



- (12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11) CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ
(51)⁷ C07D 215/227; A01P 13/02; C07D 401/04; A01N 43/42; A01P 15/00 (13) B

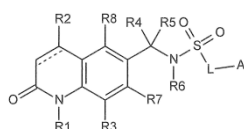


1-0029647

- (21) 1-2017-02946 (22) 05/02/2016
(86) PCT/EP2016/052492 05/02/2016 (87) WO 2016/128317 18/08/2016
(30) 1502067.0 09/02/2015 GB; 1509129.1 28/05/2015 GB
(45) 25/10/2021 403 (43) 25/12/2017 357A
(73) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland
(72) LACHIA, Mathilde Denise (FR); LOISELEUR, Olivier (FR); WENDEBORN,
Sebastian Volker (DE); JUNG, Pierre Joseph Marcel (FR); SABBADIN, Davide
(IT); BECK, Andreas (CH).
(74) Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)

(54) HỢP CHẤT 2-OXO-3,4-ĐIHYDROQUINOLIN DÙNG LÀM CHẤT ĐIỀU HÒA
SINH TRƯỞNG THỰC VẬT VÀ PHƯƠNG PHÁP ĐIỀU HOÀ HOẶC CẢI
THIỆN SỰ SINH TRƯỞNG CỦA THỰC VẬT

(57)



(I)

Sáng chế đề cập đến dẫn xuất sulfonamit có công thức (I), các quy trình và hợp chất trung gian để điều chế chúng, hợp phần chất điều hòa sinh trưởng thực vật có chứa chúng và phương pháp sử dụng chúng để kiểm soát sự sinh trưởng của cây trồng, cải thiện độ dung chịu của thực vật đối với căng thẳng phi sinh học (bao gồm căng thẳng môi trường và căng thẳng hóa học), ức chế sự nảy mầm của hạt và/hoặc bảo vệ thực vật chống lại các tác động gây độc thực vật của hóa chất. Ngoài ra, sáng chế đề xuất phương pháp điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của thực vật.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến dẫn xuất sulfonamid mới, các quy trình và hợp chất trung gian để điều chế chúng, hợp phần chất điều hòa sinh trưởng thực vật có chứa chúng và phương pháp sử dụng chúng để kiểm soát sự sinh trưởng của cây trồng, cải thiện độ dung chịu của cây đối với căng thẳng phi sinh học (bao gồm căng thẳng môi trường và căng thẳng hóa học), ức chế sự nảy mầm của hạt và/hoặc bảo vệ cây trồng chống lại các tác động gây độc thực vật của hóa chất.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Axit abscisic (ABA) là hormon thực vật đóng vai trò chính trong sự sinh trưởng, phát triển và đáp ứng của cây trồng đối với căng thẳng phi sinh học. ABA gây ra nhiều đáp ứng tế bào bằng cách liên kết với họ thụ thể hòa tan được gọi là protein PYR/PYL, chứa túi liên kết phối tử đối với ABA và các chất chủ vận khác. Việc dùng trực tiếp ABA cho cây trồng đã cho thấy là cải thiện hiệu quả sử dụng nước của chúng. Tuy nhiên, việc điều chế ABA rất khó khăn và tốn kém và bản thân nó không ổn định đối với các điều kiện môi trường và do đó không thích hợp để ứng dụng trong nông nghiệp trên quy mô lớn. Do đó, mong muốn tìm kiếm các chất chủ vận ABA có thể hữu dụng để cải thiện độ dung chịu của cây trồng đối với căng thẳng môi trường chẳng hạn như hạn hán, ức chế sự nảy mầm của hạt, điều hòa sự sinh trưởng của cây trồng và cải thiện năng suất cây trồng.

