại dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân cấu hình riêng do sự quay liên kết bị giới hạn bởi sự cản trở không gian. Ví dụ, hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là phenyl đã được thế ở vị trí ortho bằng nhóm alkyl đòi hỏi về mặt không gian (ví dụ, isopropyl) có thể tồn tại dưới dạng hai chất đồng phân hình học do bị giới hạn sự quay xung quanh liên kết R^1 -nhân pyrimidin. Sáng chế bao gồm hỗn hợp gồm các chất đồng phân cấu hình riêng. Ngoài ra, sáng chế bao gồm hợp chất đã được làm giàu một chất đồng phân cấu hình riêng so với các hợp chất khác.

Các hợp chất được chọn từ công thức 1 thường tồn tại dưới nhiều dạng, và do đó công thức 1 bao gồm các dạng kết tinh và không kết tinh của các hợp chất có công thức 1. Các dạng không kết tinh bao gồm các phương án là các chất rắn như sáp và gốm cũng như các phương án là các chất lỏng như dung dịch và khối nóng chảy. Các dạng kết tinh bao gồm các phương án mà chủ yếu là có dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp của các chất đa hình (tức là các dạng kết tinh khác nhau). Thuật ngữ “đa hình” được dùng để chỉ dạng kết tinh cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng kết tinh khác nhau, các dạng này có bố trí và/hoặc cấu hình riêng khác nhau của phân tử trong mạng

tinh thể. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hoá học tương tự, chúng cũng có thể có thành phần khác do sự có mặt hoặc không có mặt của nước hoặc phân tử khác đồng kết tinh, có thể liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng tinh thể. Chất đa hình có thể khác về đặc điểm hoá học, lý học và sinh học như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ bền hoá học, điểm chảy, độ hút ẩm, khả năng tạo huyền phù, tốc độ hoà tan và độ sinh khả dụng. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ đánh giá đúng dạng đa hình của hợp chất có công thức 1 có thể bộc lộ tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế chế phẩm hữu ích, có tác dụng sinh học cải thiện) hơn so với dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách dạng đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 có thể đạt được bằng phương pháp mà người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này đã biết kể cả, ví dụ, việc kết tinh bằng cách sử dụng dung môi và nhiệt độ được lựa chọn.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ biết rõ rằng do trong môi trường và dưới các điều kiện sinh lý, các muối của các hợp chất hóa học đạt trạng thái cân bằng với các dạng không muối tương ứng của chúng, các muối chia sẻ khả năng áp dụng sinh học của các dạng không muối. Do đó, có một khoảng rộng của các muối của các hợp chất có công thức 1 hữu ích để phòng trừ các loài gây hại không xương sống các loài gây hại không xương sống và các ký sinh trùng động vật (tức là thích hợp cho ngành thú y). Các muối của các hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc hữu cơ như các axit hydrobromic, clohydric, nitric, phosphoric, sulfuric, axetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salicylic, tartaric, 4-toluensulfonic hoặc valeric.

Các phương án theo sáng chế như được mô tả trong phần bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Trong các phương án viện dẫn tới "hợp chất có công thức 1" kể cả các định nghĩa của các phân tử thể đã được đặc tả trong phần bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi được định nghĩa thêm trong các phương án.

Phương án 1. Hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là phenyl tùy ý được thế bằng Q và lên tới 3 phân tử thế độc lập được chọn từ R^2 .

Phương án 1a. Hợp chất theo phương án 1 trong đó R^1 là phenyl tùy ý được thế bằng lên tới 3 phân tử thế độc lập được chọn từ R^2 .

Phương án 2. Hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là pyridinyl tùy ý được thế bằng Q và lên tới 3 phân tử thế độc lập được chọn từ R^2 .

Phương án 2a. Hợp chất theo phương án 2 trong đó R^1 là pyridinyl tùy ý được thế bằng lên tới 3 phân tử thế độc lập được chọn từ R^2 .

Phương án 3. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 1—2a trong đó mỗi R^2 độc lập là halogen, $C_1—C_4$ alkyl, $C_1—C_4$ haloalkyl, $C_1—C_4$ alkoxy hoặc $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 3a. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là halogen, $C_1—C_2$ alkyl, $C_1—C_2$ haloalkyl, $C_1—C_2$ alkoxy hoặc $C_1—C_2$ haloalkoxy.

Phương án 3b. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là halogen.

Phương án 3c. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là $C_1—C_4$ alkyl.

Phương án 3d. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là $C_1—C_4$ haloalkyl.

Phương án 3e. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là $C_1—C_4$ alkoxy.

Phương án 3f. Hợp chất theo phương án 3 trong đó mỗi R^2 độc lập là $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 4. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 1, 2 và 3—3f trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng lên tới 5 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, $C_1—C_4$ alkyl, $C_1—C_4$ haloalkyl, $C_1—C_4$ alkoxy và $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 4a. Hợp chất có công thức 1 hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án 1, 2 và 3—3f trong đó Q là pyridinyl tùy ý được thế bằng lên tới 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, $C_1—C_4$ alkyl, $C_1—C_4$ haloalkyl, $C_1—C_4$ alkoxy và $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 4b. Hợp chất theo phương án 4 trong đó Q là phenyl tùy ý được thế bằng lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm xyano và $C_1—C_4$ alkyl.

Phương án 5. Hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là phenyl được thế bằng lên tới 2 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, $C_1—C_4$ haloalkyl và $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 6. Hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là phenyl được thế bằng halogen, $C_1—C_4$ haloalkyl hoặc $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Phương án 7. Hợp chất có công thức 1 trong đó R^1 là phenyl được thế bằng $C_1—C_4$ haloalkyl hoặc $C_1—C_4$ haloalkoxy.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1—7 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được nêu trong bản mô tả này, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và việc mô tả các cải biến trong các phương án này không những liên quan đến các hợp chất có công thức 1 mà còn liên quan đến các hợp chất khởi đầu và hợp chất trung gian hữu ích để điều chế các hợp chất có công thức 1. Ngoài ra, các phương án theo sáng

chế, bao gồm các phương án 1-7 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được nêu trong bản mô tả này, và các phương án kết hợp bất kỳ của chúng, có liên quan đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Việc kết hợp các phương án 1—7 được minh họa bởi:

Phương án A. Hợp chất có công thức 1, trong đó:

R^1 là phenyl tùy ý được thế bằng Q và lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ R^2 ; và

Q là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, C_1 — C_4 alkyl, C_1 — C_4 haloalkyl, C_1 — C_4 alkoxy và C_1 — C_4 haloalkoxy.

Phương án B. Hợp chất theo phương án A, trong đó:

R^1 là phenyl tùy ý được thế bằng lên tới 3 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, C_1 — C_4 alkyl, C_1 — C_4 haloalkyl, C_1 — C_4 alkoxy và C_1 — C_4 haloalkoxy.

Các phương án cụ thể bao gồm các hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm bao gồm:

muối nội 2-hydroxy-4-oxo-3-phenyl-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 1 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(4-flophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]-pyrimidin (tức là hợp chất 2 của bảng mục lục A);

muối nội 2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 3 của bảng mục lục A);

muối nội 2-hydroxy-3-(2-metoxyphephenyl)-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 4 của bảng mục lục A);

muối nội 2-hydroxy-3-(3-metoxyphephenyl)-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 5 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(2,4-điflophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 6 của bảng mục lục A);

muối nội 2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometoxy)phenyl]-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 7 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(2-bromophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 8 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(2-flophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin (tức là hợp chất 9 của bảng mục lục A);

muối nội 3-[2-flo-5-(triflometyl)phenyl]-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 10 của bảng mục lục A);

muối nội 2-hydroxy-3-(3-metylphenyl)-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 11 của bảng mục lục A);

muối nội 3-[4-flo-3-(triflometyl)phenyl]-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 12 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(4-clo-2-flophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 13 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(2-clophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 14 của bảng mục lục A);

muối nội 3-[3-clo-5-(triflometyl)phenyl]-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 15 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(3,5-điclophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 16 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(3,5-điclo-4-flophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 17 của bảng mục lục A);

muối nội 3-(4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 18 của bảng mục lục A); và

muối nội 3-(3-clophenyl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (tức là hợp chất 19 của bảng mục lục A).

Đáng lưu ý rằng hợp chất theo sáng chế được đặc trưng bởi sự chuyển hoá thuận lợi và/hoặc kiểu tồn dư trong đất và có hoạt tính phòng trừ phổ của loài gây hại không xương sống trong nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Đặc biệt lưu ý rằng các phương án của sáng chế vì lý do phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống và ý nghĩa kinh tế, việc bảo vệ cây nông nghiệp khỏi thương tổn do loài gây hại không xương sống gây ra bằng cách phòng trừ loài gây hại không xương sống. Hợp chất theo sáng chế được quan tâm vì đặc điểm hoán chuyển thuận lợi của chúng hoặc nội hấp trong cây cũng bảo vệ lá hoặc các phần khác của cây không trực tiếp được tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

Cũng đáng lưu ý là các phương án theo sáng chế gồm các chế phẩm chứa hợp chất theo bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án khác bất kỳ được nêu trong bản mô tả, và sự kết hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha

loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn bao gồm ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung.

Cũng đáng lưu ý là các phương án theo sáng chế gồm các chế phẩm để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất (tức là, với lượng hữu hiệu sinh học) theo bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án khác bất kỳ được nêu trong bản mô tả, và sự kết hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn bao gồm ít nhất ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung (tức là, với lượng hữu hiệu sinh học).

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên ở dạng chế phẩm lỏng tưới cho đất. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương pháp để phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho đất tiếp xúc với chế phẩm lỏng ở dạng ngấm vào đất chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm phun để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất (tức là, với lượng hữu hiệu sinh học) theo bất kỳ trong số các phương án nêu trên và tác nhân đẩy. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm mồi để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất (tức là, với lượng hữu hiệu sinh học) theo bất kỳ trong số các phương án nêu trên, một hoặc nhiều nguyên liệu thức ăn, tùy chọn là chất hấp dẫn, và tùy chọn là chất giữ ẩm. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm dụng cụ để phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm chế phẩm mồi này và hộp đựng phù hợp để chứa chế phẩm mồi, trong đó hộp đựng này có ít nhất một lỗ hổng có kích cỡ nhất định để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua để sao cho loài gây hại không xương sống có thể tiếp cận được với chế phẩm mồi từ vị trí nằm phía ngoài hộp đựng này, và trong đó hộp đựng này còn phù hợp để đặt trong hoặc gần khu vực hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh của nó với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1 (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được nêu trong phần mô tả), với điều kiện là các phương pháp này không phải là các phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật bằng cách trị liệu.

Sáng chế này cũng đề cập đến các phương pháp trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh của nó được cho tiếp xúc với chế phẩm chứa

lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý chứa thêm lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung, với điều kiện là các phương pháp này không phải là các phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật bằng cách trị liệu.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó loài gây hại không xương sống là động vật chân đốt. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó động vật chân đốt được chọn từ nhóm bao gồm côn trùng, ve bét, nhện, bọ cạp, rết, động vật nhiều chân, rệp và rết vườn. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó động vật chân đốt là côn trùng. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó côn trùng thuộc bộ Hemiptera. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó côn trùng là ve sâu nhảy. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó côn trùng là ve sâu nhảy thuộc họ Delphacidae. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó côn trùng là rầy xanh đuôi đen. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó côn trùng là rầy xanh đuôi đen thuộc họ Cicadellidae.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó loài gây hại không xương sống là động vật chân bụng. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó động vật chân bụng được chọn từ nhóm bao gồm sên, ốc sên và nhóm Mất cuống (*Stylommatophora*) khác.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó loài gây hại không xương sống là giun tròn. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó giun tròn được chọn từ giun tròn ăn thực vật.

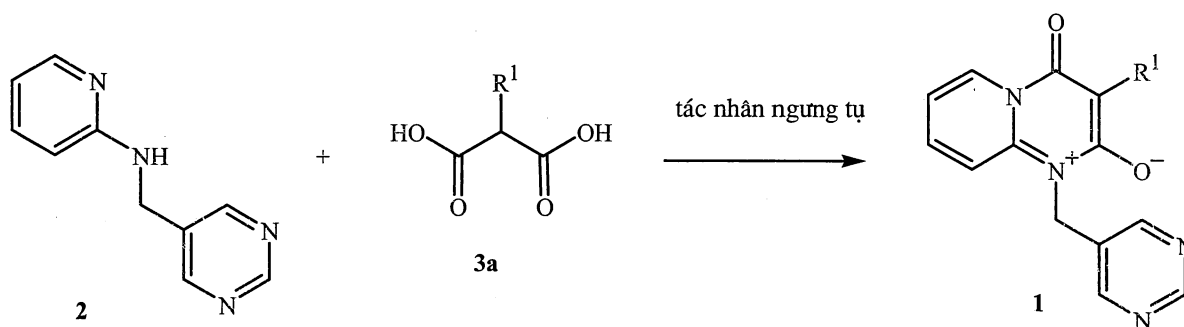
Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó loài gây hại không xương sống là giun sán. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên trong đó giun sán được chọn từ nhóm bao gồm giun tròn, giun tim, sán, giun đầu gai và sán dây.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương án liên quan đến phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng được bộc lộ trong phần bản chất kỹ thuật của sáng chế trong đó hợp chất có công thức 1 (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được nêu trong phần mô tả) được chọn từ hợp chất bất kỳ một trong số các phương án 1—4b, A và B, và các hợp chất bộc lộ cụ thể trong phần mô tả này.

Một hoặc nhiều phương pháp và biến đổi dưới đây như được mô tả trên các sơ đồ 1—13 có thể được sử dụng để điều chế các hợp chất có công thức 1. Định nghĩa về R¹ trong các hợp chất có các công thức 1—13 dưới đây như được xác định trên đây trong phần bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có chỉ dẫn khác. Nhiệt độ môi trường hoặc nhiệt độ trong phòng được xác định trong khoảng 20—25°C.

Các hợp chất có công thức 1 có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức 2 với các axit malonic tùy ý được thể có công thức 3a với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ như được thể hiện trong sơ đồ 1. Các tác nhân ngưng tụ có thể là các carbodiimide như dicyclohexyl carbodiimide (xem, ví dụ, Koch, A. et al. *Tetrahedron* 2004, 60, 10011—10018) hoặc các chất khác đã biết trong lĩnh vực này để tạo ra các liên kết amit có hoặc không có các tác nhân hoạt hóa như *N*-hydroxybenzotriazol như được mô tả trong *Science of Synthesis* 2005, 21, 17—25 và *Tetrahedron* 2005, 61, 10827—10852. Phản ứng này thường được thực hiện trong dung môi hữu cơ trơ, như điclorometan hoặc 1,2-dicloetan, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến 80°C trong thời gian từ 10 phút đến vài ngày.

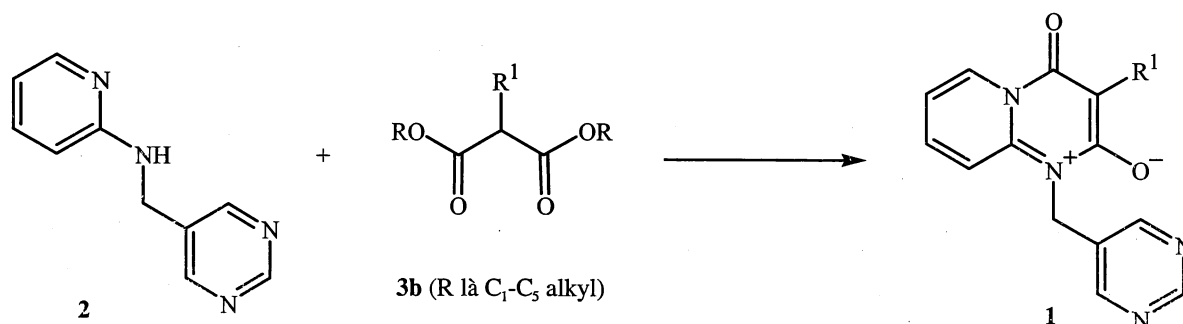
Sơ đồ 1



Các hợp chất có công thức 1a cũng có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức 2 với este của axit malonic có công thức 3b trong đó R là nhóm C₁-C₅ alkyl như được thể hiện trong sơ đồ 2. Các phản ứng này có thể được tiến hành nguyên như vậy hoặc với sự có mặt của các dung môi trơ như được mô tả trong ấn phẩm: *Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1999, 72(3), 503-509. Các dung môi trơ bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các hydrocarbon có điểm sôi cao như mesitylen, tetralin hoặc xylen, hoặc các ete có điểm sôi cao như diphenyl ete. Nhiệt độ thường nằm trong

khoảng từ 50°C đến 250°C. Lưu ý là các nhiệt độ nằm trong khoảng từ 150°C đến 200°C, chúng thường cho phép thời gian phản ứng nhanh chóng và tạo hiệu suất cao. Các phản ứng này cũng có thể được tiến hành trong các thiết bị phản ứng vi sóng trong cùng khoảng nhiệt độ. Thời gian phản ứng thường nằm trong khoảng từ 5 phút đến vài giờ.

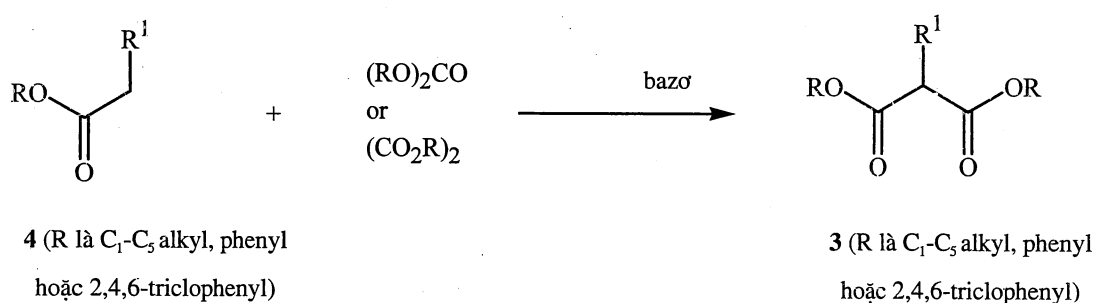
Sơ đồ 2



Các hợp chất có công thức 3a có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp đã biết trong lĩnh vực này, ví dụ bằng cách thủy phân bazơ của các hợp chất có công thức 3b.

Các hợp chất có công thức 3b có thể được điều chế bằng cách aryl hóa các este malonat (sử dụng các hợp chất có công thức R^1X^1 trong đó X^1 là Cl, Br hoặc I, ví dụ về các hợp chất này có thể tìm thấy trong các bảng I-24a, I-24-b và I-24c) được xúc tác bởi paladi (*J. Org. Chem* 2002, 67, 541-555) hoặc đồng (*Org. Lett.* 2002, 4, 269—272 và *Org. Lett.* 2005, 7, 4693—4695). Theo cách khác, các hợp chất có công thức 3b có thể được điều chế bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 2a (xem, ví dụ, *J. Med. Chem* 1982, 25(6), 745—747).

Sơ đồ 2a

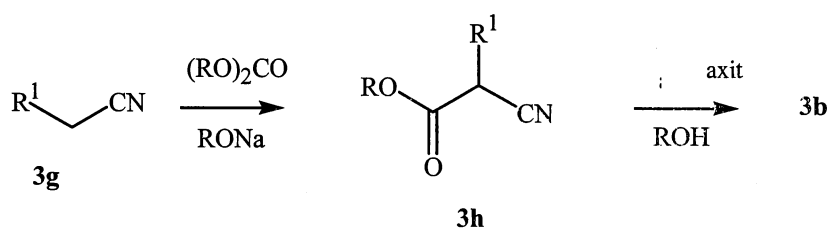


Các este có công thức 4 có thể được điều chế từ các axit tương ứng bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Các axit có công thức 4 trong đó R là H (các ví dụ được đưa ra trong bảng I-1) được điều chế dễ dàng bằng phương pháp đã biết trong lĩnh vực này, và nhiều axit có bán sẵn trên thị trường.

Các hợp chất có công thức 3b cũng có thể được điều chế bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 2b. Phản ứng nitril có công thức 3g với dialkyl cacbonat tạo ra các

este nitril có công thức 3h, và sau đó thủy phân axit với sự có mặt của rượu để tạo ra các hợp chất có công thức 3b (xem, ví dụ, *Helvetica Chimica Acta* 1991, 74(2), 309—314). Các nitril có công thức 3g được điều chế dễ dàng bằng phương pháp đã biết trong lĩnh vực này, và nhiều nitril có bán sẵn trên thị trường.

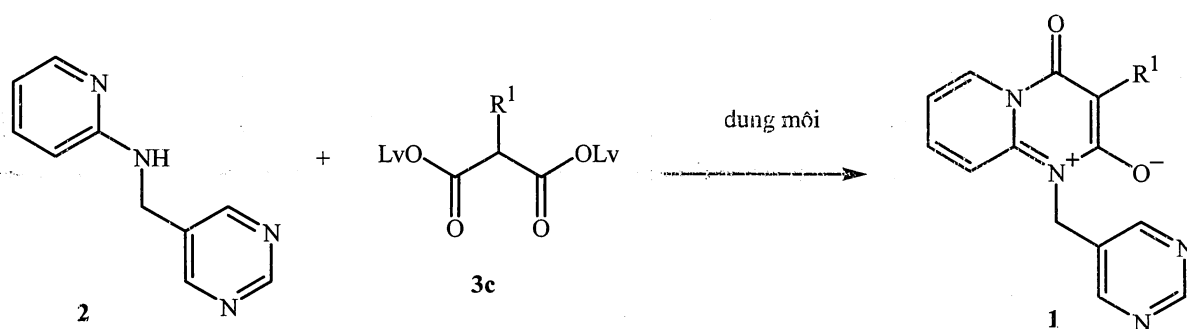
Sơ đồ 2b



R là C₁-C₅ alkyl

Các hợp chất có công thức 1a cũng có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức 2 phản ứng với các este đã hoạt hóa có công thức 3c trong đó LvO là nhóm rời chuyển đã hoạt hóa như được thể hiện trong sơ đồ 3. Các ví dụ về Lv được ưu tiên để dễ tổng hợp hoặc để phản ứng gồm phenyl, 4-nitrophenyl hoặc phenyl đã được thế bằng halogen (ví dụ, 2,4,6-triclorophenyl, pentaclorophenyl hoặc pentaflorophenyl) như được mô tả trong ấn phẩm: *Archiv der Pharmazie* (Weinheim, Germany) 1991, 324, 863-866. Các este đã hoạt hóa khác là đã biết rõ trong lĩnh vực kỹ thuật này và bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các *N*-hydroxysuccinimit este, ví dụ, xem ấn phẩm: *J. Am. Chem. Soc.* 2002, 124, 6872-6878). Nhiệt độ thường nằm trong khoảng từ 50°C đến 200°C. Đáng lưu ý là nhiệt độ nằm trong khoảng từ 50°C đến 150°C, chúng thường cho phép thời gian phản ứng nhanh chóng và tạo hiệu suất cao. Các phản ứng này có thể được tiến hành cùng với hoặc không cùng với dung môi, như toluen, và trong các thiết bị phản ứng vi sóng trong cùng khoảng nhiệt độ. Thời gian phản ứng thường nằm trong khoảng từ 5 phút đến 2 giờ.