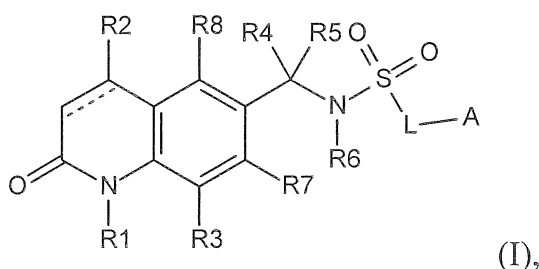
Công bố đơn sáng chế quốc tế số WO2013/148339 đã báo cáo chất chủ vận ABA mới, quinabactin, liên kết với protein thụ thể PYR/PYL và gây ra đáp ứng axit abscisic *in vivo*. Đã thấy rằng quinabactin gây ra sự đóng khí khổng, ngăn chặn sự mất nước và tăng cường khả năng dung chịu hạn hán.

Cần xác định chất chủ vận được cải tiến của axit abscisic để cải thiện sự sinh trưởng và phát triển của cây trồng, và độ dung chịu của cây trồng đối với các căng thẳng môi trường. Sáng chế đề cập đến chất tương tự quinabactin mới có các tính chất

được cải thiện. Lợi ích của hợp chất theo sáng chế bao gồm tăng cường độ dung chịu đối với căng thẳng phi sinh học, cải thiện sự ức chế nảy mầm của hạt, điều hòa tốt hơn sự phát triển của cây trồng, cải thiện sản lượng cây trồng, và/hoặc cải thiện các tính chất vật lý dẫn đến sự hấp thụ của cây, độ hòa tan trong nước, độ ổn định hóa học hoặc độ ổn định vật lý tốt hơn.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Theo sáng chế, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I):



trong đó:

R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₇ alkyl, C₁-C₇ haloalkyl, C₃-C₅ xycloalkyl-C₁-C₇ alkyl, C₃-C₇ alkenyl, C₃-C₇ alkynyl, aryl-C₁-C₇ alkyl, (heteroxyclyl có 3-6 cạnh)-C₁-C₇ alkyl, phenyl, C₃-C₅ xycloalkyl và heteroxyclyl có 4-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Rx;

R2 được chọn từ nhóm gồm có hydro, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R3, R7 và R8 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R4 và R5 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

hoặc R4 và R5, cùng với nguyên tử hoặc các nguyên tử mà chúng được gắn trực tiếp với, có thể tạo thành C₃-C₄ xycloalkyl hoặc C₄ heteroxyclyl;

R6 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₄ alkenyl, C₃-C₄ alkynyl, và C₁-C₃ alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

L được chọn từ nhóm gồm có liên kết, mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkenyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkynyl thẳng, mạch -C₁-C₄- alkoxy thẳng qua đó nguyên tử oxy được gắn với A, mạch -amino-C₁-C₄-alkyl- thẳng qua đó nguyên tử nitơ được gắn với

A, và mạch C₁-C₂alkyl-oxy-C₁-C₂alkyl thẳng, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl hoặc C₁-C₄ alkoxy;

A là hydro, C₁-C₇ alkyl, C₃-C₅ xycloalkyl, heteroxycyl hoặc aryl có 3-10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba R_y;

R_x, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylcacbonyl, C₁-C₄ alkoxycacbonyl, axit cacboxylic, aminocacbonyl, C₁-C₄ aminocacbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

R_y, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkyloxy, C₁-C₄ alkylsulfanyl, C₁-C₄ haloalkylsulfanyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylcacbonyl, C₁-C₄ alkoxycacbonyl, axit cacboxylic, aminocacbonyl, C₁-C₄ aminocacbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl, xycloalkyl này không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R_z; và

R_z độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄-alkyl và C₁-C₄-haloalkyl;

trong đó A không phải là butyl khi R₄ hoặc R₅ là metyl;

và trong đó R₁ không phải là metyl khi mỗi R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ và R₈ là hydro;

hoặc muối hoặc N-oxit của nó.