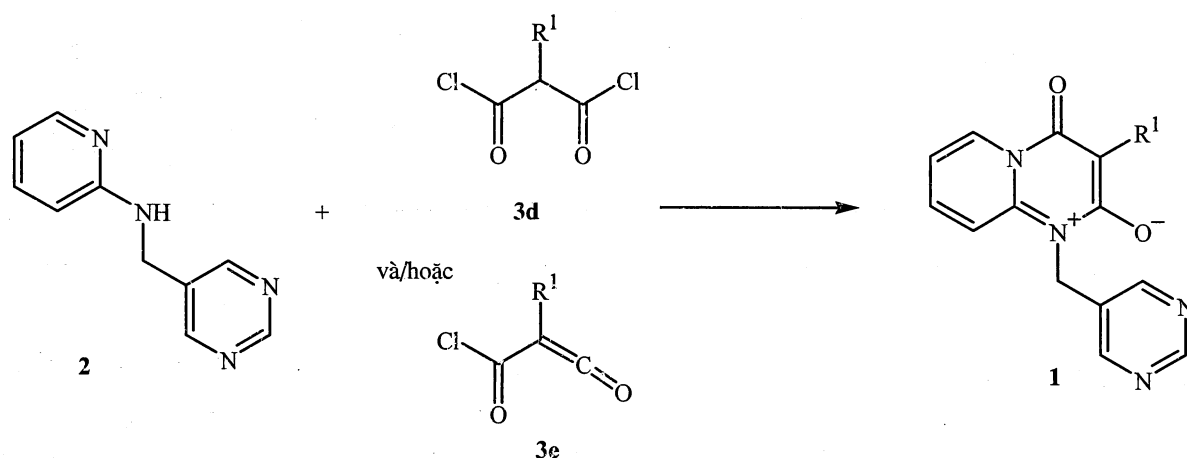
Sơ đồ 3



Các hợp chất có công thức 3c có thể được điều chế, ví dụ, từ các hợp chất có công thức 3a (ví dụ, xem ấn phẩm: *J. Het. Chem.* 1980, 17, 337).

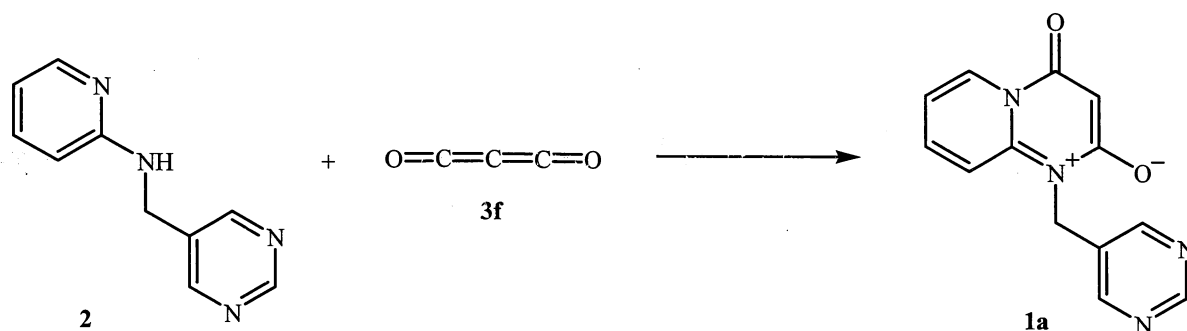
Các hợp chất có công thức 1 cũng có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức 2 với các hợp chất có công thức 3d hoặc 3e, hoặc bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức 2 với hỗn hợp gồm các hợp chất có công thức 3d và 3e như được thể hiện trong sơ đồ 4. Các phản ứng này thường được thực hiện trong dung môi trơ, như diclorometan, và tùy ý với sự có mặt của hai hoặc nhiều đương lượng chất nhận axit ví dụ, xem ấn phẩm: *Zeitschrift fur Naturforschung, Teil B: Anorganische Chemie, Organische Chemie* 1982, 37B(2), 222-233). Các chất nhận axit tiêu biểu bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, trietylamin, *N,N*-điisopropyletylamin, pyridin và các pyridin đã được thế, và các hydroxit, cacbonat và bicarbonat kim loại.

Sơ đồ 4



Các hợp chất có công thức 1a có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức 2 với cacbon suboxit (3f) (ví dụ, xem ấn phẩm *J. Org. Chem.* 1972, 37(9), 1422—1425) như được thể hiện trong sơ đồ 5. Các phản ứng thường được thực hiện trong dung môi trơ như ete và có thể bao gồm việc sử dụng chất xúc tác như AlCl_3 .

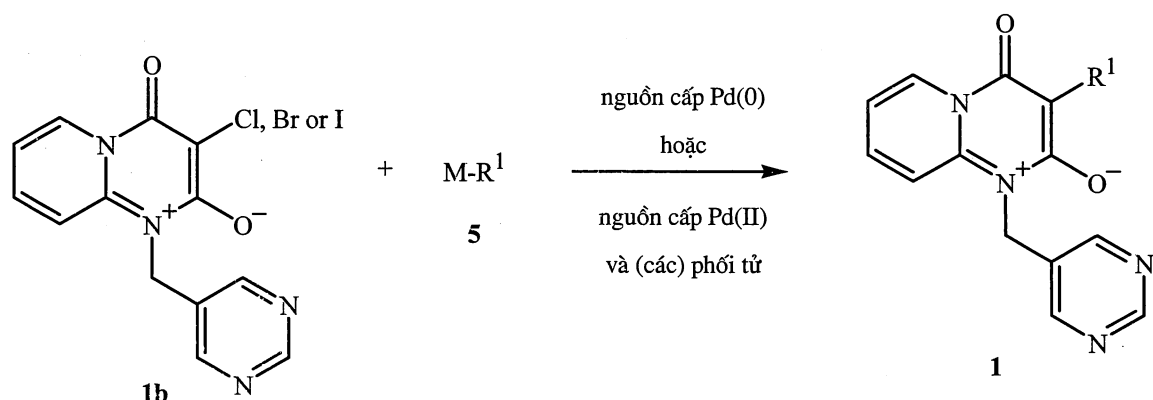
Sơ đồ 5



Các hợp chất có công thức 1 có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 1b và các hợp chất có công thức 5 trong đó M có R^1 tạo ra axit boronic, este của axit

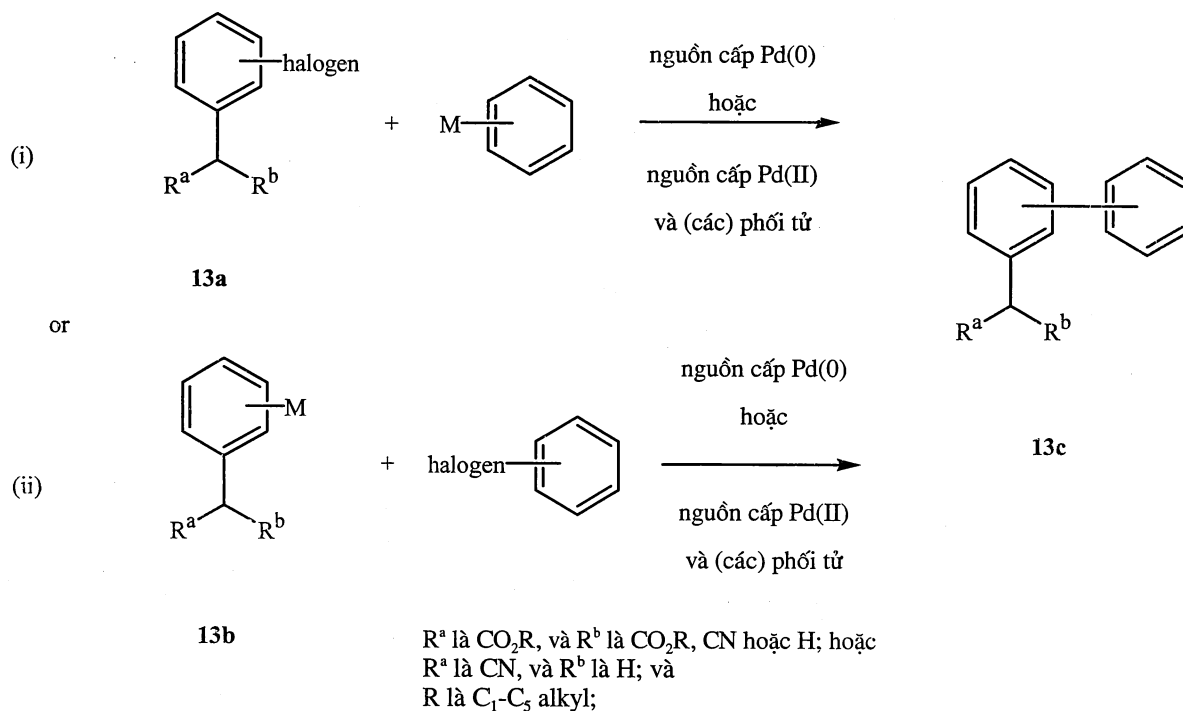
boronic hoặc muối trifloborat, hoặc M là trialkylstannyl hoặc kẽm, như được thể hiện trong sơ đồ 6.

Sơ đồ 6



Theo cách tương tự, các hợp chất có công thức 1 trong đó R¹ có hai hệ nhân hoặc nhân thơm được liên kết trực tiếp (ví dụ, nhân phenyl được liên kết vào nhân phenyl thứ hai, nhân phenyl được liên kết vào nhân pyridinyl, hoặc nhân pyridinyl được liên kết vào nhân pyridinyl thứ hai) có thể được điều chế bằng cách liên hợp được xúc tác bằng paladi hai hệ nhân hoặc nhân thơm đã được thể thích hợp. Các phản ứng liên hợp được xúc tác bởi paladi này giữa clorua, bromua hoặc iodua thơm và axit hoặc este boronic thơm, hoặc chất phản ứng thiếc hoặc kẽm thơm, là đã biết rõ và đã được mô tả rộng rãi trong lĩnh vực kỹ thuật này. Ví dụ, xem Sơ đồ 6a, trong đó hợp chất có công thức 13a hoặc 13b được ngẫu hợp với nhân phenyl đã được thể thích hợp để tạo ra hợp chất biphenyl có công thức 13c. M là như được định nghĩa ở trên cho Sơ đồ 6.

Sơ đồ 6a



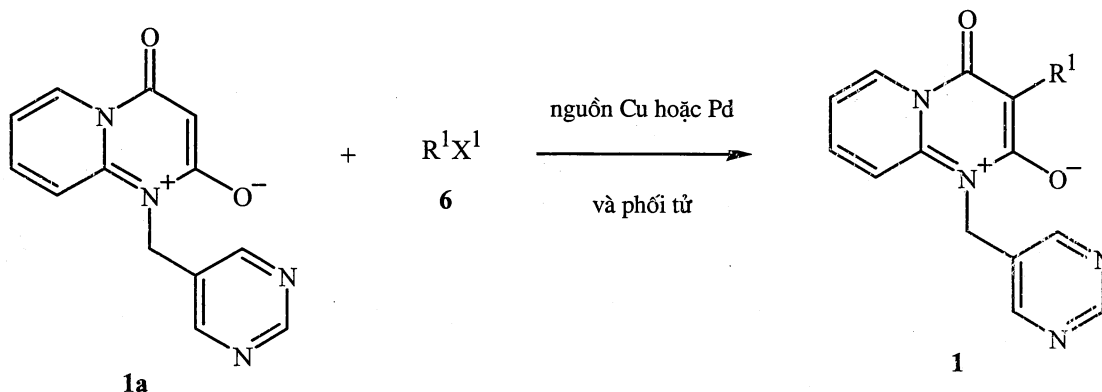
Các phản ứng liên hợp này thường được thực hiện với sự có mặt của chất xúc tác paladi và bazơ tùy ý dưới môi trường trơ. Các chất xúc tác paladi được sử dụng cho các phản ứng liên hợp này thường chứa paladi ở trạng thái oxy hóa thông thường bằng 0 (tức là $\text{Pd}(0)$) hoặc bằng 2 (tức là $\text{Pd}(\text{II})$). Khoảng rộng của các hợp chất chứa paladi như vậy và các phức chất là hữu ích làm các chất xúc tác cho các phản ứng này. Các ví dụ về các hợp chất chứa paladi và các phức chất hữu ích trong các phương pháp này bao gồm $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (bis(triphenylphosphin)paladi (II) điclorua), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (tetrakis(triphenylphosphin)paladi(0)), $\text{Pd}(\text{C}_5\text{H}_7\text{O}_2)_2$ (paladi(II) axetylaxetonat), $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (tris(đibenzylidenaxeton)đipaladi(0)), và [1,1'-bis(điphenylphosphino)-feroxen]đicloropaladi(II). Các phương pháp liên hợp này nói chung được thực hiện trong pha lỏng, và do đó chất xúc tác paladi ưu tiên là có tính hòa tan tốt trong pha lỏng. Các dung môi hữu ích bao gồm, ví dụ, nước, các ete như 1,2-đimetoxyetan, các amit như *N,N*-đimetylaxetamit, và các hydrocacbon thơm không được halogen hóa như toluen.

Các phương pháp liên hợp có thể được thực hiện trong một khoảng nhiệt độ rộng, nằm trong khoảng từ 25°C đến 200°C . Đáng lưu ý là nhiệt độ nằm trong khoảng từ 60°C đến 150°C , thường cho phép thời gian phản ứng nhanh chóng và tạo hiệu suất cao. Các quy trình và phương pháp chung để liên hợp Stille, Negishi và Suzuki với các aryl iodua, bromua hoặc clorua và aryl tin, aryl kẽm hoặc axit aryl boronic một cách tương ứng là đã được biết rõ trong các tài liệu chuyên ngành; ví dụ, xem ấn phẩm: E. Negishi, *Handbook*

of *Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis*, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York.

Các hợp chất có công thức 1d có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 1a (tức là, công thức 1 trong đó R^1 là H) và các hợp chất có công thức 6 trong đó X^1 là Cl, Br hoặc I (tốt hơn là Br hoặc I) như được thể hiện trong sơ đồ 7.

Sơ đồ 7



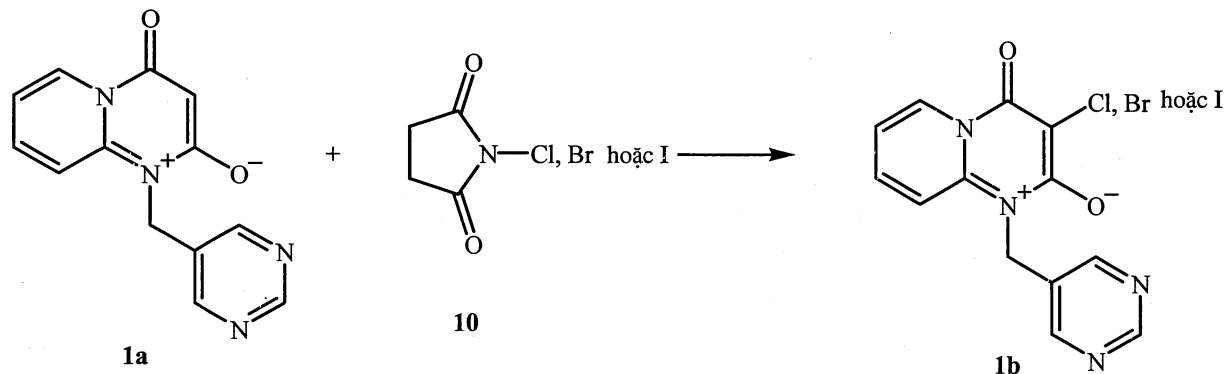
Các phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của chất xúc tác đồng hoặc paladi, tốt hơn là trong môi trường trơ. Các chất xúc tác đồng được sử dụng cho phương pháp này thường chứa đồng ở dạng kim loại (ví dụ, dưới dạng bột) hoặc đồng ở trạng thái oxy hóa bình thường bằng 1 (tức là Cu(I)). Các ví dụ về các hợp chất chứa đồng hữu ích làm các chất xúc tác trong phương pháp theo Sơ đồ 7 bao gồm Cu, CuI, CuBr, CuCl. Các ví dụ về các hợp chất chứa paladi hữu ích làm các chất xúc tác trong phương pháp theo Sơ đồ 7 bao gồm $Pd(OAc)_2$. Các dung môi hữu ích cho phương pháp theo Sơ đồ 7 bao gồm, ví dụ, các ete như 1,4-dioxan, các amit như *N,N*-dimetylxetamit và dimetyl sulfoxit.

Phương pháp theo Sơ đồ 7 có thể được thực hiện trong một khoảng nhiệt độ rộng từ 25°C đến 200°C. Lưu ý là nhiệt độ nằm trong khoảng từ 40°C đến 150°C. Phương pháp theo Sơ đồ 7 có thể được thực hiện với sự có mặt của một phối tử. Khoảng rộng của các hợp chất liên kết đồng hữu ích làm các phối tử cho phương pháp này. Các ví dụ về các phối tử hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, 1,10-phenantrolin, *N,N*-dimetyletylenđiamin, L-prolin và axit 2-picolinic. Các quy trình và phương pháp chung cho các phản ứng liên hợp kiểu Ullmann có xúc tác đồng là đã được biết rõ trong các tài liệu chuyên ngành; ví dụ, xem trong ấn phẩm: Xie, Ma, et al. *Org. Lett.* 2005, 7, 4693-4695.

Các hợp chất có công thức 1b có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức 1a bằng cách sử dụng quá trình halogen hoá, ví dụ, brom lỏng hoặc *N*-halosuccinimit có công thức 10 như được thể hiện trong sơ đồ 11. Thông thường, phản ứng được thực hiện

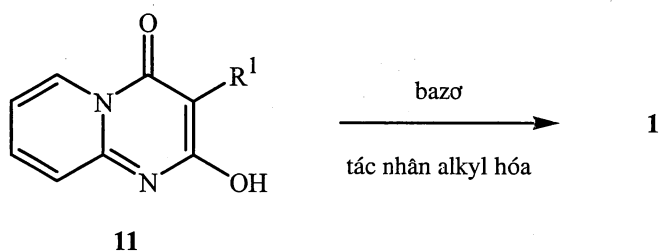
trong dung môi trơ, phổ biến hơn là dung môi được halogen hóa như metylen clorua hoặc 1,2-dicloetan. Phản ứng thường được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0°C đến 80°C, phổ biến hơn là ở nhiệt độ môi trường.

Sơ đồ 11



Các hợp chất có công thức 1 cũng có thể được điều chế bằng cách alkyl hóa các hợp chất có công thức 11 bằng cách sử dụng chất alkyl hoá đã được thể và bazơ thích hợp như kali cacbonat như được thể hiện trong sơ đồ 12 (ví dụ, xem ấn phẩm Kappe, T. et al. *Monatshefte fur Chemie* 1971, 102, 412-424 và Urban, M. G.; Arnold, W. *Helvetica Chimica Acta* 1970, 53, 905-922). Các chất alkyl hoá bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, alkyl clorua, bromua, iodua và các este sulfonat. Nhiều bazơ và dung môi khác nhau có thể được sử dụng trong phương pháp như được thể hiện trong sơ đồ 12, và các bazơ và dung môi này là đã biết trong lĩnh vực này.

Sơ đồ 12

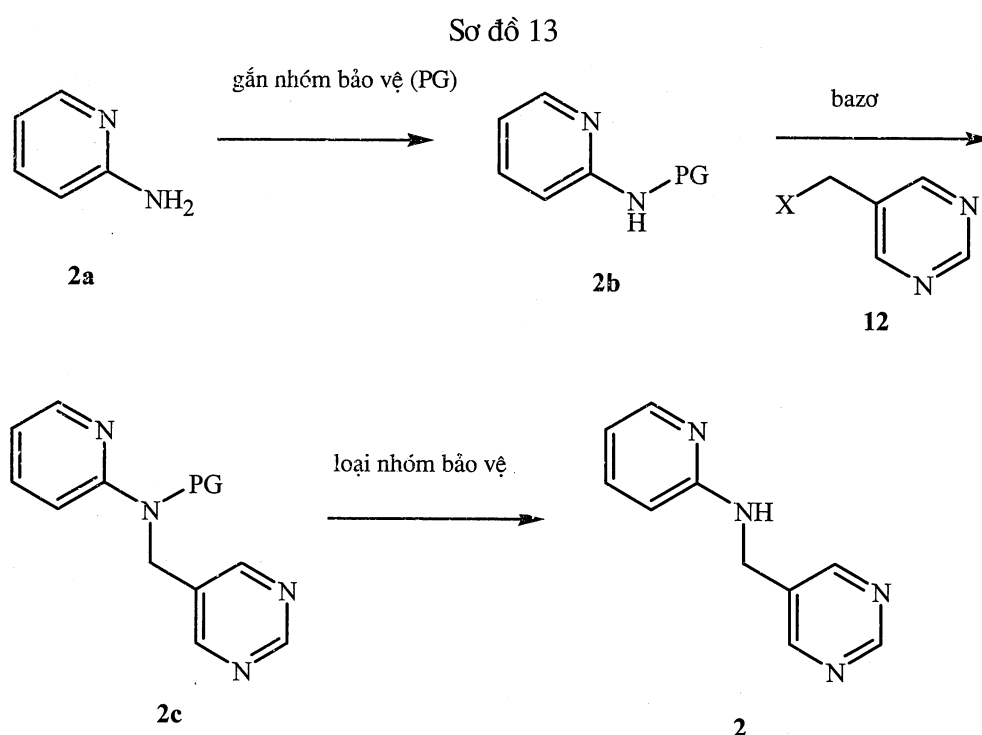


Các hợp chất có công thức 11 có thể được điều chế từ 2-aminopyridin bằng phương pháp tương tự như các phương pháp được thể hiện trong sơ đồ từ 1 đến 5.

Như được thể hiện trên các sơ đồ 1—5, hợp chất có công thức 2 là hợp chất trung gian quan trọng hữu ích để điều chế các hợp chất có công thức 1. Hợp chất có công thức 2 là một phương án theo sáng chế. Phương án khác theo sáng chế là sử dụng hợp chất có công thức 2 để điều chế các hợp chất có công thức 1.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng hợp chất có công thức 2 cũng có thể được sử dụng dưới dạng muối cộng axit của nó (ví dụ, muối clohydric hoặc muối của axit axetic) trong phương pháp liên hợp như được thể hiện trên các sơ đồ 1—5.

Phương pháp hữu ích cụ thể để điều chế hợp chất có công thức 2 được thể hiện trên sơ đồ 13. Trong phương pháp trên sơ đồ 13, 2-aminopyridin (2a) được bảo vệ bằng các nhóm bảo vệ thích hợp như, nhưng không chỉ giới hạn ở, *tert*-butoxycarbonyl, axetyl hoặc formyl để tạo ra sản phẩm trung gian có công thức 2b trong đó PG là nhóm bảo vệ. Sau đó, hợp chất có công thức 2b được alkyl hoá bằng hợp chất có công thức 12 (trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen) để tạo ra hợp chất trung gian có công thức 2c. Nhóm bảo vệ được loại bỏ để tạo ra hợp chất có công thức 2. Các điều kiện để tạo ra và loại bỏ nhóm bảo vệ trên nhóm chức amin là đã biết trong tài liệu: (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991).

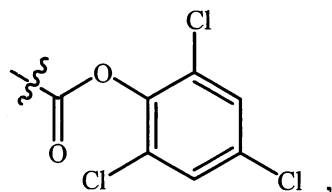


Phương pháp khác để điều chế hợp chất có công thức 2 là amin hóa khử hợp chất cacbonyl thích hợp. Phương pháp này được thể hiện ở các bước A và B trong ví dụ tổng hợp 1.

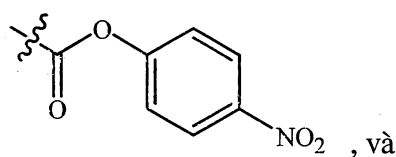
Phương pháp khác nữa để điều chế hợp chất có công thức 2 là phản ứng của amin thích hợp với hợp chất đã được thế bằng halogen tương tự với hợp chất có công thức 2a (tức là công thức 2a trong đó nhóm amin được thay bằng halogen) với sự có mặt của chất xúc tác đồng hoặc paladi.

Các hợp chất có công thức 1 có các phân tử thế R^1 khác so với các phân tử thế được lưu ý trên các sơ đồ từ 1 đến 13 có thể được điều chế bằng các phương pháp thông thường đã biết trong lĩnh vực tổng hợp hoá hữu cơ, bao gồm phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trên các sơ đồ từ 1 đến 13.