Mô tả chi tiết sáng chế

Hợp chất theo sáng chế có thể tồn tại ở các dạng đồng phân hình học hoặc đồng phân quang học khác nhau (chất đồng phân không đối quang và chất đồng phân đối ảnh) hoặc các dạng hỗn biến. Sáng chế bao gồm tất cả các chất đồng phân và chất hỗn biến này và hỗn hợp của chúng ở tất cả các tỷ lệ cũng như các dạng đồng vị như các hợp chất đơ-te-ri hóa. Sáng chế cũng bao gồm tất cả các muối, N-oxit, và phức hợp á kim của hợp chất theo sáng chế.

Mỗi gốc alkyl một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn (như alkoxy, alkoxycacbonyl, alkylcacbonyl, alkylaminocacbonyl, đialkylaminocacbonyl) là mạch thẳng hoặc mạch nhánh và là, ví dụ, metyl, etyl, *n*-propyl, *n*-butyl, *n*-pentyl, *n*-hexyl, *iso*-propyl, *n*-butyl, *sec*-butyl, *iso*-butyl, *tert*-butyl hoặc *neo*-pentyl. Các nhóm alkyl bao gồm C₁ - C₆ alkyl, C₁-C₄ alkyl, và C₁-C₃ alkyl.

Thuật ngữ "alkenyl", như được sử dụng ở đây, là gốc alkyl có ít nhất một liên kết đôi cacbon-cacbon, ví dụ $C_2 - C_6$ alkenyl. Các ví dụ cụ thể bao gồm vinyl và allyl. Gốc alkenyl có thể là một phần của nhóm lớn hơn (như alkenoxy, alkenoxycarbonyl, alkenylcarbonyl, alkenylaminocarbonyl, dialkenylaminocarbonyl).

Thuật ngữ "acetoxyl" dùng để chỉ $-OC(=O)CH_3$.

Thuật ngữ "alkynyl", như được sử dụng ở đây, là gốc alkyl có ít nhất một liên kết ba cacbon-cacbon, ví dụ $C_2 - C_6$ alkynyl. Các ví dụ cụ thể bao gồm etynyl và propargyl. Gốc alkynyl có thể là một phần của nhóm lớn hơn (như alkynoxy, alkynoxycarbonyl, alkynylcarbonyl, alkynylaminocarbonyl, dialkynylaminocarbonyl).

Halogen là flo (F), clo (Cl), brom (Br) hoặc iot (I).

Các nhóm haloalkyl (một mình hoặc là một phần của nhóm lớn hơn, như haloalkoxy hoặc haloalkylthio) là các nhóm alkyl được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và là, ví dụ, $-CF_3$, $-CF_2Cl$, $-CH_2CF_3$ hoặc $-CH_2CHF_2$.

Các nhóm hydroxyalkyl là các nhóm alkyl được thế bằng một hoặc nhiều nhóm hydroxyl và là, ví dụ, $-CH_2OH$, $-CH_2CH_2OH$ hoặc $-CH(OH)CH_3$.

Các nhóm alkoxyalkyl là nhóm alkoxy được liên kết với alkyl ($R-O-R'$), ví dụ $-(CH_2)_rO(CH_2)_sCH_3$, trong đó r nằm trong khoảng từ 1 đến 6 và s nằm trong khoảng từ 1 đến 5.

Trong bản mô tả này, thuật ngữ "aryl" dùng để chỉ hệ vòng có thể là vòng đơn, vòng đôi hoặc ba vòng. Ví dụ về các vòng này bao gồm phenyl, naphthalenyl, anthracenyl, indenyl hoặc phenantrenyl.

Trừ khi được nêu khác đi, alkenyl và alkynyl, một mình hoặc là một phần của phân tử thế khác, có thể là mạch thẳng hoặc mạch nhánh và có thể chứa từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon, và khi thích hợp, có thể có cấu hình (*E*)- hoặc (*Z*). Các ví dụ bao gồm vinyl, allyl, etynyl và propargyl.

Trừ khi được nêu khác đi, cycloalkyl có thể là vòng đơn hoặc vòng đôi, có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm C_1-C_6 alkyl, và chứa từ 3 đến 7 nguyên tử

cacbon. Các ví dụ về xycloalkyl bao gồm xyclopropyl, 1-metylxcyclopropyl, 2-metylxcyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl.

Thuật ngữ "heteroxyclyl" chỉ hệ vòng chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S, trong đó các nguyên tử nitơ và lưu huỳnh tùy ý được oxy hóa, và (các) nguyên tử nitơ tùy ý được thế bậc bốn. Heteroxyclyl bao gồm heteroaryl, chất tương tự no, và ngoài ra, chất tương tự không no hoặc không no một phần của chúng như 4,5,6,7-tetrahydro-benzothiophenyl, 9H-florenyl, 3,4-đihydro-2H-benzo-1,4-dioxepinyl, 2,3-đihydro-benzofuranyl, piperidinyl, 1,3-dioxolanyl, 1,3-dioxanyl, 4,5-đihydro-isoxazolyl, tetrahydrofuranlyl và morpholinyl. Ngoài ra, thuật ngữ "heteroxyclyl" bao gồm heteroxycloalkyl, vòng đơn vòng hoặc đa vòng không thơm có chứa nguyên tử cacbon và hydro và ít nhất một nguyên tử khác loại được chọn từ nitơ, oxy, và lưu huỳnh như oxetanyl hoặc thietanyl.

Thuật ngữ "heteroaryl" dùng để chỉ hệ vòng thơm chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại được chọn từ N, O, và S, trong đó nguyên tử nitơ và lưu huỳnh tùy ý được oxy hóa, và gồm vòng đơn hoặc hai hoặc nhiều vòng ngưng tụ. Vòng đơn có thể chứa lên đến ba nguyên tử khác loại, và hệ hai vòng có thể chứa lên đến bốn nguyên tử khác loại, các nguyên tử khác loại này sẽ tốt hơn là được chọn từ nitơ, oxy và lưu huỳnh. Ví dụ về các nhóm này bao gồm pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, furanyl, thienyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, thiadiazolyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl và tetrazolyl.

Các giá trị được ưu tiên của R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, L, A, Rx, Ry và Rz, ở dạng kết hợp bất kỳ, là như nêu dưới đây.

Tốt hơn là, R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₅ xycloalkyl-C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ alkenyl, C₃-C₆ alkynyl, phenyl và heteroxyclyl có 4-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Rx.

Tốt hơn là, R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₆ alkenyl và C₃-C₅-xycloalkyl-C₁-C₆ alkyl. Tốt hơn là, R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₃-C₅ alkenyl, C₃-C₅-xycloalkyl-C₁-C₂ alkyl và C₂-C₄ haloalkyl. Tốt hơn là, R1 là etyl, isopropyl, *n*-propyl, alyl, xyclopropyl-metyl hoặc 2,2,2-triflo-etyl. Mạch alkyl có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng. Theo một phương án, R1 là metyl. Theo một phương án, R1 là etyl. Theo một phương án, R1 là *n*-propyl hoặc iso-propyl. Theo

một phương án, R1 là n-butyl, iso-butyl, sec-butyl hoặc tert-butyl. Theo một phương án, R1 là alyl, cyclopropyl-metyl hoặc 2,2,2-trifluoro-ethyl.

Tốt hơn là, R2 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ alkoxy. Tốt hơn là, R2 được chọn từ nhóm gồm có hydro và C₁-C₄ alkyl.

Tốt hơn là, R3 được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, cyano, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ alkoxy. Tốt hơn là, R3 được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen và C₁-C₄ alkyl.

Tốt hơn là, mỗi trong số R4 và R5 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro và C₁-C₄ alkyl. Tốt hơn là, mỗi trong số R4 và R5 độc lập là hydro hoặc metyl.

Tốt hơn là, R6 là hydro.

Tốt hơn là, mỗi trong số R7 và R8 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, cyano, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ alkoxy.

Tốt hơn là, L được chọn từ nhóm gồm có liên kết, mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkenyl thẳng, và mạch -C₂-C₄- alkynyl thẳng. Theo một phương án, L là liên kết. Theo một phương án, L là mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng. Theo một phương án, L là mạch -C₂-C₄- alkenyl.