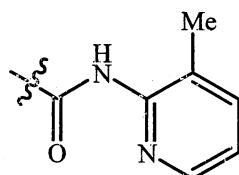
Ví dụ về các sản phẩm trung gian hữu ích để điều chế các hợp chất theo sáng chế được thể hiện trong các bảng từ I-1 đến I-43. Các từ viết tắt dưới đây được sử dụng trong các bảng như sau: Me là methyl, Et là ethyl, Pr là propyl, Ph là phenyl, C(O)O(2,4,6-triclophenyl) là



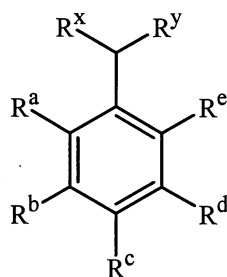
C(O)O(4-nitrophenyl) là



C(O)(3-methyl-2-pyridinylamino) là



Bảng I-1



R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b, R^c, R^d và R^e là H

<u>R^a</u>	<u>R^a</u>	<u>R^a</u>	<u>R^a</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-methyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a, R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a, R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là F; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là F; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là F; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là F; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Cl; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Cl; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Cl; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Cl; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là OMe; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là OMe; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là OMe; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là OMe; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Me; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Me; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Me; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là Me; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^d là Cl; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^d là CF₃; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là Br; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là OCF₃; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là OMe; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là F; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là CN; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là Me; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^b là I; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a và R^b là F; R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a là F; R^b là Cl; R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-diflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diclophenyl	2,5-diclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-diflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^c là OMe; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^c là Me; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^c là F; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^c là Cl; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

R^x là C(O)OH; R^y là H; R^a và R^e là F; R^c và R^d là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-xyanophenyl
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-flo-4-clophenyl
Cl	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-metyl-4-clophenyl
Br	OCHF ₂	4-bromophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
I	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
xyano	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
Et	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl

Pr	phenyl	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-bromo-5-flophenyl	2,5-điflophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	3-flo-4-clophenyl	2-flo-5-clophenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điclophenyl	2,5-điclophenyl
OEt	4-flophenyl	2,4-điflophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
			2-clo-5-(CF ₃)phenyl

Bảng I-2

Bảng I-2 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OMe.

Bảng I-3

Bảng I-3 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OEt.

Bảng I-4

Bảng I-4 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OPh.

Bảng I-5

Bảng I-5 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OC(CH₃)₃.

Bảng I-6

Bảng I-6 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)O(2,4,6-triclophenyl).

Bảng I-7

Bảng I-7 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)O(4-nitrophenyl).

Bảng I-8

Bảng I-8 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OH và R^Y là C(O)OH.

Bảng I-9

Bảng I-9 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là C(O)OH và R^Y là C(O)OMe.

Bảng I-10

Bảng I-10 được xây dựng giống như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OH$ và R^Y là $C(O)OEt$.

Bảng I-11

Bảng I-11 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OH$ và R^Y là $C(O)OC(CH_3)_3$.

Bảng I-12

Bảng I-12 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OH$ và R^Y là $C(O)OPh$.

Bảng I-13

Bảng I-13 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OH$ và R^Y là $C(O)O(2,4,6\text{-}trichlorophenyl)$.

Bảng I-14

Bảng I-14 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OH$ và R^Y là $C(O)O(4\text{-}nitrophenyl)$.

Bảng I-15

Bảng I-15 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)OMe$.

Bảng I-16

Bảng I-16 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)OEt$.

Bảng I-17

Bảng I-17 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)OC(CH_3)_3$.

Bảng I-18

Bảng I-18 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)OPh$.

Bảng I-19

Bảng I-19 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)O(2,4,6\text{-trichlorophenyl})$.

Bảng I-20

Bảng I-20 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OPh$ và R^Y là $C(O)O(4\text{-nitrophenyl})$.

Bảng I-21

Bảng I-21 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)Cl$ và R^Y là $C(O)Cl$.

Bảng I-22

Bảng I-22 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OMe$ và R^Y là $C(O)OMe$.

Bảng I-23

Bảng I-23 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OEt$ và R^Y là $C(O)OEt$.

Bảng I-24

Bảng I-24 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)OC(CH_3)_3$ và R^Y là $C(O)OC(CH_3)_3$.

Bảng I-25

Bảng I-25 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)O(2,4,6\text{-trichlorophenyl})$ và R^Y là $C(O)O(2,4,6\text{-trichlorophenyl})$.

Bảng I-26

Bảng I-26 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)O(4\text{-nitrophenyl})$ và R^Y là $C(O)O(4\text{-nitrophenyl})$.

Bảng I-27

Bảng I-27 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-methyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)OH$.

Bảng I-28

Bảng I-28 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)OMe$.

Bảng I-29

Bảng I-29 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)OEt$.

Bảng I-30

Bảng I-30 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)OPh$.

Bảng I-31

Bảng I-31 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)O(2,4,6\text{-trichlorophenyl})$.

Bảng I-32

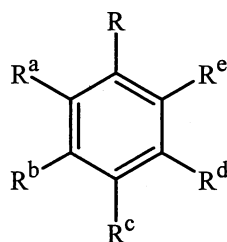
Bảng I-32 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)O(4\text{-nitrophenyl})$.

Bảng I-33

Bảng I-33 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ R^X là $C(O)(3\text{-metyl-2-pyridinylamino})$ và R^Y là $C(O)OC(CH_3)_3$.

Bảng I-34

Bảng I-34 tương tự như bảng I-1, ngoại trừ cấu trúc hóa học theo tựa đề của bảng I-1 được thay bằng cấu trúc dưới đây, và R là Cl . Các nhóm R^X và R^Y được tìm thấy trong bảng I-1 không liên quan tới bảng I-34, vì gốc $CH(R^X)(R^Y)$ trong cấu trúc nêu trong bảng I-1 được thay bằng nhóm R trong cấu trúc nêu trong bảng I-34.



Ví dụ, hợp chất đầu tiên nêu trong bảng I-34 có cấu trúc được thể hiện ngay phía trên trong đó R^a, R^b, R^c, R^d và R^e là H, và R là Cl.

Bảng I-35

Bảng I-35 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là Br.

Bảng I-36

Bảng I-36 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là I.

Bảng I-37

Bảng I-37 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là CH₂OH.

Bảng I-38

Bảng I-38 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là CH₂CN.

Bảng I-39

Bảng I-39 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là CH₂Cl.

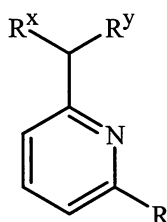
Bảng I-40

Bảng I-40 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là CH(CN)CO₂Me.

Bảng I-41

Bảng I-41 tương tự như bảng I-34, ngoại trừ R là CH(CN)CO₂Et.

Bảng I-42



R là CF₃

R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là H

R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là Cl

R^x

H
H

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OMe
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OMe
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH

R^y

C(O)OH
C(O)OMe

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là Br

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là I

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là NH₂

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là 2-clo-4-(triflometyl)phenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R là 2-flo-5-(triflometyl)phenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
H	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R là 2-clo-4-xyanophenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
H	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OEt	C(O)OPh
H	C(O)OH
H	C(O)OMe
H	C(O)OEt
H	C(O)OPh
H	C(O)OC(CH ₃) ₃

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OH	C(O)OH
C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OEt	C(O)OPh
H	C(O)OH
H	C(O)OMe
H	C(O)OEt
H	C(O)OPh
H	C(O)OC(CH ₃) ₃

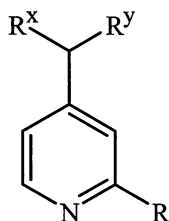
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OH	C(O)OH
C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OEt	C(O)OEt

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là 2-flo-4-xyanophenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

Bảng I-43



R là H

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh

R^x

C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là CF₃R^x

H
 H
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là F

R^x

H
 H
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OMe

R^y

C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)OPh
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)OPh
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(4-nitrophenyl)
 C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
 C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^x

C(O)OH
 C(O)Cl
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 H
 H
 H
 H
 H

R^y

C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)Cl
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)Cl
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 H
 H
 H
 H

R^y

C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)Cl
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)OPh
 C(O)OPh
 C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)OH
 C(O)Cl

R^y

C(O)OH
 C(O)OMe
 C(O)OEt
 C(O)OPh
 C(O)OC(CH₃)₃
 C(O)Cl

R^x

C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là Cl

R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là Br

R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh

R^y

C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)

R^x

C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OMe
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OMe
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt

R^y

C(O)OH
C(O)OMe
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(O)OMe
C(O)OEt

R^x

C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là I

R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)

R là NH₂R^x

H
H
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OPh

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)OPh
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^y

C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)
C(O)O(4-nitrophenyl)
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)
C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)

R^x

C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(OMe)
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(OMe)
C(O)OEt
H
H
H
H
H

R^y

C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^x

C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)OH
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

R^y

C(O)OH
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃
C(O)Cl
C(OMe)
C(O)OEt
C(O)OPh
C(O)OPh
C(O)OC(CH₃)₃

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là 2-clo-4-(triflometyl)phenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R là 2-flo-5-(triflometyl)phenyl

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R là 2-clo-4-xyanophenyl			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R là 2-flo-4-xyanophenyl			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)O(4-nitrophenyl)	H	C(O)OH
C(O)O(4-nitrophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OMe

R^X	R^Y	R^X	R^Y
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-triclophenyl)	C(O)(3-metyl-2-pyridinylamino)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

Đã biết rằng một số chất phản ứng và các điều kiện phản ứng nêu trên để điều chế các hợp chất có công thức 1 có thể không tương thích với một số chức năng có trong các sản phẩm trung gian. Trong một số trường hợp, sự kết hợp thứ tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc sự hoán chuyển nhóm chức trong quá trình tổng hợp sẽ hỗ trợ tạo ra các sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ sẽ là hiển nhiên đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật tổng hợp hoá học (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ hiểu rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng đã định như được mô tả trong sơ đồ riêng lẻ bất kỳ, có thể cần thực hiện thêm các bước tổng hợp thông thường không được mô tả chi tiết để hoàn thành quy trình tổng hợp các hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ hiểu rằng có thể cần thực hiện kết hợp các bước được minh hoạ trong các sơ đồ nêu trên theo một thứ tự ngoài thứ tự được đưa ra theo bộ cụ thể để điều chế các hợp chất có công thức 1.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ hiểu rằng các hợp chất có công thức 1 và các hợp chất trung gian theo sáng chế có thể được đưa vào các phản ứng ái điện tử, ái nhân, gốc, hữu cơ-kim loại, oxy hoá, và khử khác nhau để bổ sung nhóm thế hoặc cải biến phần tử thế đang tồn tại.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Không cần đưa ra chi tiết hơn, bằng cách sử dụng phần mô tả nêu trên tin rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng sáng chế ở mức tối đa. Do đó, các ví dụ tổng hợp sau được hiểu là chỉ có ý nghĩa minh hoạ, và không làm giới hạn phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Các bước trong ví dụ tổng hợp sau minh hoạ quy trình cho từng bước trong quá trình biến đổi tổng hợp chung và nguyên liệu ban đầu trong từng bước có thể không cần thiết được điều chế bằng các quy trình điều chế cụ thể sử dụng toàn bộ quy trình được mô tả trong các ví dụ hoặc Bước khác. Nhiệt độ môi trường hoặc nhiệt độ trong phòng được xác định nằm trong khoảng từ 20-25°C. Tỷ lệ phần trăm tính theo khối lượng ngoại trừ hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc, có chỉ dẫn khác được chỉ ra cụ thể. Phần và phần trăm đối với hỗn hợp dung môi sắc ký tính theo thể tích,

trừ khi có chỉ dẫn khác được chỉ ra cụ thể. Phổ ^1H NMR được tính theo ppm từ tetrametylsilan; “s” nghĩa là vạch đơn, “d” nghĩa là vạch đôi, “dd” nghĩa là cặp vạch đôi, “ddd” nghĩa là vạch đôi của cặp vạch đôi, “t” nghĩa là vạch ba, “m” nghĩa là đa vạch và “br s” nghĩa là vạch đơn rộng. Số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong bảng mục lục A.

Ví dụ tổng hợp 1

Điều chế muối nội 2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (hợp chất 3)

Bước A: Điều chế *N*-(5-pyrimidinylmetylen)-2-pyridinamin

Dung dịch chứa 2-aminopyridin (11,314g, 120,3mmol) và pyrimidin-5-carboxaldehyt (14,0g, 129,6mmol) trong clorofom (300mL) được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 15 phút. Sau đó, các chất bay hơi được loại bỏ dưới áp suất giảm (1 giờ ở 75°C) để tạo ra chất rắn màu vàng. Chất rắn thô được hoà tan trong clorofom (300mL), và dung dịch này được khuấy trong 15 phút. Sau đó, các chất bay hơi được loại bỏ dưới áp suất giảm (1 giờ ở 75°C) để tạo ra chất rắn màu vàng. Chất rắn thô được hòa tan lại trong clorofom (300mL), dung dịch này được khuấy trong 15 phút, và các chất bay hơi được loại bỏ dưới áp suất giảm (1 giờ ở 85°C) để tạo ra chất rắn màu vàng. Chất rắn này được làm khô trong tủ sấy chân không qua đêm ở 80°C để tạo ra 22,090g (99,8%) hợp chất nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 9,26—9,32 (m, 4H), 8,52 (d, 1H), 7,82 (t, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,26 (t, 1H).

Bước B: Điều chế *N*-[(5-pyrimidinyl)metyl]-2-pyridinamin

Natri borohyđrua 98% (2,868g, 75,5mmol) ở dạng bột được bổ sung vào dung dịch chứa metanol (80mL) và tetrahydrofuran (400mL), và hỗn hợp này được khuấy mạnh trong 5 phút. Sản phẩm thu được ở bước A (13,9g, 75,5mmol) được hoà tan vào tetrahydrofuran (400mL), và dung dịch thu được được bổ sung từng giọt vào huyền phù natri borohyđrua với tốc độ không đổi khoảng 33mL/phút. Cảm quan củahỗn hợp phản ứng thay đổi từ huyền phù màu vàng nhạt hơi đục sang dung dịch trong suốt màu đỏ. Quá trình phản ứng được kiểm tra bằng phương pháp sắc ký bản mỏng bằng dung môi 10% metanol:40% điclotetan:50% toluen. Khi hoàn thành phản ứng, axit axetic (3mL) được bổ sung từng giọt, và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 5 phút. Axit axetic (2mL) và nước (30mL) được bổ sung, hỗn hợp phản ứng được khuấy nhanh, và tiếp đó etyl axetat được bổ sung (500mL). Hỗn hợp phản ứng được rửa bằng dung dịch nước natri hydroxit

1N (300mL), được làm khô bằng magie sulfat, được lọc, và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm ở 50°C. Dầu thô thu được được hoà tan trong diclometan (50mL), và dung dịch được rửa giải bằng cột silicagel (100g) chứa etyl axetat (3 L). Dịch rửa giải được cô thành dầu màu vàng-da cam được kết tinh từ từ để tạo ra 8,909 g (63,4%) sản phẩm nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt. ^1H NMR (CDCl_3) δ 9,12 (s, 1H), 8,76 (s, 2H), 8,10 (d, 1H), 7,42 (t, 1H), 6,64 (t, 1H), 6,42 (d, 1H), 4,99 (br s, NH), 4,61 (d, 2H).

Bước C: Điều chế 1,3-đimetyl 2-[3-(triflometyl)phenyl]propandioat

Dioxan (100mL) được sục bằng khí nitơ trong 10 phút. Phenanthrolen (1,0g) và đồng (I) iotua (1,0g) được bổ sung vào dioxan này, huyền phù được khuấy trong môi trường nitơ trong 5 phút, và tiếp đó xesi cacbonat (18,72g, 57,45mmol), đimetyl malonat (5,46g, 50,6mmol), và 1-iodo-3-(triflometyl)benzen (12,5g, 46,0mmol) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt tới nhiệt độ hồi lưu trong 18 giờ và tiếp đó được làm nguội đến nhiệt độ trong phòng. Dung dịch nước HCl 1N được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng, các lớp được tách riêng, và lớp nước được chiết bằng etyl axetat (3 x 100mL). Lớp hữu cơ gom lại được làm khô trên magie sulfat và được lọc. Phần hỗ trợ lọc chứa tảo cát Xelit[®] (5g) được bổ sung vào thiết bị lọc, và huyền phù thu được được cô dưới áp suất giảm ở 50°C để tạo ra chất rắn chứa sản phẩm thô được hấp phụ lên Xelit[®]. Chất rắn này được tinh chế bằng sắc ký silica gel với gradien nằm trong khoảng từ 100% hexan đến 25% etyl axetat trong hexan để tạo ra 7,36g (58,0%) sản phẩm nêu ở đề mục. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,59—7,65 (m, 3H), 7,49 (t, 1H), 4,70 (s, 1H), 3,76 (s, 6H).

Bước D: Điều chế bis(2,4,6-triclophenyl) 2-[3-(triflometyl)phenyl]propandioat

Sản phẩm thu được ở bước C được bổ sung vào dung dịch chứa NaOH (25g) trong nước (75mL), và hỗn hợp phản ứng được khuấy mạnh trong môi trường nitơ ở 60°C trong 8 phút. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được bổ sung vào băng (100 g), và dung dịch nước HCl 6N được bổ sung cho tới khi đạt tới độ pH bằng 1. Dung dịch này được chiết bằng etyl axetat (3 x 100mL), và phần chiết hữu cơ gom lại được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và được cô dưới áp suất giảm. Diclometan (200mL) được bổ sung vào chất rắn màu trắng thu được, sau đó bổ sung oxalyl clorua (5mL) và *N,N*-đimetylformamit (0,5mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ, sau đó bổ sung 2,4,6-triclophenol (10,528g, 53,32mmol). Sau khi khuấy qua đêm ở nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm. Metanol được bổ sung vào chất rắn thu được, và chất rắn này được kết tủa từ từ từ dung dịch. Chất rắn được thu lại bằng cách lọc để tạo ra

8,161g (50,43%) sản phẩm nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn. ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,91 (s, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,59 (t, 1H), 7,37 (s, 4H), 5,38 (s, 1H).

Bước E: Điều chế muối nội 2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)-phenyl]-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin

Sản phẩm thu được ở bước B (3,31g, 17,8mmol) được bổ sung vào sản phẩm thu được ở bước D (8,16 g, 13,4mmol) trong toluen (100mL). Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt tới 110°C trong 6 giờ, trong thời gian này chất rắn màu vàng được kết tủa khỏi dung dịch. Hỗn hợp phản ứng được cô với sự có mặt của Xelit[®], và sản phẩm thô được hấp phụ lên Xelit[®] được tinh chế bằng sắc ký silica gel với gradien nằm trong khoảng từ 100% ethyl axetat đến 25% metanol trong ethyl axetat để tạo ra 7,36g (58,0%) sản phẩm nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế.

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế muối nội 3-(4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin (hợp chất 18)

Bước A: Điều chế 1,3-bis(1,1-đimetyletyl) 2-(3-iodo-5-metylphenyl)propandioat

Đồng ioduua (332 mg, 1,74mmol), xesi cacbonat (5,6g, 17,4mmol), và axit picolinic (429mg, 3,49mmol) được bổ sung vào bình cầu khô trong môi trường nitơ. Dung dịch chứa 3,5-điiodotoluen (3g, 8,7mmol) trong đioxan (10mL) được bổ sung, sau đó bổ sung di-*tert*-butyl malonat (1,3mL, 8,7mmol). Không khí bên trong bình cầu được loại bỏ trong chân không và thay bằng khí nitơ; quy trình này được lặp lại tổng cộng 3 lần. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được gia nhiệt đến 80°C và được khuấy trong 24 giờ. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được làm nguội đến nhiệt độ phòng, được ngừng lại bằng dung dịch nước amoni clorua bão hòa (50mL), và được chiết hai lần bằng diethyl ete (50mL). Các lớp hữu cơ được gộp lại, được làm khô trên MgSO_4 , và được cô dưới áp suất giảm. Chất rắn thu được được tinh chế bằng sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng ethyl axetat trong hexan để tạo ra sản phẩm nêu ở đề mục dưới dạng dầu màu da cam (0,62 g). ^1H NMR (CDCl_3) δ 7,50 (dd 2H), 7,15 (s, 1H), 4,30 (s, 1H), 2,30 (s, 3H), 1,47 (m, 18H).

Bước B: Điều chế 1,3-bis(1,1-đimetyletyl)2-(4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)-propandioat

Hỗn hợp chứa 1,3-bis(1,1-đimetyletyl) 2-(3-iodo-5-metylphenyl)propandioat (sản phẩm thu được ở bước A, 320mg, 0,74mmol), 4-xyano-2-metylaxit phenylboronic

(178mg, 1,11mmol), natri cacbonat (78mg, 0,74mmol), bis(triphenylphosphin)paladi(II) điclorua (52mg, 0,074mmol), đioxan (5mL), và nước (1mL) được gia nhiệt tới 80°C và được khuấy trong 20 phút. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được làm nguội đến nhiệt độ trong phòng, và được lọc qua cột silicagel bằng 20% etyl axetat trong hexan. Nồng độ dịch rửa giải dưới áp suất giảm tạo ra dầu màu nâu (430mg) chứa sản phẩm thô, được sử dụng trong bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

^1H NMR (CDCl_3) δ 7,70-7,10 (m, 6H), 4,436 (s, 1H), 2,402 (s, 3H), 2,289 (s, 3H), 1,469 (s, 18H).

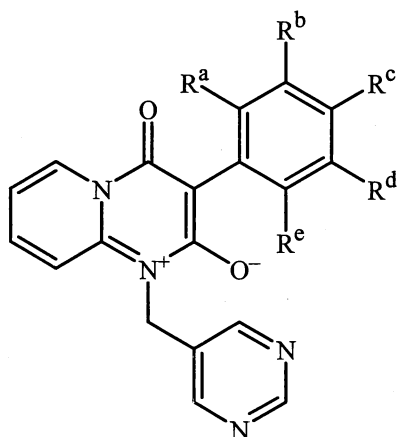
Bước C: Điều chế muối nội 3-(4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)-2-hydroxy-4-oxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin

Hỗn hợp chứa *N*-[(5-pyrimidinyl)metyl]-2-pyridinamin (65mg, 0,34mmol) và 1,3-bis(1,1-đimetyletyl) 2-(4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)propandioat (sản phẩm thu được ở bước B, 120 mg, 0,28mmol) in *p*-xymen (2mL) và 1,2,3,4-tetrahydronaphtalen (tức là tetralin, 1mL) được gia nhiệt tới 178°C và được khuấy trong 1,5 giờ. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được làm nguội đến nhiệt độ trong phòng, và được tinh chế bằng sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng 20% metanol trong etyl axetat để tạo ra 40mg (25%) hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế, ở dạng chất rắn màu vàng.

^1H NMR ($(\text{CD}_3)_2\text{CO}$) δ 9,5 (dd, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,95 (d, 2H), 8,35 (m, 1H), 7,95 (dd, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,0 (d, 1H), 5,75 (s, 2H), 2,06 (d, 6H).

Bằng các quy trình được nêu trong phần mô tả cùng với phương pháp đã biết trong lĩnh vực này, các hợp chất trong các bảng 1 và 2 dưới đây có thể được điều chế. Các từ viết tắt dưới đây được sử dụng trong bảng 1: Me có nghĩa là metyl, Et có nghĩa là etyl, Pr có nghĩa là propyl và Bu có nghĩa là butyl.

Bảng 1



R^b, R^c, R^d và R^e là H

R^a	R^a	R^a	R^a
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a, R^c, R^d và R^e là H

R^b	R^b	R^b	R^b
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl

<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a, R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là F; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl

CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	
R ^a là F; R ^b , R ^d và R ^e là H			
<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	
R ^a là F; R ^b , R ^c và R ^e là H			

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	

O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl

R^a là F; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Cl; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Cl; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Cl; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Cl; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl

F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là OMe; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là OMe; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl

I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là OMe; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là OMe; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl

Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Me; R^c, R^d và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Me; R^b, R^d và R^e là H

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl

CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Me; R^b, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là Me; R^b, R^c và R^d là H

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl

OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^d là Cl; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^d là CF₃; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	

O-*i*-Pr | 4-(CF₃)phenyl | 2-metyl-4-clophenyl
 R^b là Br; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là OCF₃; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là OMe; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
----------------------	----------------------	----------------------	----------------------

H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là F; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là CN; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl

Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là Me; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^b là I; R^a, R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl

Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a và R^b là F; R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a là F; R^b là Cl; R^c và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl

<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^c là OMe; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-diclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-diflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^c là Me; R^a, R^b và R^e là H

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-diclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-diclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-diflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-diclophenyl

CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	
R ^c là F; R ^a , R ^b và R ^e là H			
<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	
R ^c là Cl; R ^a , R ^b và R ^e là H			
<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	

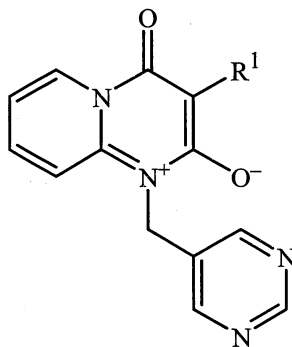
<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	

O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

R^a và R^e là F; R^c và R^d là H

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-xyanophenyl	2-flo-4-(CF ₃)phenyl
F	OCHF ₂	4-bromophenyl	2,4-bis(CF ₃)phenyl
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-clo-3-pyridinyl	2-flo-4-bromophenyl
Br	SCF ₃	6-flo-3-pyridinyl	2-clo-4-flophenyl
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-flophenyl
Me	SCHF ₂	4,6-điclo-3-pyridinyl	2-metyl-4-(CF ₃)phenyl
Et	xyano	2-flo-6-clo-3-pyridinyl	2-clo-4-(CF ₃)phenyl
Pr	phenyl	2,6-điclo-3-pyridinyl	2-(CF ₃)-4-clophenyl
<i>i</i> -Pr	2-flophenyl	2-bromo-5-clo-4-pyridinyl	2,5-điflophenyl
<i>t</i> -Bu	3-clophenyl	3-bromo-5-flophenyl	2-flo-5-(CF ₃)phenyl
CF ₃	3-(CF ₃)phenyl	3-clo-5-flophenyl	2-flo-5-clophenyl
CH ₂ F	3-flophenyl	3-flo-4-clophenyl	2,5-điclophenyl
CHF ₂	3-xyanophenyl	2,4-điclophenyl	2-flo-5-(OCF ₃)phenyl
OMe	3-(OCF ₃)phenyl	2,4-điflophenyl	2-clo-5-(CF ₃)phenyl
OEt	4-flophenyl	2-flo-4-xyanophenyl	
O- <i>n</i> -Pr	4-clophenyl	2-flo-4-clophenyl	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)phenyl	2-metyl-4-clophenyl	

Bảng 2



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-flo-4-pyridinyl	2-clo-4-pyridinyl
2-bromo-4-pyridinyl	2-(triflometyl)-4-pyridinyl
6-flo-2-pyridinyl	6-clo-2-pyridinyl
6-bromo-2-pyridinyl	6-(triflometyl)-2-pyridinyl
4-flo-2-pyridinyl	4-clo-2-pyridinyl
4-bromo-2-pyridinyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl

Hợp chất theo sáng chế thường được sử dụng làm hoạt chất phòng trừ động vật không xương sống trong hỗn hợp, tức là chế phẩm, với ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, dùng làm chất mang. Các thành phần trong hỗn hợp hoặc chế phẩm được chọn phù hợp với các đặc tính lý học của hoạt chất, cách dùng và các yếu tố môi trường như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Các chế phẩm hữu ích bao gồm cả các hỗn hợp lỏng và rắn. Các hỗn hợp lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Loại hỗn hợp lỏng chứa nước nói chung là dạng cô đặc dễ tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương và nhũ tương-huyền phù. Loại hỗn hợp lỏng không chứa nước nói chung là dạng cô đặc dễ nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

Loại hỗn hợp rắn nói chung là dạng bột mịn để rắc khô, bột, hạt, viên tròn nhỏ, viên tròn, viên hình thoi, viên nén, dạng màng bao (bao gồm các lớp phủ hạt) và các dạng tương tự, có thể là dễ phân tán trong nước (“dễ thấm”) hoặc tan trong nước. Các lớp màng và các lớp phủ được tạo ra từ các dung dịch tạo màng hoặc huyền phù dễ chảy đặc biệt hữu ích dùng để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao (vi) nang và còn được tạo thành hỗn dịch hoặc chế phẩm rắn; theo cách khác, toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc “được bao”). Việc bao nang có thể phòng trừ hoặc làm chậm quá trình giải phóng hoạt chất. Hạt có thể nhũ hóa kết hợp được các ưu điểm của cả chế phẩm dạng cô đặc có thể nhũ hóa và chế phẩm dạng hạt khô. Các hỗn hợp đậm đặc được sử dụng chủ yếu làm chất trung gian dùng để pha chế tiếp.

Các chế phẩm phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Các chế phẩm lỏng và rắn như vậy được bào chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước. Các thể tích phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thông thường hơn, nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Các chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Các chế phẩm lỏng và khô có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được đưa lên thực vật hạt làm chất xử lý hạt trước khi gieo trồng để bảo vệ rễ đang phát triển và các bộ phận khác dưới mặt đất của thực vật và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thụ nội hấp.

Các chế phẩm sẽ thường chứa lượng hữu hiệu hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong khoảng gần đúng sau đây để tổng lượng là 100 phần trăm trọng lượng.

	Phần trăm trọng lượng		
	Hoạt chất	Chất pha loãng	Chất hoạt động bề mặt
Hạt, viên nén và bột dễ phân tán trong nước và dễ tan trong nước	0,001—90	0—99,999	0—15
Huyền phù, nhũ tương, dung dịch dầu (kể cả chất cô đặc có thể nhũ hoá)	1—50	40—99	0—50
Bột mịn	1—25	70—99	0—5
Hạt và viên tròn	0,001—95	5—99,999	0—15
Hỗn hợp đậm đặc	90—99	0—10	0—2

Chất pha loãng dạng rắn bao gồm, ví dụ, đất sét như bentonit, montmorillonit, attapulgit và kaolanh, thạch cao, xenluloza, titan đioxit, kẽm oxit, tinh bột, dextrin, đường (ví dụ, lactoza, sucroza), silic oxit, bột talc, mica, đất tảo silic, ure, canxi cacbonat, natri cacbonat và bicarbonat, và natri sulfat. Chất pha loãng dạng rắn thông thường được mô tả trong ấn phẩm: Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Chất pha loãng dạng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-đimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-đimetylformamit), limonen, đimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyrrolidon (ví dụ, *N*-metylpyrrolidinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, đipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen cacbonat, butylen cacbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, các hydrocacbon thơm, các chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, các keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanone, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như các este lactat alkylat hóa, các este đibazơ và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà, như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-ethylhexanol, *n*-octanol, decanol,

rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, lauryl rượu, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, diaxeton rượu và rượu benzylic. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là C_6-C_{22}), như các dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ, dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), các chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ, mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm các axit béo alkylat hóa (ví dụ, được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng chưng cất. Chất pha loãng lỏng thông thường được mô tả trong ấn phẩm: Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Các hỗn hợp rắn và lỏng theo sáng chế thường bao gồm một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt (còn được gọi là tác nhân có hoạt tính bề mặt) thường biến đổi, thường làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Tùy thuộc vào bản chất của các nhóm ưa nước và ưa béo trong phân tử chất hoạt động bề mặt, có thể sử dụng chất hoạt động bề mặt làm các chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hoá hoặc các chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại dưới dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu ích đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: alkoxylat rượu như alkoxylat rượu trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit được etoxylat hóa; triglyxerit alkoxylat hóa như đậu tương được etoxylat hóa, các dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, đinonyl phenol etoxylat và đodexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các polyme khối được điều chế từ etylen oxit hoặc propylen oxit và các polyme khối ngược, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen oxit; các axit béo được etoxylat hóa; các este béo và các dầu được etoxylat hóa; các metyl este được etoxylat hóa; tristyrylphenol được etoxylat hóa (bao gồm các loại được điều chế từ etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este của axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất trên cơ sở lanolin, các este polyetoxylat như các este sorbitan của axit béo được polyetoxylat hoá, các este sorbitol axit béo được polyetoxylat hoá và các este glyxerol của axit béo được polyetoxylat hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme

khối, nhựa peg alkyt (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol của axit béo; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở silicon; và dẫn xuất của đường như các este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysacarit.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và các muối của chúng; rượu carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất diphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc succinic hoặc các anhydrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của alkoxylat rượu, các este phosphat của alkylphenol alkoxylat và các este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở protein; các dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol được etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu được etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N,N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và đodexyl và tridexylbenzen; các sulfonat của naphtalen được ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cắt phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và các dẫn xuất của chúng như các muối dialkyl sulfosuccinat.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và các muối của chúng; rượu carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất diphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc succinic hoặc các anhydrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của alkoxylat rượu, các este phosphat của alkylphenol alkoxylat và các este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở protein; các dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol được etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu được etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N,N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và đodexyl và tridexylbenzen; các sulfonat của naphtalen được ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cắt phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và các dẫn xuất của chúng như các muối dialkyl sulfosuccinat.

Cũng hữu ích đối với các hỗn hợp này là các hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm các ấn phẩm: *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions

published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa các chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm, đã biết đối với các người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực làm chất trợ bào chế (một số trong số chúng có thể được xem là có chức năng làm các chất pha loãng dạng rắn, các chất pha loãng dạng lỏng hoặc các chất hoạt động bề mặt). Các chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (các chất đệm), sự tạo bọt trong quá trình xử lý (các chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), sự lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong dụng cụ chứa (các chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (các chất chống đông), màu sắc (các chất phân tán tạo màu/thuốc nhuộm), sự rửa trôi (các chất tạo màng hoặc các chất dính), sự bay hơi (các chất làm chậm bay hơi), và các chế phẩm khác tương tự. Các chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat, các rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và các sáp. Ví dụ về chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm các chất được liệt kê trong ấn phẩm: *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và Bắc Mỹ do McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. công bố; và công bố đơn PCT số WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được kết hợp trong các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc có thể nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2000µm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới đây 3µm. Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để tạo ra hạt phân tán trong nước. Các chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 đến 10µm. Bọt mịn để rắc khô và bọt có thể được điều chế bằng cách trộn và thường

là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên các chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem ấn phẩm: Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147—48, *Perry’s Chemical Engineer’s Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8—57 và các trang tiếp theo, và WO 91/13546. Các viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Các hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin liên quan tới việc bào chế, xem ấn phẩm: T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture” trong *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, trang 120-133. Cũng có thể thấy trong: U.S. 3,235,361, cột 6, dòng 16 đến cột 7, dòng 19 và các ví dụ 10-41; U.S. 3,309,192, cột 5, dòng 43 đến cột 7, dòng 62 và các ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 và 169-182; U.S. 2,891,855, cột 3, dòng 66 đến cột 5, dòng 17 và các ví dụ 1-4; ấn phẩm: Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley và Sons, Inc., New York, 1961, trang 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và ấn phẩm: *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

Trong các ví dụ dưới đây, tất cả các chế phẩm đều được điều chế theo cách thông thường. Các số hợp chất số được đánh số theo số chỉ trong các bảng mục lục A-E. Không cần mô tả kỹ hơn, các tác giả sáng chế cho rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng phân mô tả trên của sáng chế với phạm vi rộng nhất. Do đó, các ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh họa sáng chế và không hạn chế phân mô tả theo bất kỳ cách nào. Phần trăm được tính theo trọng lượng trừ khi có quy định khác được chỉ ra cụ thể.

Ví dụ A

Dạng cô đặc đậm đặc

Hợp chất 1	98,5%
silic oxit dạng gel khí	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%

Ví dụ B

Bột thấm ốt

Hợp chất 2	65,0%
dodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
montmorillonit (đã được nung)	23,0%

Ví dụ C

Hạt

Hợp chất 3	10,0%
hạt attapulgit (chất có độ bay hơi thấp, 0,71/0,30mm; rây Mỹ số 25-50)	90,0%

Ví dụ D

Viên ép đùn

Hợp chất 4	25,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ E

Chất cô đặc dễ nhũ hóa

Hợp chất 5	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
metyl este của axit béo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ví dụ F

Vi nhũ tương	
Hợp chất 6	5,0%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	30,0%
alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
nước	20,0%

Ví dụ G

Xử lý hạt	
Hợp chất 7	20,00%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	5,00%
sáp axit montan	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%
copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
rượu stearyllic (POE 20)	2,00%
polyorganosilan	0,20%
thuốc nhuộm màu đỏ	0.05%
nước	65,75%

Ví dụ H

Phân bón	
Hợp chất 8	2,50%
copolyme pyrrolidon-styren	4,80%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,30%
bột talc	0,80%
tinh bột ngô	5,00%
phân bón giải phóng chậm	36,00%
cao lanh	38,00%
nước	10,60%

Ví dụ I

Dạng cô đặc hỗn dịch	
Hợp chất 9	35%

copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
nước	53,7%

Ví dụ J

Nhũ tương trong nước

Hợp chất 10	10,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon trên cơ sở dầu mỏ thơm	20,0
nước	58,7%

Ví dụ K

Thể phân tán trong dầu

Hợp chất 11	25%
polyoxyetylen sorbitol hexaoleat	15%
sét bentonit đã cải biến bằng chất hữu cơ	2,5%
metyl este của axit béo	57,5%

Ví dụ L

Nhũ huyền phù

Hợp chất 12	10,0%
imidacloprid	5,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%

polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon trên cơ sở dầu mỏ thơm	20,0%
nước	53,7%

Các hợp chất theo sáng chế có hoạt tính kháng lại phổ rộng của loài gây hại không xương sống. Các loài gây hại này bao gồm các loài không xương sống sống trong nhiều môi trường khác nhau như, ví dụ, cây lá, rễ, đất, cây thu hoạch hoặc các loại thực phẩm khác, các công trình xây dựng hoặc da động vật. Các loài gây hại này bao gồm, ví dụ, loài không xương sống ăn lá (bao gồm lá, thân, hoa và quả), hạt, gỗ, sợi dệt hoặc máu hoặc mô động vật và nhờ đó gây ra tổn thương hoặc hư hại cho, ví dụ, đang phát triển hoặc bảo quản cây nông nghiệp, cây lâm nghiệp, cây trong nhà kính, cây cảnh, cây trong vườn ươm, bảo quản các loại thực phẩm hoặc các sản phẩm sợi hoặc các công trình xây dựng và các công trình khác hoặc các bộ phận của chúng hoặc gây hại cho sức khỏe động vật hoặc sức khỏe cộng đồng. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ đánh giá được rằng không phải tất cả hợp chất là hữu hiệu như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả loài gây hại.

Do đó, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể sử dụng trong nông nghiệp để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật và cũng trong lĩnh vực phi nông nghiệp để bảo vệ cây trong vườn và các loại thực vật khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Tính hữu ích này bao gồm bảo vệ cây trồng và các loại thực vật (có nghĩa là cả trong lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp) chứa nguyên liệu di truyền được đưa vào bằng kỹ thuật di truyền (tức là chuyển gen) hoặc được cải biến bằng cách gây đột biến để thu được các tính trạng có lợi. Ví dụ về các tính trạng này bao gồm tính sống sót với thuốc diệt cỏ, tính đề kháng với loài gây hại ăn thực vật (ví dụ, các côn trùng, ve bét, các loài rệp cây, nhện, giun tròn, ốc sên, nấm gây bệnh thực vật, vi khuẩn và virus), cải biến sự phát triển thực vật, tăng tính sống sót với các điều kiện sinh trưởng bất lợi như các nhiệt độ cao hoặc thấp, độ ẩm của đất cao hoặc thấp, và độ muối cao, tăng đơm hoa hoặc kết quả, tăng hiệu suất thu hoạch, tăng thời gian chín, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, và cải thiện các đặc tính bảo quản hoặc chế biến sản phẩm thu hoạch. Thực vật chuyển gen có thể được cải biến để biểu hiện nhiều tính trạng. Ví dụ về thực vật có các tính trạng được tạo ra bằng kỹ thuật

di truyền hoặc gây đột biến gồm các giống ngô, bông, đậu tương và khoai tây biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* trừ sâu như YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® và NEWLEAF®, và các giống ngô, bông, đậu tương và cải dầu sống sót thuốc diệt cỏ như ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® và CLEARFIELD®, cũng như cây trồng biểu hiện N-acetyltransferaza (GAT) có tính sống sót với thuốc diệt cỏ glyphosat, hoặc cây trồng chứa gen HRA có tính sống sót với thuốc diệt cỏ ức chế axetylactat syntaza (ALS). Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với tính trạng được tạo ra bởi kỹ thuật di truyền hoặc được biến đổi bằng cách đột biến, vì vậy làm tăng sự biểu hiện kiểu hình hoặc một cách hữu hiệu của tính trạng hoặc làm tăng tác dụng phòng trừ loài gây hại không xương sống một cách hữu hiệu của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế. Cụ thể là, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với sự biểu hiện kiểu hình của các protein hoặc các sản phẩm tự nhiên khác gây độc cho loài gây hại không xương sống để tạo ra tác dụng phòng trừ lớn hơn hỗ trợ của loài gây hại này. Cũng như vậy, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với các tính trạng cải thiện khả năng sinh trưởng thực vật hoặc các khía cạnh khác như sức sống của cây trồng, bao gồm các tính trạng biểu hiện độ bền với các áp lực từ môi trường như độ ẩm dưới mức tối ưu.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể tùy ý chứa các chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ, phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi, magie, sắt, đồng, bo, mangan, kẽm và molybden. Lưu ý rằng chế phẩm bao gồm ít nhất một phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi và magie. Chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật có thể ở dạng lỏng hoặc rắn. Lưu ý rằng chế phẩm rắn ở dạng hạt, dạng thoi nhỏ hoặc dạng viên nén. Chế phẩm rắn bao gồm phân bón có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất hoặc hỗn hợp theo sáng chế với phân bón cùng với các hợp phần điều chế và sau đó điều chế chế phẩm bằng các phương pháp như tạo hạt hoặc ép đùn. Theo cách khác, chế phẩm rắn có thể được điều chế bằng cách phun dung dịch hoặc huyền phù chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trong dung môi dễ bay hơi lên phân bón đã điều chế trước ở dạng hỗn hợp ổn định về kích thước, ví dụ, dạng hạt, dạng thoi nhỏ hoặc dạng viên nén, và sau đó làm bay hơi dung môi.

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp hoặc phi nông nghiệp bao gồm: trứng, ấu trùng và con trưởng thành thuộc bộ Cánh vảy như sâu cắn gié, sâu cắn rễ, sâu đo và sâu hại bông thuộc họ Bướm đêm (ví dụ, sâu đục thân màu

hồng (*Sesamia inferens* Walker), sâu đục thân ngô (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), sâu cắn gié phương nam (*Spodoptera eridania* Cramer), sâu cắn gié lá (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), sâu cắn gié củ cải đường (*Spodoptera exigua* Hübner), sâu cắn lá bông (*Spodoptera littoralis* Boisduval), sâu cắn gié sọc vàng (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), sâu cắn rễ đen (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), sâu bướm đậu nhung (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), sâu đục quả xanh (*Lithophane antennata* Walker), sâu cắn gié cải bắp (*Barathra brassicae* Linnaeus), sâu đo đậu tương (*Pseudoplusia includens* Walker), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Hübner), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Huber), sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens* Fabricius)); sâu đục thân, sâu kén, sâu kéo màng, sâu ốc chóp, sâu cải bắp và sâu gặm thịt lá thuộc họ sâu đục thân (ví dụ, sâu đục ngô châu Âu (*Ostrinia Nubilalis* Hübner), sâu cam rốn (*Amyelois transitella* Walker), sâu kéo màng rễ ngô (*Crambus caliginosellus* Clemens), sâu kéo màng cỏ (Pyralidae: *Crambinae*) cũng như sâu kéo màng cỏ (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); sâu đục thân mía (*Chilo infuscatellus* Snellen), đục thân cà chua nhỏ (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), sâu cuốn lá màu xanh (*Cnaphalocerus medinalis*), sâu cuốn lá nhỏ (*Desmia funeralis* Hübner), sâu dừa (*Diaphania nitidalis* Stoll), ấu trùng cải bắp (*Helluala hydralis* Guenée), sâu đục thân màu vàng (*Scirpophaga incertulas* Walker), sâu đục thân rễ (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), sâu đục thân trắng (*Scirpophaga innotata* Walker), sâu đục thân rễ (*Scirpophaga nivella* Fabricius), sâu đục thân lúa đầu đen (*Chilo polychrysus* Meyrick), sâu bướm cụm cải bắp (*Crocidolomia binotalis* English)); sâu cuốn lá, sâu đục chồi, sâu hạt, và sâu trái cây thuộc họ Tortricidae (ví dụ, bướm cá tuyết (*Cydia pomonella* Linnaeus), bướm hại nhỏ (*Endopiza viteana* Clemens), bướm trái cây phương đông (*Grapholita molta* Busck)); ngài rơi chanh cam (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), sâu đục thân chanh cam (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), sâu cuốn lá băng đỏ (*Argyrotaenia velutinana* Walker), sâu cuốn lá dải chéo (*Choristoneura rosaceana* Harris), sâu táo màu nâu nhạt (*Epiphyas postvittana* Walker), ngài nhỏ châu Âu (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), ngài búp táo (*Pandemis pyrusana* Kearfott), sâu cuốn lá ăn tạp (*Platynota stultana* Walsingham), sâu ăn phấn hoa sọc vằn (*Pandemis cerasana* Hübner), sâu ăn phấn hoa táo màu nâu (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); và nhiều loài thuộc bộ Cánh vảy có ảnh hưởng về mặt kinh tế khác (ví dụ, bướm lưng kim cương (*Plutella xylostella* Linnaeus), sâu hồng hại bông (*Pectinophora gossypiella* Saunders), bướm gipsy (*Lymantria dispar* Linnaeus)); đục thân quả đào (*Carposina niponensis* Walsingham), sâu đục thân cành con đào (*Anarsia lineatella* Zeller), sâu củ khoai tây (*Phthorimaea operculella* Zeller), đục lá chấm (*Lithocolletis blancardella*

Fabricius), sâu đục lá táo châu á (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), sâu cuốn lá lúa (*Lerodea eufala* Edwards), sâu đục lá táo (*Leucoptera scitella* Zeller)); trứng, nhộng và sâu trưởng thành thuộc bộ Cánh gián bao gồm gián thuộc các họ Blattellidae và Blattidae (ví dụ, gián phương Đông (*Blatta orientalis* Linnaeus), gián châu á (*Blatella asahinai* Mizukubo), gián Đức (*Blattella germanica* Linnaeus), gián sọc nâu (*Supella longipalpa* Fabricius), gián Mỹ (*Periplaneta americana* Linnaeus), gián nâu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gián Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), gián nâu khối (*Periplaneta fuliginosa* Service), gián Australia (*Periplaneta australasiae* Fabr.), gián tôm hùm (*Nauphoeta cinerea* Olivier) và gián tron (*Symploce pallens* Stephens)); trứng, ấu trùng và dạng trưởng thành ăn lá, ăn quả, ăn rễ, ăn hạt và ăn mô bột thuộc bộ Cánh cứng bao gồm một ngũ cốc thuộc họ Anthribidae, Bruchidae, và Curculionidae (ví dụ, bọ vòi voi hại bông (*Anthonomus grandis* Boheman), bọ vòi voi hại lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), một ngũ cốc thóc (*Sitophilus granarius* Linnaeus), một ngũ cốc gạo (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), một ngũ cốc cỏ poa thường niên (*Listronotus maculicollis* Dietz), một vòi dài cỏ poa (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), một vòi dài săn mồi (*Sphenophorus venatus vestitus*), một vòi dài Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); bọ nhảy, bọ cánh cứng dưa chuột, sâu ăn rễ, bọ cánh cứng lá cây, bọ cánh cứng khoai tây, và sâu đục lá thuộc họ Chrysomelidae (ví dụ, bọ cánh cứng khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), sâu ăn rễ ngô phương Đông (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); bọ da và các loài bọ cánh cứng khác thuộc họ Scarabaeidae (ví dụ, bọ cánh cứng Nhật Bản (*Popillia japonica* Newman), bọ cánh cứng phương Đông (*Anomala orientalis* Waterhouse), *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), bọ da mặt nạ phương Bắc (*Cyclocephala borealis* Arrow), bọ da mặt nạ phương Nam (*Cyclocephala immaculata* Olivier hoặc *C. lurida* Bland), bọ phân và giòi trắng (*Aphodius* spp.), bọ cỏ đen (*Ataenius spretulus* Haldeman), bọ cánh cứng xanh June (*Cotinis nitida* Linnaeus), bọ cánh cứng vườn Châu á (*Maladera castanea* Arrow), bọ cánh cứng May/June (*Phyllophaga* spp.) và bọ da châu Âu *Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); bọ cánh cứng thảm thuộc họ Dermestidae; sâu ăn lá thuộc họ Elateridae; bọ cánh cứng vỏ cây thuộc họ Scolytidae và bọ cánh cứng bột mỳ thuộc họ Tenebrionidae.

Ngoài ra, các loài gây hại nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm: trứng, con trưởng thành và ấu trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm sâu tai thuộc họ Forficulidae (ví dụ, sâu tai châu Âu (*Forficula auricularia* Linnaeus), sâu tai đen (*Chelisoches mono* Fabricius)); trứng, dạng chưa thành thực, dạng trưởng thành và nhộng thuộc các bộ Cánh

nửa cứng và Cánh giống như rệp cây thuộc họ Miridae, ve sâu thuộc họ Cicadidae, rầy xanh đuôi đen (ví dụ, *Empoasca* spp.) thuộc họ Cicadellidae, rệp (ví dụ, *Cimex lectularius* Linnaeus) thuộc họ Cimicidae, rầy thuộc các họ Fulgoroidae và Delphacidae, ve sâu nhảy cây thuộc họ Membracidae, rệp lá thuộc họ Psyllidae, ruồi trắng thuộc họ Aleyrodidae, rệp thuộc họ Aphididae, rệp sáp thuộc họ Phylloxeridae, rệp sáp thuộc họ Pseudococcidae, rệp cây thuộc họ Coccidae, Diaspididae và Margarodidae, rệp vằn thuộc họ Tingidae, rệp hôi thuộc họ Pentatomidae, rệp (ví dụ, rệp lông (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) và rệp phương Nam (*Blissus insularis* Barber)) và rệp hại hạt khác thuộc họ Lygaeidae, rệp dãi thuộc họ Cercopidae, rệp hại bí thuộc họ Coreidae, và rệp đỏ và nhuộm màu bông thuộc họ Pyrrhocoridae.

Các loài gây hại nông nghiệp và phi nông nghiệp cũng bao gồm: trứng, ấu trùng, nhộng và dạng trưởng thành thuộc bộ Ve bét (ve) như bộ ve nhện và bộ ve đỏ thuộc họ Tetranychidae (ví dụ, bộ ve đỏ Châu Âu (*Panonychus ulmi* Koch), bộ ve nhện hai chấm (*Tetranychus urticae* Koch), bộ ve McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), bộ ve dẹt thuộc họ Tenuipalpidae (ví dụ, bộ ve dẹt hại chanh (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), bộ ve ăn chồi và gỉ sắt thuộc họ Eriophyidae và các loại bộ ve ăn lá và ve bét ảnh hưởng đến sức khỏe của người và động vật, tức là ve bét phấn hoa thuộc họ Epidermoptidae, ve bét quả đại thuộc họ Demodicidae, ve bét hạt cứng thuộc họ Glycyphagidae, ve thuộc họ Ixodidae, thường được gọi là ve cứng (ví dụ, ve nhỏ (*Ixodes scapularis* Say), ve gây liệt úc (*Ixodes holocyclus* Neumann), ve chó Mỹ (*Dermacentor variabilis* Say), tíc sao (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) và ve thuộc họ Argasidae, thường được gọi là ve mềm (ví dụ, ve tái phát (*Ornithodoros turicata*), ve gà nói chung (*Argas Radiatus*)); ve bét gây nấm vẩy và ngứa thuộc các họ Psoroptidae, Pyemotidae, và Sarcoptidae; trứng, dạng trưởng thành và dạng chưa thành thực thuộc bộ Cánh thẳng bao gồm châu chấu và dế (ví dụ, châu chấu di cư (ví dụ, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), châu chấu Mỹ (ví dụ, *Schistocerca americana* Drury), châu chấu sa mạc (*Schistocerca Gregaria* Forskal), châu chấu di cư (*Locusta migratoria* Linnaeus), châu chấu bụi rậm (*Zonocerus* spp.), dế nhà (*Acheta domesticus* Linnaeus), dế ruồi (ví dụ, dế ruồi hung (*Scapteriscus vicinus* Scudder) và dế ruồi phương Nam (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); các dạng trưởng thành và dạng chưa thành thực thuộc bộ côn trùng Hai cánh bao gồm sâu đục lá, ruồi nhướn, ruồi quả (Tephritidae), ruồi frít (ví dụ, *Oscinella frit* Linnaeus), giòi đất, ruồi nhà (ví dụ, *Musca domestica* Linnaeus), ruồi nhà nhỏ (ví dụ, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), ruồi chó (ví dụ, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), ruồi mặt, ruồi anten, ruồi nặng (ví dụ, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), và

các loài ruồi rêu khác, ruồi trâu (ví dụ, *Tabanus* spp.), ruồi giòi (ví dụ, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), bọ gia súc (ví dụ, *Hypoderma* spp.), ruồi hươu (ví dụ, *Chrysops* spp.), con mòng (ví dụ, *Melophagus ovinus* Linnaeus) và các loài Râu ngắn khác, muỗi (ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), ruồi đen (ví dụ, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), ruồi nhuộm đốt, ruồi cát, ruồi nhuộm, và các loài Giun tròn khác; trứng, dạng chưa thành thực và dạng trưởng thành thuộc bộ Cánh tơ bao gồm bọ trĩ hành (*Thrips tabaci* Lindeman), bọ trĩ hại hoa (*Frankliniella* spp.), và các loài bọ trĩ ăn lá khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm kiến thuộc họ Formicidae bao gồm kiến đục gỗ Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), (ví dụ, kiến đục gỗ màu đỏ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), kiến đục gỗ màu đen (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), kiến chân trắng (*Technomyrmex albipes* French. Smith), kiến đầu to (*Pheidole* sp.), kiến ma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); kiến Pharaoh (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), kiến lửa con (*Wasmannia auropunctata* Roger), kiến lửa (*Solenopsis geminata* Fabricius), kiến lửa đỏ (*Solenopsis invicta* Buren), kiến Achantina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), kiến đại (*Paratrechina longicomis* Latreille), kiến mặt đường (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), kiến đậu đũa Trung Quốc (*Lasius alienus* Förster), kiến nhà có mùi (*Tapinoma sessile* Say). Các loại Cánh màng khác bao gồm ong (bao gồm ong đục gỗ), ong sừng, ong bắp cày vàng và đen, ong bắp cày, và ong cắn lá (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh đều bao gồm mối thuộc họ Termitidae (ví dụ, *Macrotermes* sản phẩm. *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (ví dụ, *Cryptotermes* sp.), và họ Rhinotermitidae (ví dụ, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), mối đất phương Đông (*Reticulitermes flavipes* Kollar), mối đất phương Tây (*Reticulitermes hesperus* Banks), mối đất Formosan (*Coptotermes formosanus* Shiraki), mối gỗ Tây ấn Độ (*Incisitermes immigrans* Snyder), mối chuyển bột (*Cryptotermes brevis* Walker), mối gỗ (*Incisitermes snyderi* Light), mối đất Đông Nam (*Reticulitermes virginicus* Banks), mối gỗ phương Đông (*Incisitermes minor* Hagen), mối cây như *Nasutitermes* sp. và các loài mối khác có ảnh hưởng về mặt kinh tế; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Thysanura như bọ bạc (*Lepisma saccharina* Linnaeus) và bọ firebrat (*Theimobia domestica* Packard); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ ăn lông và gồm chấy đầu (*Pediculus Humanus capitis* De Geer), rận người (*Pediculus Humanus* Linnaeus), rận gà (*Menacanthus stramineus* Nitsch), rận chó (*Trichodectes canis* De Geer), rận chim (*Goniocotes gallinae* De Geer), rận cừu (*Bovicola ovis* Schrank), rận gia súc mũi ngắn (*Haematopinus eurysternus* Nitsch), rận gia súc mũi dài (*Linognathus vituli* Linnaeus) và rận ký sinh hút và cắn người và động vật

khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Siphonoptera bao gồm rầy chuột phương Đông (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), rầy mèo (*Ctenocephalidess felis* Bouche), rầy chó (*Ctenocephalidess canis* Curtis), rầy gà mái (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), rầy dích (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), rầy người (*Pulex irritans* Linnaeus) và các loài rầy khác gây đau động vật có vú và chim. Các loài động vật chân khớp gây hại khác còn bao gồm: nhện thuộc bộ Nhện như nhện nâu ẩn dật (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) và nhện độc đen Mỹ (*Latrodectus mactans* Fabricius), và rết thuộc bộ có Vảy như rết nhà (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống một hại kho gồm một đục hạt lớn (*Prostephanus truncatus*), một đục hạt nhỏ (*Rhyzopertha dominica*), một gạo (*Stiophilus oryzae*), một bắp (*Stiophilus zeamais*), một đậu (*Callosobruchus maculatus*), một bột đỏ (*Tribolium castaneum*), sâu gạo (*Stiophilus granarius*), ngài Ấn độ (*Plodia interpunctella*), bọ bột Địa trung hải (*Ephestia kuhniella*) và bọ hạt hồng hoặc phẳng (*Cryptolestis ferrugineus*).

Các hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đặc biệt tốt đối với các động vật gây hại thuộc bộ Cánh vảy (ví dụ, *Alabama argillacea* Hulbner (sâu lá bông), *Archips argyrospila* Walker (sâu cuốn lá cây ăn quả), *A. rosana* Linnaeus (sâu cuốn lá châu Âu) và các loài sâu cuốn lá lặc đầu đen khác, *Chilo suppressalis* Walker (sâu đục rễ lúa), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (sâu cuốn lá lúa), *Crambus caliginosellus* Clemens (sâu kéo màng rễ ngô), *Crambus teterrellus* Zincken (sâu kéo màng cỏ poa), *Cydia pomonella* Linnaeus (codling bướm đêm), *Earias insulana* Boisduval (sâu xanh có gai), *Earias vittella* Fabricius (sâu xanh có đốm), *Helicoverpa armigera* Hübner (sâu xanh Mỹ), *Helicoverpa zea* Boddie (sâu xanh ngô), *Heliothis virescens* Fabricius (sâu đục chổi thuốc lá), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sâu kéo màng cỏ), *Lobesia botrana* Denis & Schifferrmüller (bướm đêm quả nho), *Pectinophora gossypiella* Saunders (sâu xanh cắn chướng), *Phyllocnistis citrella* Stainton (sâu đục lá cam quýt), *Pieris brassicae* Linnaeus (bướm lợn trắng lớn Anh), *Pieris rapae* Linnaeus (bướm lợn trắng nhỏ Anh), *Plutella xylostella* Linnaeus (sâu tơ), *Spodoptera exigua* Hübner (sâu cắn gié củ cải đường), *Spodoptera litura* Fabricius (sâu cắn rễ thuốc lá, sâu róm), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (sâu cắn gié lá), *Trichoplusia ni* Hübner (sâu đo cải bắp) và *Tuta absoluta* Meyrick (sâu đục lá cà chua).

Các hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đáng kể với các loài thuộc bộ côn trùng Cánh giồng bao gồm: *Acyrtisiphon pisum* Harris (rệp vùng đậu Hà lan), *Aphis craccivora* Koch (rệp vùng đậu đũa), *Aphis fabae* Scopoli (rệp vùng gỗ cứng), *Aphis*

gossypii Glover (rệp vùng bông, rệp vùng dưa), *Aphis pomi* De Geer (rệp vùng táo), *Aphis spiraecola* Patch (rệp vùng cây mơ trên châu), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (rệp vùng cây mao địa hoàng), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (rệp vùng dâu tây), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (rệp vùng lúa mì Nga), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (rệp vùng táo đỏ), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (rệp vùng táo lông tơ), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (rệp vùng mận hột), *Lipaphis erysimi* Kaltentbach (rệp vùng củ cải), *Metopolophium dirrhodum* Walker (rệp vùng ngũ cốc), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (rệp vùng khoai tây), *Myzus persicae* Sulzer (rệp vùng khoai tây-đào, rệp vùng đào xanh), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (rệp vùng rau diếp), *Pemphigus* spp. (các loài rệp rế và các loài rệp vú lá), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (rệp vùng lá ngô), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (rệp vùng anh đào), *Schizaphis graminum* Rondani (greenbug), *Sitobion avenae* Fabricius (rệp vùng hại hạt Anh), *Therioaphis maculata* Buckton (rệp vùng cỏ linh lăng có đốm), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (rệp vùng cam quýt đen), và *Toxoptera citricida* Kirkaldy (rệp vùng cam quýt nâu); *Adelges* spp. (adelgids); *Phylloxera devastatrix* Pergande (rệp hại hồ đào pécán); *Bemisia tabaci* Gennadius (ruồi trắng thuốc lá, ruồi trắng khoai lang), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (ruồi trắng cây dương lá rụng), *Dialeurodes citri* Ashmead (ruồi trắng cam quýt) và *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (ruồi trắng nhà kính); *Empoasca fabae* Harris (bọ nhảy hại lá khoai tây), *Laodelphax striatellus* Fallen (rầy nâu nhỏ), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (rầy xanh đuôi đen cúc tây), *Nephotettix cincticeps* Uhler (rầy xanh đuôi đen), *Nephotettix nigropictus* Stal (rầy xanh đuôi đen hại lúa), *Nilaparvata lugens* Stål (rầy nâu), *Peregrinus maidis* Ashmead (bọ nhảy hại cây ngô), *Sogatella furcifera* Horvath (rầy lưng trắng), *Sogatodes orizicola* Muir (rầy lúa), *Typhlocyba pomaria* McAtee rầy xanh đuôi đen táo trắng, *Erythroneoura* spp. (rầy xanh đuôi đen nhỏ); *Magidada septendecim* Linnaeus (ve sâu); *Icerya purchasi* Maskell (rệp đẹn bông), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (rệp San Jose); *Planococcus citri* Risso (sâu ăn bột cam quýt); *Pseudococcus* spp. (các loài sâu ăn bột khác); *Cacopsylla pyricola* Foerster (rệp lá lê), *Trioza diospyri* Ashmead (rệp lá cây hồng vàng).

Các hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc bộ Cánh nửa cứng bao gồm: *Acrostemum hilare* Say (rệp hôi xanh), *Anasa tristis* De Geer (rệp bít), *Blissus leucopterus* leucopterus Say (rệp), *Cimex lectularius* Linnaeus (rệp) *Corythuca gossypii* Fabricius (rệp bông), *Cyrtopeltis modesta* Distant (rệp cà chua), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (bọ xít bông), *Euchistus servus* Say (rệp hôi nâu), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (rệp hôi một đốm), *Graptosthetus* spp. (các loài rệp hại

hạt), *Leptoglossus corculus* Say (rệp hạt thông nhảy lá), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (rệp cây), *Nezara viridula* Linnaeus (rệp hôi xanh phương Nam), *Oebalus pugnax* Fabricius (rệp hôi gạo), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (rệp cây cho dịch nhựa mủ lớn), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (bọ nhảy bông). Các bộ côn trùng khác được phòng trừ bởi các hợp chất theo sáng chế gồm bộ Cánh tơ (ví dụ, *Frankliniella occidentalis* Pergande (bọ trĩ hại hoa phương Tây), *Scirtothrips citri* Moulton (bọ trĩ cam quýt), *Sericothrips variabilis* Beach (bọ trĩ đậu tương), và *Thrips tabaci* Lindeman (bọ trĩ hành); và bộ Cánh cứng (ví dụ, *Leptinotarsa decemlineata* Say (bọ cánh cứng khoai tây Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (bọ cánh cứng đậu Mexico) và bọ bả củi thuộc giống *Agriotes*, *Athous* hoặc *Limonius*).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc lớp Giun tròn, Sán dây, Sán lá và Giun đầu móc bao gồm các loài có ảnh hưởng nghiêm trọng về mặt kinh tế thuộc bộ Giun móc, Giun đũa, Giun kim, Giun lươn, Giun tròn ký sinh và Enoplida như, nhưng không chỉ giới hạn ở, các loài gây hại nông nghiệp có ảnh hưởng về mặt kinh tế (tức là giun tròn nốt sần thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus*, v.v.) và các loài gây hại cho sức khỏe của người và động vật (tức là tất cả các loài sán lá, sán xơ mít, và giun tròn có ảnh hưởng về mặt kinh tế như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara cards* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis* Leidy ở chó, *Anoplocephala perfoliata* ở ngựa, *Fasciola hepatica* Linnaeus ở động vật nhai lại, v.v.).

Cũng cần lưu ý một số hệ phân loại đương thời đối với bộ Cánh giống dưới dạng bộ phụ trong chủng Cánh nửa.

Lưu ý rằng việc sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ nhảy hại lá khoai tây (*Empoasca fabae*). Tốt hơn nếu sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ nhảy hại cây ngô (*Peregrinus maidis*). Tốt hơn nếu sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp vùng bông dưa (*Aphis gossypii*). Tốt hơn nếu sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*). Tốt hơn nếu sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ sâu tơ (*Plutella xylostella*). Tốt hơn nếu sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ sâu cắn gié lá (*Spodoptera frugiperda*).

Lưu ý rằng việc sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp hôi xanh miền nam (*Nezara viridula*), rệp cây mờ miền tây (*Lygus hesperus*), mọt lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus*), bọ nhảy nâu hại lúa (*Nilaparvata lugens*), rầy xanh đuôi đen hại lúa (*Nephotettix virescens*) và sâu đục lúa sọc vằn (*Chilo suppressalis*).

Các hợp chất theo sáng chế cũng hữu ích để làm tăng sức sống của cây trồng. Phương pháp này bao gồm bước cho cây trồng (ví dụ, tán lá, hoa, quả hoặc rễ) hoặc hạt được phát triển từ cây trồng này tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng đủ để đạt được hiệu quả sống sót mong muốn ở thực vật (tức là lượng hữu hiệu sinh học). Thông thường, hợp chất có công thức 1 được dùng trong chế phẩm đã điều chế. Mặc dù hợp chất có công thức 1 thường được dùng trực tiếp lên cây trồng hoặc hạt của nó, nó cũng có thể được dùng cho khu vực sống của cây trồng, tức là môi trường của cây trồng, đặc biệt là phần môi trường gần đủ để cho hợp chất có công thức 1 dịch chuyển tới cây trồng. Khu vực sống liên quan tới phương pháp này hầu hết thường bao gồm môi trường sinh trưởng (tức là môi trường cung cấp chất dinh dưỡng cho thực vật), thường là đất trong đó thực vật được sinh trưởng trên đó. Do đó, việc xử lý cây trồng để làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt được phát triển từ cây trồng này hoặc khu vực sống của cây trồng tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng hữu hiệu sinh học.

Sức sống của cây trồng đã được tăng cường có thể tạo ra một hoặc nhiều hiệu quả đáng kể sau đây: (a) tạo ra tính tối ưu cho cây trồng như được chứng minh bởi khả năng nảy mầm tuyệt vời của hạt, khả năng nảy chồi và đứng vững của cây trồng; (b) khả năng sinh trưởng của cây trồng được tăng cường như được chứng minh bởi khả năng sinh trưởng là nhanh và mạnh (ví dụ, đo được bằng chỉ số của diện tích lá), chiều cao của thực vật, số người trồng trọt (ví dụ, đối với cây lúa), khối lượng rễ và trọng lượng khô toàn phần của khối lượng thực vật của cây trồng; (c) năng suất cây trồng được cải thiện, như được chứng minh bởi thời gian ra hoa, quá trình hoa nở, số lượng hoa, tổng khả năng tích tụ sinh khối (tức là số lượng hiệu suất) và/hoặc khả năng tiêu thụ loại quả hoặc hạt của sản phẩm (tức là chất lượng hiệu suất); (d) khả năng tăng cường của cây trồng để chống chịu hoặc ngăn ngừa bệnh nhiễm khuẩn trên thực vật và phá hoại của loài gây hại động vật chân đốt, giun tròn hoặc động vật thân mềm; và (e) khả năng tăng cường của cây trồng để chống chịu với các áp lực môi trường như ở nhiệt độ vô cùng, độ ẩm dưới mức tối ưu hoặc hóa chất độc tố thực vật.

Các hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của thực vật đã được xử lý so với thực vật không được xử lý bằng cách tiêu diệt hoặc theo cách khác ngăn ngừa sự cung cấp thức ăn cho các loài gây hại không xương sống ăn thực vật trong môi trường sống của các thực vật này. Khi không có mặt của sự phòng trừ các loài gây hại không xương sống ăn thực vật, các loài gây hại sẽ làm giảm sức sống của thực vật bằng cách tiêu thụ mô hoặc nhựa cây của thực vật, hoặc truyền mầm bệnh thực vật như virus. Ngay cả khi không có mặt của các loài gây hại không xương sống ăn thực vật, các hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của thực vật bằng cách biến đổi quá trình chuyển hóa của thực vật.

Nhìn chung, sức sống của cây trồng sẽ được tăng cường một cách đáng kể nhất bằng cách cho thực vật tiếp xúc với hợp chất theo sáng chế nếu thực vật này sinh trưởng trong môi trường không lí tưởng, tức là môi trường chứa một hoặc nhiều ảnh hưởng bất lợi cho thực vật để tạo ra khả năng di truyền đầy đủ nó phải ở trong môi trường lí tưởng.

Lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường bao gồm các loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Cũng lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường không bao gồm các loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Cũng lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường bao gồm lượng ảm nhỏ hơn lượng lí tưởng cung cấp cho sự sinh trưởng của cây trồng. Lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này là lúa. Cũng lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này là ngô (bắp). Cũng lưu ý rằng phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng theo sáng chế trong đó cây trồng này là đậu tương.

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc một số chất hoặc hoạt chất sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc tiết dục, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất hấp dẫn côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus hoặc nấm để tạo thành thuốc trừ sâu nhiều thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm bao gồm lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm gồm các chất hoạt động bề mặt, các chất pha loãng dạng rắn và các chất pha loãng dạng lỏng, và ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế cùng với hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có công thức 1, để tạo thành hỗn hợp sơ chế, hoặc các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có công thức 1, và hai chế phẩm được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Các ví dụ về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể bào chế cùng với hợp chất theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, acephate, axequinoxyl, acetamiprid, acrinathrin, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin,

azinphos-methyl, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, clorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, xyantraniliprol, xyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, Lambda-xyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenbutatin oxide, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, flufenimer, flufenoxuron, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanat, fosthiazat, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiocarb, methomyl, methoprene, methoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, methoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pymetrozin, pyrafluprol, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprol, pyriproxyfen, rotenon, ryanodan, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflo, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylfuthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamat, trichlorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins, entomopathogenic vi khuẩn, entomopathogenic viruses và entomopathogenic fungi.

Lưu ý là các thuốc trừ sâu như abamectin, acetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, clorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, xyantraniliprol, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, Lambda-xyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazole, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flufenoxuron, fluvalinate, formetanat, fosthiazat, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiocarb, methomyl, methoprene, methoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodan, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflo, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid,

thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, triazamat, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins, toàn bộ chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng virus *Nucleo polyhydrosis*.

Một phương án của chất sinh học để trộn với hợp chất theo sáng chế bao gồm vi khuẩn gây chết cho côn trùng như *Bacillus thuringiensis* và nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* như MVP[®] và MVPII[®] thuốc trừ sâu sinh học được điều chế bằng cách quy trình CellCap[®] (CellCap[®], MVP[®] và MVPII[®] là nhãn hiệu hàng hoá của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); nấm gây chết cho côn trùng như nấm nhọ xạ xanh; và virus gây chết cho côn trùng (cả hai trong tự nhiên và biến đổi gen) như virus hình que, virus nhiều mặt nhân (nucleopolyhedro virus - NPV) như HzNPV (*Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus), AfNPV (*Anagrapha falcifera* nucleopolyhedrovirus); và virus dạng hạt (granulosis virus-GV) như CpGV (*Cydia pomonella* granulosis virus).

Đặc biệt lưu ý là sự kết như vậy trong đó hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác thuộc lớp hóa học khác hoặc có vị trí hoạt động khác so với hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, chế phẩm với ít nhất một phòng trừ hoạt chất loài gây hại không xương sống khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ được ưu tiên đặc biệt. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác nhau. Hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chất điều biến kênh natri như bifenthrin, xypermethrin, xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerat, fenvalerat, indoxacarb, metofluthrin, profluthrin, pyrethrin và tralomethrin; chất ức chế cholinesteraza như clorpyrifos, methomyl, oxamyl, thiodicarb và triazamat; neonicotinoit như axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazin, thiacloprid và thiamethoxam; lacton vòng lớn có tác dụng trừ sâu như spinetoram, spinosad, abamectin, avermectin và emamectin; chất đối kháng kênh clorua cổng GABA (axit γ -aminobutyric) như avermectin hoặc chất phong bế như ethiprol và fipronil; các chất ức chế tổng hợp kitin như buprofezin, xyromazin, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron; chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non như điofenolan, fenoxycarb, methopren và pyriproxyfen; phối tử thụ thể octopamin như amitraz; chất ức chế lột xác và chất chủ vận ecdyson như azadirachtin, metoxyfenozit và tebufenozit; phối tử thụ thể ryanodin như ryanodin,

anthranilic diamid như chlorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit; chất đồng đẳng nereistoxin như cartap; chất ức chế vận chuyển điện tử ty thể như clorfenapyr, hydrametylnon và pyridaben; chất ức chế sinh tổng hợp lipid như spirodiclofen và spiromesifen; thuốc trừ sâu xyclodien như dieldrin hoặc endosulfan; pyrethroid; carbamat; ure trừ sâu; và chất sinh học kể cả virus nhân đa diện (nucleopolyhedro - NPV), các chi của *Bacillus thuringiensis*, nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* và virus có khả năng trừ sâu khác trong tự nhiên hoặc biến đổi gen.

Ví dụ khác về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể bào chế được cùng với hợp chất theo sáng chế là: các thuốc diệt nấm như 1-[4-[4-[5-(2,6-điflorophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, acibenzolar, aldimorph, amisulbrom, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, binomial, biphenyl, bitertanol, blasticidin-S, hỗn hợp Bordeaux (đồng sulfat ba lần), boscalid/nicobifen, bromuconazol, bupirimat, buthiobat, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, chlozolinat, clotrimazol, đồng oxyclorea, các muối đồng như đồng sulfat và đồng hydroxit, cyazofamid, xyflunamid, cymoxanil, cyproconazol, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobin, dithianon, dodemorph, dodin, econazol, etaconazol, edifenphos, epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, ethridiazol, famoxadon, fenamidone, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferfurazoat, ferimzon, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopicolit, fluoxastrobin, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamid, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-nhôm, fuberidazol, furalaxyl, furametapyr, hexaconazol, hymexazol, guazatin, imazalil, imibenconazol, iminocadin, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb, isoconazol, isoprothiolan, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, maneb, mapanipyrin, mefenoxam, mepronil, metalaxyl, metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin/fenominostrobin, mepanipyrin, metrafenone, miconazol, myclobutanil, neo-asozin (ferric metanarsonat), nuarimol, octhilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, paclobutrazol, penconazol, pencycuron, penthiopyrad, perfurazoat, axit phosphonic, phthalogenua, picobenzamid, picoxystrobin, polyoxin, probenazol, procloraz, procymidon, propamocarb, propamocarb-hydroclorua, propiconazol, propineb, proquinazid, prothioconazol, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrifenox, pyrimethanil, pyrifenox, pyrolnitrin, pyroquilon,

quinconazol, quinoxifen, quintozen, silthiofam, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, lưu huỳnh, tebuconazol, techrazene, tecloftalam, tecnazen, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamit, thiophanat, thiophanat-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, tridemorph, trimoprharnit tricyclazol, trifloxystrobin, triforine, triticonazol, uniconazol, validamycin, vinclozolin, zineb, ziram và zoxamit; thuốc diệt giun tròn như aldicarb, imicyafos, oxamyl và fenamiphos; thuốc sát trùng như streptomycin; thuốc diệt bọ ve như amitraz, chinomethionat, clobenzilat, cyhexatin, đicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximat, hexythiazox, propargit, pyridaben và tebufenpyrad.

Lưu ý là các thuốc diệt nấm và các chế phẩm chứa chúng như 1-[4-[4-[5-(2,6-điflorophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, azoxystrobin, đồng hydroxit, xymoxanil, xpyroconazol, đifenconazol, famoxadon, fenoxanil, ferimzon, flusilazol, flutolanil, fthalit, furametpyr, hexaconazol, isoprothiolan, isotianil, kasugamycin, mancozeb, metominostrobin, orysastrobin, pencycuron, penthiopyrad, picoxystrobin, probenazol, propiconazol, proquinazid, pyroquilon, simeconazol, tiadinil, trixyclozol, trifloxystrobin và validamycin.

Trong một số trường hợp, tổ hợp chứa hợp chất theo sáng chế với các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học (đặc biệt là phòng trừ loài gây hại không xương sống) có thể tạo ra hiệu quả lớn hơn cộng hợp (tức là hiệp đồng). Luôn mong muốn giảm bớt lượng chất hoá học được giải phóng ra môi trường trong khi vẫn đảm bảo được việc phòng trừ động vật gây hại hữu hiệu. Khi tác dụng hiệp đồng của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được phát hiện ở tỷ lệ dùng mang lại mức phòng trừ động vật gây hại thoả đáng trong lĩnh vực nông nghiệp, các hỗn hợp này có thể làm giảm chi phí thu hoạch và ô nhiễm môi trường. Hoạt tính bổ sung lớn hơn làm tăng sức sống của cây trồng cũng có thể quan sát được.

Các hợp chất theo sáng chế và chế phẩm chứa chúng có thể được phun cho cây chuyển gen để biểu hiện sự gây độc protein cho loài gây hại không xương sống (như nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*). Việc sử dụng này có thể tạo ra phổ bảo vệ cây rộng hơn và được ưu tiên về tính kháng. Tác dụng của việc áp dụng ngoại sinh hợp chất phòng trừ loài gây hại không xương sống theo sáng chế có thể hiệp đồng với được biểu hiện gây độc protein.

Các tài liệu tham khảo chung về các chất bảo vệ trong nông nghiệp này (tức là các thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ và tác nhân sinh học) gồm *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British

Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003 và *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001.

Đối với các phương án, trong đó một hoặc nhiều các thành phần trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ trọng lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) với hợp chất có Công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Đáng lưu ý là tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm một cách đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất có công thức 1.

Bảng A nêu các tổ hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác để minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế. cột đầu tiên của bảng A nêu chất phòng trừ loài gây hại không xương sống cụ thể (ví dụ, "Abamectin" ở dòng đầu tiên). cột thứ hai của bảng A nêu kiểu tác động (nếu đã biết) của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống. cột thứ ba của bảng A nêu phương án/ các phương án thực hiện về các khoảng tỷ lệ khối lượng mà chất phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể được dùng so với tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống (ví dụ, "50:1 đến 1:50" abamectin so với hợp chất có công thức 1 theo khối lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của bảng A nêu cụ thể tổ hợp của hợp chất có công thức 1 với abamectin có thể được dùng nằm trong khoảng tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của bảng A được cấu trúc tương tự. Bảng A còn nêu các hỗn hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế và gồm các phương án thực hiện bổ sung có khoảng tỷ lệ khối lượng với tỷ lệ dùng, một số hỗn hợp cụ thể có hiệu quả hiệp đồng đáng kể.

Bảng A

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Abamectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:50
Axetamiprid	neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Amitraz	phối tử thụ thể octopamin	200:1 đến 1:100
Avermectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:50

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Azađirachtin	chất chủ vận ecdyson	100:1 đến 1:120
Beta-xyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Bifenthrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Buprofezin	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:50
Cartap	chất đồng đẳng nereistoxin	100:1 đến 1:200
Clorantlaniliprol	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Clorfenapyr	chất ức chế vận chuyển điện tử ty thể	300:1 đến 1:200
Clorpyrifos	chất ức chế cholinesteraza	500:1 đến 1:200
Clothianidin	neonicotinoit	100:1 đến 1:400
xyantraniliprol	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Xyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xyhalothrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xypermethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Xyromazin	chất ức chế tổng hợp kitin	400:1 đến 1:50
Đeltamethrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:400
Diêldrin	xyclođien thuốc trừ sâu	200:1 đến 1:100
Đinotefuran	neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Điofenolan	chất ức chế lột xác	150:1 đến 1:200
Emamectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:10
Endosulfan	xyclođien thuốc trừ sâu	200:1 đến 1:100
Esfenvalerat	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:400
Ethiprol	Chất phong bế kênh clorua điều biến GABA	200:1 đến 1:100
Fenothiocarb		150:1 đến 1:200
Fenoxycarb	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Fenvalerat	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Fipronil	Chất phong bế kênh clorua điều biến GABA	150:1 đến 1:100
Flonicamid		200:1 đến 1:100
Flubendiamit	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Flufenoxuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
Hexaflumuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	300:1 đến 1:50
Hydrametylnon	chất ức chế vận chuyển điện tử ty thể	150:1 đến 1:250
Imidacloprid	neonicotinoit	1000:1 đến 1:1000
Indoxacarb	chất điều biến kênh natri	200:1 đến 1:50
Lambda-xyhalothrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:250
Lufenuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:250
Metaflumizon		200:1 đến 1:200
Methomyl	chất ức chế cholinesteraza	500:1 đến 1:100
Methopren	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Metoxyfenozit	chất chủ vận ecdyson	50:1 đến 1:50
Nitenpyram	neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Nithiazin	neonicotinoit	150:1 đến 1:200
Novaluron	các chất ức chế tổng hợp kitin	500:1 đến 1:150
Oxamyl	chất ức chế cholinesteraza	200:1 đến 1:200
Pymetrozin		200:1 đến 1:100
Pyrethrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Pyridaben	chất ức chế vận chuyển điện tử ty thể	200:1 đến 1:100
Pyridalyl		200:1 đến 1:100
Pyriproxyfen	chất đẳng hiệu hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Ryanodin	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Spinetoram	lacton vòng lớn	150:1 đến 1:100
Spinosad	lacton vòng lớn	500:1 đến 1:10
Spirodiclofen	chất ức chế chất sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200
Spiromesifen	chất ức chế chất sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200
Tebufenozit	chất chủ vận ecdyson	500:1 đến 1:250
Thiacloprid	Neonicotinoit	100:1 đến 1:200
Thiamethoxam	Neonicotinoit	1250:1 đến 1:1000
Thiodicarb	chất ức chế cholinesteraza	500:1 đến 1:400

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Thiosultap-natri		150:1 đến 1:100
Tralomethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Triazamat	chất ức chế cholinesteraza	250:1 đến 1:100
Triflumuron	các chất ức chế tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	chất sinh học	50:1 đến 1:10
<i>Bacillus thuringiensis</i> nội độc tố delta	chất sinh học	50:1 đến 1:10
NPV (ví dụ, Gemstar)	chất sinh học	50:1 đến 1:10

Đáng lưu ý là chế phẩm theo sáng chế, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm gồm chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được nêu trong bảng A nêu trên.

Tỷ lệ khối lượng giữa một hợp chất, bao gồm hợp chất có công thức 1, N-oxit, hoặc muối của nó, và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung thường nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000, với một phương án nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, phương án khác nằm trong khoảng từ 250:1 đến 1:200 và phương án khác nữa nằm trong khoảng từ 100:1 đến 1:50.

Sự liệt kê dưới đây trong các bảng từ B1 tới B19 là các phương án của các chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (hợp chất số được đánh số theo các hợp chất trong các bảng mục lục A) và và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung.

Bảng B1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-1	1	và	Abamectin	B1-38	1	và	Indoxacarb
B1-2	1	và	Acetamiprid	B1-39	1	và	Lambda-xyhalothrin
B1-3	1	và	Amitraz	B1-40	1	và	Lufenuron
B1-4	1	và	Avermectin	B1-41	1	và	Metaflumizone
B1-5	1	và	Azadirachtin	B1-42	1	và	Metomyl
B1-6	1	và	Bensultap	B1-43	1	và	Metoprene
B1-7	1	và	Beta-xyfluthrin	B1-44	1	và	Metoxyfenozit
B1-8	1	và	Bifenthrin	B1-45	1	và	Nitenpyram
B1-9	1	và	Buprofezin	B1-46	1	và	Nithiazin
B1-10	1	và	Cartap	B1-47	1	và	Novaluron
B1-11	1	và	Cloranthraniliprol	B1-48	1	và	Oxamyl

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-12	1	và	Chlorfenapyr	B1-49	1	và	Phosmet
B1-13	1	và	Chlorpyrifos	B1-50	1	và	Pymetrozine
B1-14	1	và	Clothianidin	B1-51	1	và	Pyrethrin
B1-15	1	và	Cyantraniliprole	B1-52	1	và	Pyridaben
B1-16	1	và	Cyfluthrin	B1-53	1	và	Pyridalyl
B1-17	1	và	Cyhalothrin	B1-54	1	và	Pyriproxyfen
B1-18	1	và	Cypermethrin	B1-55	1	và	Ryanodine
B1-19	1	và	Cyromazine	B1-56	1	và	Spinetoram
B1-20	1	và	Deltamethrin	B1-57	1	và	Spinosad
B1-21	1	và	Dieldrin	B1-58	1	và	Spirodiclofen
B1-22	1	và	Dinotefuran	B1-59	1	và	Spiromesifen
B1-23	1	và	Diofenolan	B1-60	1	và	Spirotetramat
B1-24	1	và	Emamectin	B1-61	1	và	Sulfoxaflor
B1-25	1	và	Endosulfan	B1-62	1	và	Tebufenozit
B1-26	1	và	Esfenvalerat	B1-63	1	và	Tefluthrin
B1-27	1	và	Ethiprole	B1-64	1	và	Thiacloprid
B1-28	1	và	Fenothiocarb	B1-65	1	và	Thiametoxam
B1-29	1	và	Fenoxycarb	B1-66	1	và	Thiodicarb
B1-30	1	và	Fenvalerat	B1-67	1	và	Thiosultap-natri
B1-31	1	và	Fipronil	B1-68	1	và	Tolfenpyrad
B1-32	1	và	Flonicamid	B1-69	1	và	Tralomethrin
B1-33	1	và	Flubendiamit	B1-70	1	và	Triazamat
B1-34	1	và	Flufenoxuron	B1-71	1	và	Triflumuron
B1-35	1	và	Hexaflumuron	B1-72	1	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-36	1	và	Hydrametylnon	B1-73	1	và	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
B1-37	1	và	Imidacloprid	B1-74	1	và	NPV (ví dụ, Gemstar)

Bảng B2

Bảng B2 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 2. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B2 được ký hiệu là B2-1 và là hỗn hợp của hợp chất 2 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B3

Bảng B3 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 3. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B3 được ký hiệu là B3-1 và

là hỗn hợp của hợp chất 3 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B4

Bảng B4 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 4. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B4 được ký hiệu là B4-1 và là hỗn hợp của hợp chất 4 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B5

Bảng B5 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 5. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B5 được ký hiệu là B5-1 và là hỗn hợp của hợp chất 5 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B6

Bảng B6 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 6. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B6 được ký hiệu là B6-1 và là hỗn hợp của hợp chất 6 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B7

Bảng B7 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 7. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B7 được ký hiệu là B7-1 và là hỗn hợp của hợp chất 7 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B8

Bảng B8 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 8. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B8 được ký hiệu là B8-1 và là hỗn hợp của hợp chất 8 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B9

Bảng B9 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 9. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B9 được ký hiệu là B9-1 và là hỗn hợp của hợp chất 9 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B10

Bảng B10 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 10. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B10 được ký hiệu là B10-1 và là hỗn hợp của hợp chất 10 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B11

Bảng B11 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 11. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B11 được ký hiệu là B11-1 và là hỗn hợp của hợp chất 11 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B12

Bảng B12 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 12. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B12 được ký hiệu là B12-1 và là hỗn hợp của hợp chất 12 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B13

Bảng B13 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 13. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B13 được ký hiệu là B13-1 và là hỗn hợp của hợp chất 13 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B14

Bảng B14 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 14. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B14 được ký hiệu là

B14-1 và là hỗn hợp của hợp chất 14 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B15

Bảng B15 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 15. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B15 được ký hiệu là B15-1 và là hỗn hợp của hợp chất 15 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B16

Bảng B16 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 16. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B16 được ký hiệu là B16-1 và là hỗn hợp của hợp chất 16 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B17

Bảng B17 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 17. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B17 được ký hiệu là B17-1 và là hỗn hợp của hợp chất 17 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B18

Bảng B18 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 18. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B18 được ký hiệu là B18-1 và là hỗn hợp của hợp chất 18 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Bảng B19

Bảng B19 tương tự như bảng B1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất 19. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng B19 được ký hiệu là B2-1 và là hỗn hợp của hợp chất 19 và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung là abamectin.

Các hỗn hợp cụ thể được liệt kê trong các bảng từ B1 tới B19 là sự kết hợp thông thường giữa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác theo tỷ lệ đã nêu trong bảng A.

Sự liệt kê dưới đây trong các bảng từ C1 tới C19 là các hỗn hợp cụ thể bao gồm hợp chất có công thức 1 (hợp chất số được dùng để chỉ các hợp chất trong bảng mục lục A) và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung. Các bảng từ C1 đến C19 còn liệt kê tỷ lệ khối lượng cụ thể của các hỗn hợp trong các bảng từ C1 đến C19. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên đưa vào dòng đầu tiên của bảng C1 bộc lộ cụ thể hỗn hợp chứa hợp chất 1 của bảng mục lục A với abamectin được áp dụng với tỷ lệ khối lượng 100 phần hợp chất 1 trên 1 phần abamectin.

Bảng C1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Tỷ lệ hỗn hợp cụ thể (khối lượng)									
			100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-1	1	Abamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-2	1	Acetamiprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-3	1	Amitraz	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-4	1	Avermectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-5	1	Azadirachtin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-6	1	Bensultap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-7	1	Beta-xyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-8	1	Bifenthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-9	1	Buprofezin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-10	1	Cartap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-11	1	Cloranthraniliprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-12	1	Chlorfenapyr	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-13	1	Chlorpyrifos	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-14	1	Clothianidin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-15	1	Cyantraniliprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-16	1	Cyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-17	1	Cyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-18	1	Cypermethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-19	1	Cyromazine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-20	1	Deltamethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-21	1	Dieldrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-22	1	Dinotefuran	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-23	1	Diofenolan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-24	1	Enamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100
C1-25	1	Endosulfan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	1:100

C1-26	1	và	Esfenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	1	và	Ethiprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	1	và	Fenothiocarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	1	và	Fenoxycarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	1	và	Fenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	1	và	Fipronil	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	1	và	Flonicamid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	1	và	Flubendiamit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	1	và	Flufenoxuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	1	và	Hexaflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	1	và	Hydrametylnon	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	1	và	Imidacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	1	và	Indoxacarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	1	và	Lambda-xyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	1	và	Lufenuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	1	và	Metaflumizone	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	1	và	Metomyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	1	và	Metoprene	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	1	và	Metoxyfenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	1	và	Nitenpyram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	1	và	Nithiazin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	1	và	Novaluron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	1	và	Oxamyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	1	và	Phosmet	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	1	và	Pymetrozine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	1	và	Pyrethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	1	và	Pyridaben	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	1	và	Pyridalyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	1	và	Pyriproxyfen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	1	và	Ryanodine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	1	và	Spinetoram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	1	và	Spinosad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	1	và	Spirodiclofen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	1	và	Spiromesifen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	1	và	Spirotetramat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	1	và	Sulfoxaflor	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	1	và	Tebufenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	1	và	Tefluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	1	và	Thiacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	1	và	Thiametoxam	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-66	1	và	Thiodicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	1	và	Thiosultap-natri	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	1	và	Tolfenpyrad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	1	và	Tralomethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	1	và	Triazamat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	1	và	Triflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	1	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	1	và	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	1	và	NPV (ví dụ, Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Bảng C2

Bảng C2 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 2. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C2 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 2 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 2 trên 1 phần abamectin.

Bảng C3

Bảng C3 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 3. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C3 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 3 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 3 trên 1 phần abamectin

Bảng C4

Bảng C4 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 4. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C4 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 4 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 4 trên 1 phần abamectin

Bảng C5

Bảng C5 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 5. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C5 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 5 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 5 trên 1 phần abamectin

Bảng C6

Bảng C6 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 6. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C6 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 6 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 6 trên 1 phần abamectin

Bảng C7

Bảng C7 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 7. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C7 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 7 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 7 trên 1 phần abamectin

Bảng C8

Bảng C8 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 8. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C8 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 8 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 8 trên 1 phần abamectin

Bảng C9

Bảng C9 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 9. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C9 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 9 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 9 trên 1 phần abamectin

Bảng C10

Bảng C10 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 10. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C10 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 10 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 10 trên 1 phần abamectin.

Bảng C11

Bảng C11 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 11. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên

của bảng C11 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 11 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 11 trên 1 phần abamectin.

Bảng C12

Bảng C12 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 12. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C12 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 12 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 12 trên 1 phần abamectin.

Bảng C13

Bảng C13 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 13. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C13 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 13 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 13 trên 1 phần abamectin.

Bảng C14

Bảng C14 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 14. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C14 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 14 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 14 trên 1 phần abamectin.

Bảng C15

Bảng C15 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 15. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C15 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 15 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 15 trên 1 phần abamectin.

Bảng C16

Bảng C16 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 16. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên

của bảng C16 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 16 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 16 trên 1 phần abamectin.

Bảng C17

Bảng C17 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 17. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C17 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 17 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 17 trên 1 phần abamectin.

Bảng C18

Bảng C18 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 18. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C18 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 18 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 18 trên 1 phần abamectin.

Bảng C19

Bảng C19 tương tự như bảng C1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 19. Ví dụ, tỷ lệ khối lượng đầu tiên được đưa vào dòng đầu tiên của bảng C19 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của hợp chất số 19 của bảng mục lục A với abamectin được dùng với tỷ lệ khối lượng bằng 100 phần hợp chất số 19 trên 1 phần abamectin.

Các bảng từ D1 đến D19 liệt kê dưới đây là các phương án của chế phẩm cụ thể bao gồm hợp chất có công thức 1 (hợp chất số dùng để chỉ các hợp chất trong bảng mục lục A) và thuốc diệt nấm bổ sung.

Bảng D1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm
D1-1	1	và	Probenazol	D1-17	1	và	Difenoconazol
D1-2	1	và	Tiadinil	D1-18	1	và	Cyproconazol
D1-3	1	và	Isotianil	D1-19	1	và	Propiconazol
D1-4	1	và	Pyroquilon	D1-20	1	và	Fenoxanil
D1-5	1	và	Metominostrobin	D1-21	1	và	Ferimzone

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Thuốc diệt nấm
D1-6	1	và	Flutolanil	D1-22	1	và	Fthalogenua
D1-7	1	và	Validamycin	D1-23	1	và	Kasugamycin
D1-8	1	và	Furametpyr	D1-24	1	và	Picoxystrobin
D1-9	1	và	Pencycuron	D1-25	1	và	Penthiopyrad
D1-10	1	và	Simeconazol	D1-26	1	và	Famoxadon
D1-11	1	và	Orysastrobin	D1-27	1	và	Cymoxanil
D1-12	1	và	Trifloxystrobin	D1-28	1	và	Proquinazid
D1-13	1	và	Isoprothiolan	D1-29	1	và	Flusilazol
D1-14	1	và	Azoxystrobin	D1-30	1	và	Mancozeb
D1-15	1	và	Trioxclazol	D1-31	1	và	đồng hydroxit
D1-16	1	và	Hexaconazol	D1-32	1	và	(a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-điflophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon

Bảng D2

Bảng D2 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 2. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D2 được ký hiệu là D2-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 2 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D3

Bảng D3 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 3. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D3 được ký hiệu là D3-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 3 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D4

Bảng D4 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 4. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D4 được ký hiệu là D4-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 4 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D5

Bảng D5 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 5. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D5 được ký hiệu là D5-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 5 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D6

Bảng D6 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 6. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D6 được ký hiệu là D6-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 6 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D7

Bảng D7 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 7. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D7 được ký hiệu là D7-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 7 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D8

Bảng D8 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 8. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D8 được ký hiệu là D8-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 8 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D9

Bảng D9 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 9. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D9 được ký hiệu là D9-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 9 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D10

Bảng D10 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 10. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D10 được ký hiệu là D10-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 10 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D11

Bảng D11 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 11. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D11 được ký hiệu là D11-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 11 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D12

Bảng D12 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 12. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D12 được ký hiệu là D12-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 12 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D13

Bảng D13 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 13. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D13 được ký hiệu là D13-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 13 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D14

Bảng D14 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 14. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D14 được ký hiệu là D14-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 14 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D15

Bảng D15 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 15. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D15 được ký hiệu là D15-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 15 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D16

Bảng D16 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 16. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D16 được ký hiệu là D16-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 16 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D17

Bảng D17 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 17. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D17 được ký hiệu là D17-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 17 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D18

Bảng D18 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 18. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D18 được ký hiệu là D18-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 18 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Bảng D19

Bảng D19 tương tự như bảng D1, ngoại trừ hợp chất số 1 trong cột “hợp chất số” được thay bằng hợp chất số 19. Ví dụ, hỗn hợp đầu tiên trong bảng D19 được ký hiệu là D19-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 19 và thuốc diệt nấm bổ sung là probenazol.

Các loài gây hại không xương sống được phòng trừ trong các lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp bằng cách đưa một hoặc nhiều hoạt chất theo sáng chế, thường dưới dạng chế phẩm, với lượng hữu hiệu sinh học, vào môi trường của các loài gây hại, bao gồm các khu vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp bị phá hại, khu vực cần được bảo vệ, hoặc đưa trực tiếp lên các loài gây hại cần được phòng trừ.

Do đó, sáng chế đề cập tới phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp, bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế hoặc với chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này và lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Ví dụ về chế phẩm thích hợp chứa hợp chất theo sáng chế và lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung bao gồm chế phẩm dạng hạt, trong đó hoạt chất bổ sung có mặt trong cùng hạt chứa hợp chất theo sáng chế hoặc trong hạt riêng biệt với hợp chất theo sáng chế.

Các phương án theo sáng chế bao gồm bước cho tiếp xúc với môi trường. Đáng lưu ý rằng phương pháp mà trong đó môi trường này là thực vật. Cũng được lưu ý rằng phương pháp mà trong đó môi trường này là động vật. Cũng được lưu ý là phương pháp mà trong đó môi trường này là hạt giống.

Để đạt được việc tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống, hợp chất hoặc chế phẩm thường được áp dụng cho hạt của cây trước khi trồng, cho lá (ví dụ, lá, thân, hoa, quả) của cây trồng hoặc cho đất hoặc môi trường phát triển khác trước hoặc sau khi cây được trồng.

Theo một phương án, phương pháp tiếp xúc là bằng cách phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng hạt chứa hợp chất theo sáng chế có thể được phun lên tán lá hoặc vào đất. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được chuyển vận một cách hiệu quả qua sự hấp thụ của cây bằng cách cho cây tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế được phun vào đất ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất, chế phẩm dạng hạt, xử lý vườn ươm hoặc ngâm mảnh cấy ghép. Đáng lưu ý rằng chế phẩm theo sáng chế ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Cũng đáng lưu ý rằng phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với hợp chất theo sáng chế với lượng hữu hiệu sinh học. Tốt hơn nữa, nếu phương pháp trong đó môi trường là đất và hỗn hợp được đưa vào đất dưới dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Cũng đáng lưu ý rằng hợp chất theo sáng chế cũng hiệu quả bằng cách phun khu trú vào

khu vực bị phá hại. Các phương pháp tiếp xúc khác bao gồm phun hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trực tiếp và phun tồn lưu, phun khí, gel, phủ hạt, tạo vi nang, hấp thu có hệ thống, mối, vòng đeo tai, viên thức ăn, dạng sương mù, thuốc hun, dạng sol khí, dạng bụi và một số dạng khác. Một phương án về phương pháp tiếp xúc là dạng hạt phân bón ổn định về kích thước, dạng thoi hoặc dạng viên nén chứa hỗn hợp hoặc chế phẩm theo sáng chế. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể kết hợp với vật liệu để tạo ra dụng cụ phòng trừ động vật không xương sống (ví dụ, lưới bẫy côn trùng).

Hợp chất theo sáng chế là cũng có thể sử dụng để xử lý hạt để bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống. Trong bản mô tả này, xử lý hạt có nghĩa là cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo sáng chế, mà nó thường được bào chế dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Việc xử lý hạt này bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống trong đất và thường còn có thể bảo vệ rễ và các phần khác của cây khi tiếp xúc với đất của hạt phát triển từ hạt nảy mầm. Việc xử lý hạt có thể cũng có tác dụng bảo vệ lá bằng cách hoán chuyển hợp chất theo sáng chế hoặc hoạt chất thứ hai trong quá trình phát triển của cây. Phương pháp xử lý hạt có thể được dùng với tất cả các loại hạt, bao gồm hạt của thực vật được biến đổi gen để biểu hiện các tính trạng đặc biệt sẽ nảy mầm. Các ví dụ về các hạt này bao gồm các hạt biểu hiện độc tố protein đối với các loài gây hại không xương sống, như độc tố *Bacillus thuringiensis* hoặc các hạt biểu hiện tính chống chịu thuốc diệt cỏ như glyphosat axetyltransferaza, mà nó tạo ra khả năng kháng glyphosat. Việc xử lý hạt bằng các hợp chất theo sáng chế cũng có thể làm tăng sức sống của thực vật sinh trưởng từ hạt.

Một phương pháp xử lý hạt là phun hoặc rắc bụi lên hạt với hợp chất theo sáng chế (có nghĩa là dưới dạng hỗn hợp được bào chế) trước khi gieo hạt. Chế phẩm được bào chế để xử lý hạt thường chứa chất tạo màng hoặc chất bám dính. Do đó, thông thường chế phẩm bao hạt theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1 và chất tạo màng hoặc chất bám dính. Hạt có thể được bao bằng cách phun chất cô đặc huyền phù dễ chảy trực tiếp vào trống quay chứa hạt và sau đó sấy khô hạt. Theo cách khác, các loại chế phẩm khác như bột thấm ướt được, dung dịch, nhũ tương hỗn dịch, chất cô đặc nhũ hoá được và nhũ tương trong nước có thể được phun lên hạt. Quy trình này là đặc biệt hữu ích để tạo màng phủ lên hạt. Các máy bao phủ khác nhau và các quy trình có thể được người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này kiếm được dễ dàng. Các quy trình thích hợp bao gồm các quy trình được nêu trong ấn phẩm P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph số 57 và các tài liệu tham khảo được nêu trong đó.

Các hợp chất có công thức 1 và chế phẩm của chúng, ở dạng đơn lẻ và kết hợp với thuốc trừ sâu và thuốc diệt nấm khác, là đặc biệt hữu ích để xử lý hạt của cây trồng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, ngô hoặc bắp, đậu tương, bông, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và lúa gạo), khoai tây, rau và cải dầu.

Các thuốc trừ sâu khác với các hợp chất có công thức 1 có thể được bào chế để tạo ra hỗn hợp hữu ích cho việc xử lý bao gồm abamectin, axetamiprit, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadiractin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, cloranthraniliprol, clorfenapyr, clopyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermetrin, alpha-xypermetrin, zeta-xypermetrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flonicamit, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinat, formetanate, fosthiazate, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiodicarb, metomyl, metoprene, metoxyfenozit, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomeethrin, triazamat, triflumuron, nội độc tố đenta *Bacillus thuringiensis*, tất cả các chủng của *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng của virus *Nucleo polyhydrosis*.

Thuốc diệt nấm với các hợp chất có công thức 1 có thể được chế hóa để tạo ra hỗn hợp hữu ích trong việc xử lý hạt bao gồm amisulbrom, azoxystrobin, boscalid, carbendazim, carboxin, xymoxanil, cyproconazol, difenoconazol, dimetomorph, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolide, fluoxastrobin, flutriafol, fluxapyroxad, ipconazol, iprodion, kim loại axyl, mefenoxam, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penflufen, picoxystrobin, prothioconazol, pyraclostrobin, sedaxane, silthiofam, tebuconazol, thiabendazol, thiophanat-metyl, thiram, trifloxystrobin và triticonazol.

Chế phẩm bao gồm các hợp chất có công thức 1 là hữu ích trong việc xử lý hạt có thể còn bao gồm vi khuẩn như *Bacillus pumilus* (ví dụ, chủng GB34) và *Bacillus firmus* (ví dụ, 1582 phân lập), chất tiêm chủng/bổ trợ vi khuẩn nốt rỗ, isoflavonoit và lipochitoooligosacarit.

Hạt đã xử lý thường chứa hợp chất theo sáng chế trong với lượng nằm trong khoảng từ 0,1g đến 1kg cho 100kg hạt (có nghĩa là nằm trong khoảng từ 0,0001% đến 1% trọng lượng của hạt trước khi xử lý). Huyền phù dễ rót được bào chế để xử lý hạt

thường chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 70%, chất bám dính tạo màng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 30%, chất phân tán nằm trong khoảng từ 0,5% đến 20%, chất cô đặc nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, bột màu và/hoặc thuốc nhuộm nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, chất chống tạo bọt nằm trong khoảng từ 0 đến 2%, chất bảo quản nằm trong khoảng từ 0 đến 1% và chất pha loãng lỏng dễ bay hơi nằm trong khoảng từ 0 đến 75%.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được kết hợp vào chế phẩm môi để các loài gây hại không xương sống ăn hoặc được sử dụng trong các dụng cụ như bẫy, môi, và các dụng cụ tương tự. Chế phẩm môi như vậy có thể là dạng hạt bao gồm (a) hoạt chất, cụ thể là lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, hoặc muối của nó; (b) một hoặc một số nguyên liệu thức ăn; (c) chất hấp dẫn, và tùy ý (d) một hoặc một số chất giữ ẩm. Đáng lưu ý rằng hạt hoặc chế phẩm môi chứa từ 0,001% đến 5% hoạt chất, từ 40% đến 99% nguyên liệu thức ăn và/hoặc chất hấp dẫn; và tùy ý từ 0,05% đến 10% chất giữ ẩm, là hữu hiệu để phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong đất ở các tỷ lệ dùng rất thấp, cụ thể là ở các liều lượng hoạt chất gây chết bằng cách ăn chứ không phải bằng cách tiếp xúc trực tiếp. Một số nguyên liệu thức ăn có thể làm đóng vai trò làm nguồn thức ăn và chất hấp dẫn. Nguyên liệu thức ăn bao gồm carbohydrat, protein và lipid. Ví dụ về nguyên liệu thức ăn là bột mỳ thực vật, đường, tinh bột, mỡ động vật, dầu thực vật, dịch chiết nấm và chất rắn sữa. Ví dụ về chất hấp dẫn là chất thơm và chất tạo hương, như dịch chiết quả hoặc thực vật, nước hoa, hoặc các thành phần động vật hoặc thực vật khác, pheromon hoặc các chất khác đã biết để hấp dẫn các loài gây hại không xương sống. Ví dụ về chất giữ ẩm, tức là chất giữ độ ẩm, là glycol và các polyol khác, glycerin và sorbitol. Đáng lưu ý rằng chế phẩm môi (và phương pháp sử dụng chế phẩm môi này) được sử dụng để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm kiến, mối và gián. Dụng cụ để phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể bao gồm chế phẩm môi theo sáng chế và hộp phù hợp để chứa chế phẩm môi, trong đó hộp này có ít nhất một lỗ hổng có độ lớn nhất định để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua sao cho loài gây hại không xương sống có thể lấy được chế phẩm môi từ địa điểm bên ngoài hộp, và hộp này còn phù hợp để được đặt trong hoặc gần vị trí vùng hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được dùng mà không cần các chất bổ trợ khác, nhưng phần lớn các trường hợp là dùng chế phẩm chứa một hoặc một số hoạt chất với chất mang, chất pha loãng, và chất hoạt động bề mặt thích hợp và có thể kết hợp với thức ăn tùy thuộc vào mục đích sử dụng cuối cùng. Một phương pháp dùng là phun chất phân tán nước hoặc dung dịch dầu tinh chế chứa hợp chất theo sáng chế. Việc kết hợp với dầu

phun, dầu phun cô đặc, chất dính phát tán, chất bổ trợ, các dung môi khác, và chất hiệp đồng như piperonyl butoxit thường làm tăng hiệu quả của hợp chất. Đối với các mục đích phi nông nghiệp, việc phun này có thể dùng các dụng cụ chứa như bình, chai hoặc các dụng cụ chứa khác, bằng cách bơm hoặc bằng cách giải phóng nó từ dụng cụ chứa tăng áp, ví dụ, bình phun sol khí tăng áp. Các chế phẩm phun này có thể ở nhiều dạng khác nhau, ví dụ, dạng phun, dạng mù, dạng bột, dạng khói hoặc dạng sương mù. Do đó, các chế phẩm phun này còn có thể chứa chất đẩy, chất tạo bột, v.v. khi cần thiết. Đáng lưu ý rằng chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất mang. Theo một phương án thực hiện, chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất đẩy. Ví dụ về các chất đẩy bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, metan, etan, propan, butan, isobutan, buten, pentan, isopentan, neopentan, penten, hydroflocacbon, cloflocacbon, dimetyl ete, và hỗn hợp của các chất nêu trên. Đáng lưu ý là chế phẩm phun (và phương pháp sử dụng chế phẩm phun được phân tán từ thùng phun) được sử dụng ở dạng riêng lẻ hoặc kết hợp để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm muỗi, ruồi đen, ruồi chó, ruồi châu Mỹ, ruồi ngựa, ong bắp cày, ong bắp cày đen và vàng, ve, nhện, kiến, muỗi mắt, và các loài động vật gây hại tương tự.

Ứng dụng trong lĩnh vực phi nông nghiệp dùng để chỉ việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong phạm vi không phải cây trồng. Việc ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong bảo quản hạt, hột và các loại thực phẩm khác và trong hàng dệt như quần áo và thảm. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong cây trang trí, cây lâm nghiệp, trong hàng rào, dọc lề đường và đường xe lửa và khu vực có cỏ như bãi cỏ, sân gôn và đồng cỏ. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong nhà ở và công trình kiến trúc khác thể là được sử dụng bởi người, trang trại, gia súc, vườn thú hoặc các động vật khác. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại như mối có thể làm hư hại gỗ hoặc các vật liệu kết cấu khác được sử dụng trong công trình này.

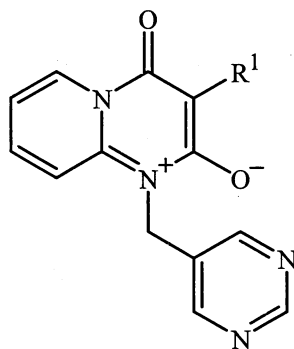
Để dùng trong nông nghiệp, tỷ lệ dùng cần thiết để phòng trừ hiệu quả (tức là "lượng hữu hiệu sinh học") sẽ tùy thuộc vào các yếu tố như loài gây hại không xương sống cần được phòng trừ, vòng đời của loài gây hại, giai đoạn sống, kích cỡ của nó, nơi sống, thời gian trong năm, cây trồng hoặc động vật chủ, tập tính ăn, tập tính giao phối, độ

ẩm xung quanh, nhiệt độ, và các yếu tố tương tự. Trong trường hợp thông thường, tỷ lệ dùng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 2 kg hoạt chất cho mỗi hecta là đủ để phòng trừ các loài gây hại trong hệ sinh thái nông nghiệp, nhưng có khi chỉ cần với tỷ lệ nhỏ 0,0001 kg/hecta là đủ hoặc có thể cần đến tỷ lệ 8 kg/hecta mới đủ. Để dùng trong lĩnh vực phi nông nghiệp, tỷ lệ dùng hữu hiệu sẽ nằm trong khoảng từ 1,0 đến 50mg/m² nhưng có khi chỉ cần với tỷ lệ nhỏ 0,1mg/m² là đủ hoặc có thể cần với tỷ lệ đến 150mg/m² mới đủ. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể dễ dàng xác định được lượng hữu hiệu sinh học cần thiết để thu được hiệu quả phòng trừ loài gây hại không xương sống mong muốn. Lượng hữu hiệu sinh học để làm tăng sức sống của thực vật thường tương đương với lượng hữu hiệu để phòng trừ loài gây hại không xương sống, và lượng tối ưu để thu được mức tăng sức sống đặc biệt của thực vật có thể xác định thông qua thử nghiệm đơn giản.

Các hợp chất đại diện theo sáng chế được điều chế bằng các phương pháp được mô tả trong bản mô tả này được nêu trong bảng mục lục A. Xem Bảng mục lục B về dữ liệu ¹H NMR. Đối với dữ liệu phổ khối (AP⁺ (M+1)), trị số được thông báo là phân tử lượng của ion phân tử gốc (M⁺) được tạo thành bằng cách bổ sung H⁺ (phân tử lượng bằng 1) cho phân tử này để tạo ra pic M+1 quan sát được bằng phổ khối bằng cách sử dụng phép ion hoá hoá học ở áp suất khí quyển (AP⁺). Các pic ion phân tử khác (ví dụ, M+2 hoặc M+4) xuất hiện với các hợp chất chứa nhiều halogen không được thông báo.

Các từ viết tắt dưới đây được sử dụng trong bảng mục lục như sau: Cmpd có nghĩa là hợp chất.

Bảng mục lục A



Cmpd	R ¹	Nhiệt độ nóng chảy (°C)	AP ⁺ (M+1)
1	phenyl	211-212	
2	4-florophenyl		349
3	3-(triflometyl)phenyl	183-185	

Cmpd	R ¹	Nhiệt độ nóng chảy (°C)	AP ⁺ (M+1)
4	2-metoxyphephenyl		361
5	3-metoxyphephenyl		361
6	2,4-điflophenyl	*	
7	3-(triflometoxy)phenyl		415
8	3-bromophenyl	*	
9	2-flophenyl		349
10	2-flo-5-(triflometyl)phenyl	*	
11	3-metylphenyl	*	
12	4-flo-3-(triflometyl)phenyl		417
13	4-clo-2-flophenyl		459
14	2-clophenyl		365
15	3-clo-5-(triflometyl)phenyl		433
16	3,5-điclophenyl		399
17	3,5-điclo-4-flophenyl		417
18	4'-xyano-5,2'-đimetyl[1,1'-biphenyl]-3-yl		460
19	3-clophenyl	*	

* Xem Bảng mục lục B đối với dữ liệu ¹H NMR.

Bảng mục lục B

Cmpd	Dữ liệu ¹ H NMR ^a
6	(axeton-d ₆) δ 9,41 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,89 (s, 2H), 8,36 (t, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,56-7,58 (m, 2H), 6,96-7,00 (m, 2H), 5,74 (s, 2H).
8	(axeton-d ₆) δ 9,47 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,90 (s, 2H), 8,36 (t, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,93-7,95 (m, 2H), 7,59 (t, 1H), 7,24-7,30 (m, 2H), 5,76 (s, 2H).
10	(axeton-d ₆) δ 9,43 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,90 (s, 2H), 8,39 (t, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,95 (dd, 1H), 7,64-7,68 (m, 1H), 7,60 (t, 1H), 7,35 (t, 1H), 5,76 (s, 2H).
11	(dmso-d ₆) δ 9,33 (d, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,82 (s, 2H), 8,27 (t, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,47-7,54 (m, 2H), 7,26 (t, 1H), 6,99 (d, 1H), 5,59 (s, 2H), 2,31 (s, 3H).
19	(dmso-d ₆) δ 9,34 (d, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,83 (s, 2H), 8,29 (dt, 1H), 7,77-7,88 (m, 3H), 7,55 (dt, 1H), 7,32-7,36 (m, 1H), 7,23 (d, 1H), 5,60 (s, 2H).

^a Dữ liệu ¹H NMR được tính theo ppm tính từ tetrametylsilan. Dung dịch CDCl₃ trừ khi có quy định khác; “axeton-d₆” là CD₃C(=O)CD₃, “dmso-d₆” là CD₃S(=O)CD₃. Sự liên

hợp được chỉ định bằng (s)-vạch đơn, (d)-vạch đôi, (t)-vạch ba, (m)-đa vạch, (dd)-cặp vạch đôi, (ddd)-vạch đôi của cặp vạch đôi, (dt)-cặp vạch ba, (td)-vạch ba của vạch đôi, (br)-rộng.

Các thử nghiệm sau chứng minh hiệu quả phòng trừ của hợp chất theo sáng chế đối với loài gây hại cụ thể. “Hiệu quả phòng trừ” là khả năng ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (kể cả làm chết) dẫn đến việc giảm ăn một cách đáng kể. Tuy nhiên, việc bảo vệ phòng trừ loài gây hại tạo ra bởi các hợp chất này không bị hạn chế ở các loài này. Xem Bảng mục lục A về thành phần hợp chất.

Ví dụ sinh học

Thử nghiệm A

Để đánh giá mức độ phòng trừ sâu tơ (*Plutella xylostella*), sử dụng mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ hờ chứa cây củ cải từ 12-14 ngày tuổi. Các nhóm cây này được làm nhiễm bệnh từ trước bằng 50 ấu trùng được đưa vào mẫu thử nghiệm bằng bột yến mạch ngô bằng cách sử dụng dụng cụ cấy kiểu bazoka. Ấu trùng được chuyển lên cây thử nghiệm sau khi được đưa vào mẫu thử nghiệm.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế trong dung dịch gồm 10% axeton, 90% nước và 300ppm chất hoạt động bề mặt không ion X-77[®] Spreader Lo-Foam chứa alkylarylpolyoxyetylen, axit béo tự do, glycol và 2-propanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Các hợp chất pha chế này được phun với lượng 1ml dung dịch bằng máy phun SUJ2 với vòi phun ở 1/8 JJ thân máy tùy chỉnh (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) được đặt ở vị trí 1,27cm (0,5 in) phía trên mỗi mẫu thử nghiệm. Tất cả các hợp chất thử nghiệm trong thử nghiệm này được phun với nồng độ 250, 50 và/hoặc 10 ppm, và được lặp lại ba lần. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm, mỗi mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và trước khi đặt nắp lưới màu đen lên trên. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 25°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó, mức độ phá hại cây trồng được đánh giá bằng cách quan sát bằng mắt thường dựa trên số lá đã bị ăn.

Trong số các hợp chất chất có công thức 1 thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp sau đây thể hiện tác dụng bảo vệ thực vật từ rất tốt đến tuyệt vời (mức độ phá hoại cây là 40% hoặc thấp hơn và/hoặc tỷ lệ chết là 100%): 1, 3, 4, 7, 8, 13 và 15.

Trong số các hợp chất chất có công thức 1 thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp sau đây thể hiện tác dụng bảo vệ thực vật từ rất tốt đến tuyệt vời (mức độ phá hoại cây là 40% hoặc thấp hơn và/hoặc tỷ lệ chết là 100%): 1, 3, 4, 5, 8 và 19.

Trong số các hợp chất chất có công thức 1 thử nghiệm ở nồng độ 10ppm, các hợp chất sau đây thể hiện tác dụng bảo vệ thực vật từ rất tốt đến tuyệt vời (mức độ phá hoại cây là 40% hoặc thấp hơn và/hoặc tỷ lệ chết là 100%): 7, 15, 16 và 17.

Thử nghiệm B

Để đánh giá mức độ phòng trừ rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây củ cải từ 12 đến 15 ngày tuổi. Các cây này được làm nhiễm bệnh từ trước bằng cách đưa lên lá của cây thử nghiệm từ 30 đến 40 rệp cây ở miếng lá được cắt ra từ cây (phương pháp cắt lá). Các con rệp được đưa lên cây thử nghiệm khi miếng lá khô. Sau khi làm nhiễm bệnh từ trước, đất chứa trong mẫu thử nghiệm được phủ bằng một lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250ppm, 50ppm và/hoặc 10ppm như được mô tả trong thử nghiệm A. Việc phun được lặp lại ba lần. Sau khi phun hợp chất hoặc chế phẩm đã điều chế, mỗi mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và sau đó đặt nắp lưới màu đen lên trên. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 19°C đến 21°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 50 đến 70%. Sau đó, mỗi đơn vị thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về tỷ lệ rệp chết.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 1 và 3.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 1, 3, 15, 16 và 19.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 10ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 15.

Thử nghiệm C

Để đánh giá mức độ phòng trừ rệp vùng bông dưa (*Aphis gossypii*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ để hở chứa bên trong cây bông từ 6 đến 7 ngày tuổi. Các cây này được làm nhiễm bệnh từ trước bằng từ 30 đến 40 côn trùng lên miếng lá theo phương pháp cắt lá được mô tả trong thử nghiệm B, và đất trong mẫu thử nghiệm này được phủ một lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250ppm và/hoặc 50 ppm như được mô tả trong thử nghiệm B. Việc phun được lặp lại ba lần. Sau

khi phun, các mẫu thử nghiệm được giữ trong buồng sinh trưởng và sau đó được quan sát bằng mắt như được mô tả trong thử nghiệm C.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 1 và 3.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây có tác dụng làm chết côn trùng ít nhất là 80%: 3, 7 và 12.

Thử nghiệm D

Để đánh giá mức độ phòng trừ của bộ nhảy hại ngô (*Peregrinus maidis*) qua cách tiếp xúc và/hoặc nội hấp, nhóm thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ để hở với cây bắp 3-4 ngày tuổi (cụm hoa) bên trong. Cát trắng được bổ sung vào phía trên mặt đất trước khi tiến hành thử nghiệm. Hợp chất thử nghiệm được bào chế và phun với nồng độ 250ppm, 50 ppm, 10ppm và/hoặc 2ppm, và lặp lại ba lần như được mô tả trong thử nghiệm A. Sau khi phun, nhóm thử nghiệm được để khô 1 giờ trước khi chúng được làm nhiễm bệnh trước với ~15-20 nhộng (từ 18 đến 21 ngày tuổi) bằng cách rắc chúng lên cát bằng cái rắc muối. Nắp đáy bằng lưới màu đen được đặt trên đỉnh của ống hình trụ. Miếng thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 22-24°C và độ ẩm tương đối 50-70%. Mỗi mẫu thử nghiệm sau đó được đánh giá bằng mắt thường về tỷ lệ làm chết côn trùng.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm các hợp chất sau đây thể hiện tác dụng bảo vệ thực vật từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 2, 3 và 10.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 2, 3, 4, 5, 9, 10, 11, 12, 15, 16, 17, 18 và 19.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 10ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 2, 3, 5, 10, 11, 12, 15, 16, 17 và 19.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 2ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 2, 3 và 15.

Thử nghiệm E

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ bộ nhảy hại lá khoai tây (*Empoasca fabae*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa

nhỏ, để hở chứa bên trong các cây đậu Soleil từ 5 đến 6 ngày tuổi (mới nhú lá mầm). Cát trắng được phủ lên lớp đất, và một trong số các lá mầm được ngắt ra trước khi phun.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250ppm, 50ppm, 10ppm và/hoặc 2ppm, và các thử nghiệm được lặp lại ba lần như được mô tả trong thử nghiệm A. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ trước khi chúng được gây nhiễm bằng 5 con bọ nhảy hại lá khoai tây (các con trưởng thành từ 18 đến 21 ngày tuổi). Lưới chụp màu đen được chụp lên trên thùng chứa. Các mẫu thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 24°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt về tỷ lệ tử vong của côn trùng.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1 và 3.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ vật từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 15, 18 và 19.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 100ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 2, 3, 5, 6, 7, 9, 11, 12, 15 và 19.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 2ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 1, 7 và 15.

Thử nghiệm F

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ bọ trĩ hại hoa miền Tây (*Frankliniella occidentalis*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm thùng chứa nhỏ, để hở chứa bên trong các cây đậu Soleil từ 5 đến 7 ngày tuổi.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250ppm, và các thử nghiệm được lặp lại ba lần như được mô tả trong thử nghiệm A. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 1 giờ, cho từ 22 đến 27 con bọ trĩ trưởng thành vào mỗi mẫu và sau đó đặt nắp lưới màu đen lên trên và các mẫu thử nghiệm được giữ trong 7 ngày ở 25°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 45% đến 55%.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (mức độ phá hoại cây là 30% hoặc thấp hơn và/hoặc tỷ lệ chết là 100%): 1 và 4.

Thử nghiệm G

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ rầy xanh đuôi đen hại lúa (*Nephotettix virescens*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm chậu làm bằng chất dẻo trồng cây lúa cao 13cm được bao phủ bằng lưới dây thép (50 lưới) được đỡ bởi khung dây. Lượng cát nhỏ được bổ sung để tạo ra sự kết dính tốt giữa mặt đáy của lưới dây, bề mặt đất và bờ trên của chậu làm bằng chất dẻo.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 250ppm, 50ppm, 10ppm và/hoặc 2ppm, và các thử nghiệm được lặp lại ba lần như được mô tả trong thử nghiệm A. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 2 giờ trước khi chúng được gây nhiễm bằng 10 con rầy xanh đuôi đen hại lúa (nhộng giai đoạn 3, 7—9 ngày sau khi nở). Sau 5 ngày, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt về tỷ lệ tử vong của côn trùng.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 2, 3, 7, 10, 11 và 12.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 10ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 2, 3, 7, 10 và 11.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 2ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 3 và 7.

Thử nghiệm H

Để đánh giá hiệu quả phòng trừ ve sầu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, sử dụng mỗi mẫu thử nghiệm gồm chậu làm bằng chất dẻo trồng cây lúa cao 13cm được bao phủ bằng lưới dây thép (50 lưới) được đỡ bởi khung dây. Lượng cát nhỏ được bổ sung để tạo ra sự kết dính tốt giữa mặt đáy của lưới dây, bề mặt đất và bờ trên của chậu làm bằng chất dẻo.

Các hợp chất thử nghiệm được pha chế và được phun với nồng độ 10, 2 và/hoặc 0,4ppm, và các thử nghiệm được lặp lại ba lần như được mô tả trong thử nghiệm A. Sau khi phun, các mẫu thử nghiệm được để khô trong 2 giờ trước khi chúng được gây nhiễm bằng 10 con rầy xanh đuôi đen hại lúa (nhộng giai đoạn 3, 7—9 ngày sau khi nở). Sau 5 ngày, mỗi mẫu thử nghiệm được đánh giá bằng mắt về tỷ lệ tử vong của côn trùng.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 2, 3, 7, 9, 10, 11, 12 và 15.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 2, 3, 7 và 10.

Trong số các hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau đây thể hiện hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời (tỷ lệ chết 80% hoặc cao hơn): 7.

Để đánh giá mức độ ảnh hưởng của việc dùng hợp chất theo sáng chế về sức sống của cây lúa sinh trưởng trong các điều kiện ngoài trời, các thử nghiệm từ I đến O được tiến hành. “a.i.” được dùng để chỉ lượng hoạt chất được dùng.

Thử nghiệm I

Cây lúa (cây indica ‘MTU1010’) được cấy vào miếng đất thử nghiệm 5m × 3m ngập đất sét trộn trong khu vực châu thổ vùng West Godavri, Andhra Pradesh, Ấn độ, trong suốt mùa mưa, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng các kỹ thuật nông học địa phương. Sau 47 ngày, hỗn hợp nước gồm hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với lượng 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha với thể tích phun 387 L/ha nhờ sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng lúa không được phun được sử dụng làm mẫu đối chứng. Mỗi miếng đất thử nghiệm và đối chứng được tiến hành ba lần, và các miếng đất này được bố trí theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm đưa hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sâu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là cao, tức là lớn hơn nhiều so với nồng độ được xem là có ý nghĩa kinh tế.

Sức sống của cây trồng của cây lúa trong mỗi miếng đất được đánh giá bằng mắt dựa trên hình thức tổng quan bên ngoài (ví dụ, chiều cao của cây) 20 ngày sau khi đưa với phạm vi nằm trong khoảng từ 0 đến 200%, trong đó thực vật ở miếng đất đối chứng không được xử lý được coi là 100%, và các kết quả ở 3 lần tiến hành như nhau đối với mỗi lần xử lý được lấy trung bình. Lớn hơn 100% có nghĩa là cây ở miếng đất được xử lý có sức sống cao hơn các cây ở miếng đất đối chứng không được xử lý, trong khi đó nhỏ hơn 100% có nghĩa là cây ở miếng đất được xử lý có sức sống kém hơn. Cây lúa được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 12,5, 25 và 50g a.i./ha đã chứng minh rằng có sức sống của cây trồng bằng 140%, 143% và 143%, tương ứng, khi so sánh với 100% cây đối chứng không được xử lý.

Thử nghiệm J

Cây lúa (cây indica 'MTU1010') được cấy vào miếng đất thử nghiệm 5m × 3m ngập đất sét trộn trong khu vực châu thổ vùng West Godavri, Andhra Pradesh, Ấn độ, trong suốt mùa mưa, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng các kỹ thuật nông học địa phương. Sau 52 ngày, hỗn hợp nước chứa hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với lượng 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha với thể tích phun 387L/ha nhờ sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng lúa không được phun được sử dụng làm mẫu đối chứng. Mỗi miếng đất thử nghiệm và đối chứng được tiến hành ba lần, và các miếng đất này được bố trí theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm đưa hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sầu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là cao, tức là lớn hơn nồng độ được coi là có ý nghĩa kinh tế. 20 ngày sau lần xử lý đầu tiên, việc đưa hỗn hợp nước chứa hợp chất 3 lên lá được lặp lại với cùng tốc độ dùng với thể tích phun 467L/ha.

Sức sống của cây lúa trên mỗi miếng đất được đánh giá bằng mắt 48 ngày sau lần dùng đầu tiên với phạm vi nằm trong khoảng từ 0 đến 200% như được mô tả đối với thử nghiệm I. Cây lúa được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 12,5, 25 và 50g a.i./ha đã chứng minh rằng có sức sống của cây trồng lần lượt bằng 148%, 148% và 148% khi so sánh với 100% cây đối chứng không được xử lý.

Thử nghiệm K

Cây lúa (cây indica 'JAYA') được cấy vào miếng đất thử nghiệm 6m × 5m ngập đất sét trộn trong điều kiện bóng tối ở bang Gujarat, Ấn độ trong suốt mùa khô trước khi mùa mưa tới, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng các kỹ thuật nông học địa phương. Do đó, sau 44 ngày cấy, tất cả các cây lúa trong thử nghiệm này được phun hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha xypermethrin và 100g a.i./ha picoxystrobin. Sau 53 ngày cấy, hỗn hợp nước chứa hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với lượng 6,25, 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha với thể tích phun 500L/ha nhờ sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng lúa không được phun được sử dụng làm mẫu đối chứng. Mỗi miếng đất thử nghiệm và đối chứng được tiến hành ba lần, và các miếng đất này được bố trí theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm đưa hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sầu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là thấp, nhưng vẫn lớn hơn nồng độ được coi là có ý nghĩa kinh tế.

Sức sống của cây lúa trên mỗi miếng đất được đánh giá bằng mắt 32 ngày sau lần dùng đầu tiên với phạm vi nằm trong khoảng từ 0 đến 200% như được mô tả đối với thử

thử nghiệm I. Cây lúa được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 6,25, 12,5, 25 và 50g a.i./ha đã chứng minh được rằng sức sống của cây trồng lần lượt bằng 115%, 113%, 122% và 115%, khi so sánh với 100% cây đối chứng không được xử lý.

Sau 45 ngày dùng, chiều cao và độ dài chùy của cây lúa được đo. Chiều cao của cây được xác định bằng cách đo chiều dài từ đầu lá dài nhất theo chiều thẳng đứng đến bề mặt đất. Chiều dài của chùy được đo tương tự. Chiều cao trung bình của cây lúa được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 6,25, 12,5, 25 và 50g a.i./ha lần lượt bằng 0,94, 0,92, 0,92 và 0,99m, khi so sánh với 0,78m đối với cây đối chứng không được xử lý. Chiều dài chùy trung bình của cây lúa được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 6,25, 12,5, 25 và 50g a.i./ha lần lượt bằng 23,8, 23,7, 24,9 và 24,6cm, khi so sánh với 22,4cm của cây đối chứng không được xử lý. Trong khi chỉ được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 25 và 50g a.i./ha làm tăng đáng kể chiều dài chùy, thì toàn bộ các lần xử lý về cơ bản làm tăng chiều cao của thực vật.

Thử nghiệm L

Cây lúa (cây indica 'IR 64') được cấy vào miếng đất thử nghiệm 6m × 5m ngập đất sét trộn ở vùng Dhamtari, bang Chhattisgarh, Ấn độ, vào chớm mùa xuân, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng các kỹ thuật nông học địa phương. Sau 79 ngày, vào mùa khô trước khi mùa mưa tới, hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD[®], 20g a.i./ha chlorantraniliprol, và 6,25, 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với thể tích phun 500L/ha nhờ sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng cây lúa đối chứng được phun hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD[®] và 20g a.i./ha chlorantraniliprol (tức là không phải hợp chất 3). Mỗi mẫu thử nghiệm và đối chứng được tiến hành ba lần, và các miếng đất được sắp xếp theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm đưa hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sâu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là cao, tức là lớn hơn nồng độ được coi là có ý nghĩa kinh tế.

Sức sống của cây lúa trên mỗi miếng đất được đánh giá bằng mắt sau 21 ngày dùng với phạm vi nằm trong khoảng từ 0 đến 200% như được mô tả đối với thử nghiệm I. Ở tất cả các tỷ lệ dùng, cây lúa đã xử lý có sức sống của cây trồng (tức là 100%) giống như cây đối chứng không được xử lý. Ngay cả khi nồng độ gây hại là cao, thì ở thời điểm xử lý các cây đã đạt tới chiều cao tối đa và chùy đã phát triển, so việc xử lý bằng hợp chất 3 ở thời điểm quá muộn để làm tăng đáng kể sức sống của cây trồng được đánh giá bằng hình thức tổng quan bên ngoài (ví dụ, chiều cao của cây, số lượng chùy). Tuy nhiên, việc xử lý

về cơ bản là phù hợp với sức sống của cây trồng như được xác định bằng hiệu suất thu hoạch. Hiệu suất thu hoạch cây trồng được xử lý bằng hợp chất 3 với lượng 6,25, 12,5, 25 và 50g a.i./ha lần lượt bằng 4630, 4830, 4730 và 4930 kg/ha, khi so sánh với 2630kg/ha đối với cây không được xử lý. Do đó, ngay khi xử lý muộn về cơ bản hiệu suất được tăng lên hiệu suất bằng cách ngăn ngừa sự tấn công của ve sâu nhảy, có thể làm dừng quy trình tạo hạt, dẫn đến làm rỗng chùy.

Thử nghiệm M

Cây lúa (cây indica) được gieo hạt trực tiếp vào miếng đất thử nghiệm 6m × 5m ngập đất sét ở tỉnh An Giang của Việt Nam trước khi mùa mưa đến sớm, và sinh trưởng bằng cách sử dụng các kỹ thuật nông học địa phương. Sau 42 ngày, ở thời điểm bắt đầu mùa ẩm, hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD[®], 20g a.i./ha clorantpriliprol, và 6,25, 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với thể tích phun 400L/ha bằng cách sử dụng bình phun gắn động cơ. Các miếng đất trồng cây lúa đối chứng được phun hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD[®] và 20g a.i./ha clorantpriliprol (tức là không phải hợp chất 3). Mỗi mẫu đã xử lý và mẫu đối chứng được thực hiện ba lần, và các miếng đất được sắp xếp theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm dùng hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sâu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là rất thấp.

Sức sống của cây lúa trong mỗi miếng đất được đánh giá bằng mắt sau 18 ngày dùng với phạm vi nằm trong khoảng từ 0 đến 200% như được mô tả đối với thử nghiệm I. Ở tất cả các tỷ lệ dùng, cây lúa đã xử lý có sức sống tương đương (tức là 100%) so với cây đối chứng không được xử lý. Do nồng độ gây hại là rất thấp và các điều kiện sinh trưởng là lý tưởng, việc dùng Hợp chất 3 không làm tăng đáng kể sức sống của cây.

Thử nghiệm N

Cây lúa (cây indica 'Swarna') được cấy vào miếng đất thử nghiệm 4m × 3m ngập đất sét ở khu vực Bargarh district, Orissa, Ấn độ, trong suốt mùa mưa, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng kỹ thuật nông học địa phương. Sau 70 ngày, hỗn hợp nước chứa hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với lượng 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha với thể tích phun 400L/ha bằng cách sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng lúa không được phun được dùng làm mẫu đối chứng. Mỗi mẫu xử lý và mẫu đối chứng được thực hiện ba lần, và các miếng đất được sắp xếp theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên.

Ở thời điểm dùng hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sầu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là cao, tức là lớn hơn nồng độ được coi là có ý nghĩa kinh tế. Sau 14 ngày xử lý đầu tiên, việc dùng trên lá của hỗn hợp nước chứa hợp chất 3 được lặp lại với cùng tỷ lệ dùng với thể tích phun 400L/ha.

Hiệu suất thu hoạch cây trồng được xử lý bằng 12,5, 25 và 50g a.i./ha hợp chất 3 lần lượt bằng 3190, 3660 và 4220kg/ha, khi so sánh với 620kg/ha các mẫu đối chứng không được xử lý.

Thử nghiệm O

Cây lúa (cây indica 'IR-64') được cấy vào miếng đất thử nghiệm 5m × 5m ngập đất sét ở khu vực Bargarh, Orissa, Ấn độ, vào cuối mùa đông, và được sinh trưởng bằng cách sử dụng kỹ thuật nông học địa phương. Sau 79 ngày, hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD®, 20g a.i./ha clorantpriliprol, và 6,25, 12,5, 25 hoặc 50g a.i./ha hợp chất 3 được đưa lên tán lá của cây lúa với thể tích phun 500L/ha bằng cách sử dụng bình phun đeo lưng. Các miếng đất trồng cây lúa đối chứng được phun hỗn hợp nước chứa 30g a.i./ha indoxacarb dưới dạng thuốc trừ sâu STEWARD® và 20g a.i./ha clorantpriliprol (tức là không phải là hợp chất 3). Mỗi mẫu xử lý và mẫu đối chứng được thực hiện ba lần, và các miếng đất được sắp xếp theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên. Ở thời điểm dùng hợp chất 3, nồng độ gây hại của ve sầu nâu nhảy hại lúa (*Nilaparvata lugens*) là cao, tức là lớn hơn nồng độ được coi là có ý nghĩa kinh tế.

Hiệu suất thu hoạch cây trồng đã được xử lý bằng 12,5, 25 và 50g a.i./ha hợp chất 3 lần lượt bằng 2470, 3430, 3470 và 4600kg/ha, khi so sánh với 1370kg/ha mẫu đối chứng không được xử lý.

Thử nghiệm P

Trong thử nghiệm này, mức độ ảnh hưởng của hợp chất theo sáng chế về sức sống của cây ngô được sinh trưởng trong nhà kính khi không có mặt của loài gây hại được xác định.

Các giống ngô đơn lẻ (cánh đồng ngô hữu cơ Prairie Hybrid 2431) được trồng ở độ sâu nằm trong khoảng từ 2,0 đến 2,5cm trong chậu làm bằng chất dẻo 10cm × 10cm × 8cm chứa môi trường trong chậu bùn chứa rêu nước Redi-Earth (Sun Gro Horticulture Canada Ltd., Vancouver, British Columbia) hoặc 50/50 hỗn hợp chứa đất Matapeake và cát. Các chậu đã gieo giống được tưới nước vào lúc đầu tới độ sâu 5cm và được đặt trong

buồng sinh trưởng được duy trì ở 25°C với chu kỳ sáng 16 giờ sáng/8 giờ tối. Các chậu được tưới nước ngay khi mặt đất bị khô.

Sau 8 ngày bắt đầu từ lúc tưới nước, các cây trong chậu được xử lý bằng cách đưa một lượng bề mặt 40mL chứa hỗn hợp xử lý nước chứa 0,2 hoặc 2,5mg hợp chất 3. Đối với các chậu trồng cây đối chứng không được xử lý, 40mL nước máy được dùng tương tự. Các mẫu xử lý và mẫu đối chứng không được xử lý được tiến hành lặp lại 10 lần.

Sau đó, các cây được xử lý và không được xử lý được sắp xếp theo thiết kế khối hoàn toàn ngẫu nhiên trong nhà kính được duy trì ở 25,6—27,8°C vào ban ngày và 23,0—25,0°C vào ban đêm. Việc chiếu sáng bổ sung được bổ sung khi cường độ ánh sáng bên ngoài thấp hơn 200 w m^{-2} trong 16 giờ sinh trưởng, ngoại trừ việc không có bước chiếu sáng bổ sung được tiến hành khi năng lượng ánh sáng bên ngoài được tích lũy lớn hơn 5000 w h m^{-2} trong suốt quá trình sinh trưởng. Mái che nhà kính được đóng lại khi cường độ ánh sáng bên ngoài lớn hơn 600 watts m^{-2} trong thời gian hơn 20 phút.

Không có sự thay đổi về độ ẩm tương đối. Việc tưới bằng nước máy được tiến hành hai lần hàng ngày để duy trì độ ẩm của cát. Cứ hai hoặc ba ngày, các cây được làm màu mỡ bằng nước tưới chứa 100ppm N-P-K do Peters[®] cung cấp chứa phân bón thông thường hòa tan 20-20-20 (The Scotts Company, Marysville, Ohio, U.S.A.). Nồng độ dinh dưỡng được dùng được coi là không lý tưởng đối với quá trình sinh trưởng tối ưu của cây ngô.

Chiều cao của cây được xác định ở 0, 7, 14, 21 và 28 ngày sau khi xử lý bằng cách đo chiều cao từ đỉnh lá dài nhất theo trục thẳng đứng tới mặt đất. Chiều cao được lấy trung bình trong 10 lần thực hiện như được nêu trong các bảng thử nghiệm 1 và 2 lần lượt đối với các cây được sinh trưởng trong đất Redi-Earth và đất/cát Matapeake.

Bảng thử nghiệm 1

Ảnh hưởng của việc xử lý bằng hợp chất 3 về chiều cao của cây ngô được sinh trưởng trên đất Redi-Earth

Tỷ lệ dùng (mg a.i./chậu)	Chiều cao (cm) ở các ngày sau khi xử lý				
	0 ngày	7 ngày	14 ngày	21 ngày	28 ngày
0	21	52	84	109	133
0,2	22	53	85	111	131
2,5	21	53	85	111	137

Bảng thử nghiệm 2

Ảnh hưởng của việc xử lý bằng hợp chất 3 về chiều cao của cây ngô

được sinh trồng trên đất/cát Matapeake

Tỷ lệ dùng (mg a.i./chậu)	Chiều cao (cm) ở các ngày sau khi xử lý				
	0 ngày	7 ngày	14 ngày	21 ngày	28 ngày
0	22	49	66	78	89
0,2	22	49	66	76	87
2,5	22	46	65	78	88

Các kết quả trong các bảng thử nghiệm 1 và 2 chứng tỏ rằng hiệu quả sinh trưởng tăng không đáng kể khi dùng hợp chất 3 cho cây ngô được sinh trưởng trong môi trường không có loài gây hại trong các điều kiện sinh trưởng gần với điều kiện lý tưởng ngoại trừ điều kiện sinh trưởng cưỡng bức.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất *N*-[(5-pyrimidinyl)metyl]-2-pyridinamin.
2. Hợp chất *N*-[(5-pyrimidinyl)metylen]-2-pyridinamin.