Tốt hơn là, A được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₇ alkyl, phenyl và heteroaryl có 3-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba R_y. Tốt hơn là, A là heteroaryl hoặc phenyl có 5-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba R_y. Tốt hơn là, A là phenyl tùy ý được thế bằng từ một đến ba phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, cyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ haloalkylsulfanyl và C₃-C₄ cycloalkyl. Theo một phương án, A là phenyl tùy ý được thế bằng từ một đến ba phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₁-C₄ haloalkoxy. Theo một phương án, A là phenyl. Theo một phương án, A là heteroaryl có 5-6 cạnh được chọn từ nhóm gồm có pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, furanyl, thienyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, thiadiazolyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl và tetrazolyl. Theo một phương án, A là thienyl tùy ý được thế bằng từ một đến ba phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₁-C₄ haloalkoxy.

Tốt hơn là, Rx được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₁-C₄ alkoxy. Tốt hơn là, Rx được chọn từ nhóm gồm có halogen và C₁-C₄ alkyl. Theo một phương án, Rx là halogen. Theo phương án khác, Rx là metyl. Theo phương án khác, Rx là etyl.

Tốt hơn là, Ry được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ haloalkylsulfanyl và C₃-C₄ xycloalkyl. Tốt hơn là, Ry được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl và C₁-C₄ alkyl. Theo một phương án, Ry được chọn từ nhóm gồm có xyano, metyl, etyl, xyclopropyl, triflometyl, điflometyl, triflometyloxy, điflometyloxy và triflometylsulfanyl. Theo một phương án, mỗi Ry được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, metyl, etyl, propyl, xyclopropyl và butyl. Theo phương án khác, mỗi Ry được chọn từ nhóm gồm có F, Cl, và Br. Theo một phương án, Ry là flo. Theo phương án khác, Ry là điflometyl. Theo phương án khác, Ry là triflometyl. Theo phương án khác, Ry là C₁-C₄ haloalkylsulfanyl.

Tốt hơn là, Rz được chọn từ nhóm gồm có halogen và C₁-C₄-alkyl. Theo một phương án, Rz là halogen.

Theo một phương án của công thức (I):

R₁ được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₃-C₅-xycloalkyl-C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ alkenyl và C₁-C₆ haloalkyl;

R₂ được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ alkoxy;

Mỗi R₃, R₇ và R₈ độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, và C₁-C₄ alkoxy;

Mỗi R₄ và R₅ độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro và C₁-C₄ alkyl;

R₆ là hydro;

L được chọn từ nhóm gồm có liên kết, mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkenyl thẳng, và mạch -C₂-C₄- alkynyl thẳng;

A là heteroxyclyl hoặc aryl có 3-10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Ry; và

Ry được chọn từ nhóm gồm có xyano, halogen, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ haloalkyl.

Theo phương án khác của công thức (I):

R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₃-C₅-xycloalkyl-C₁-C₆ alkyl và C₁-C₆ haloalkyl;

R2, R3, R6, R7 và R8 là hydro;

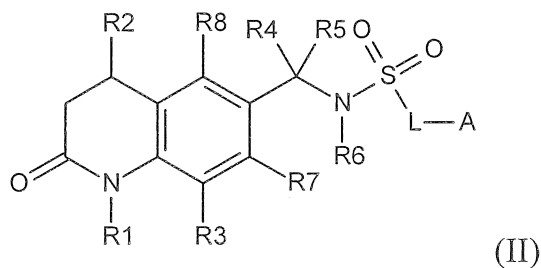
Mỗi R4 và R5 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro và C₁-C₄ alkyl;

L được chọn từ nhóm gồm có liên kết, mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkenyl thẳng, và mạch -C₂-C₄- alkynyl thẳng;

A là heterocyclyl hoặc aryl có 3-10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Ry; và

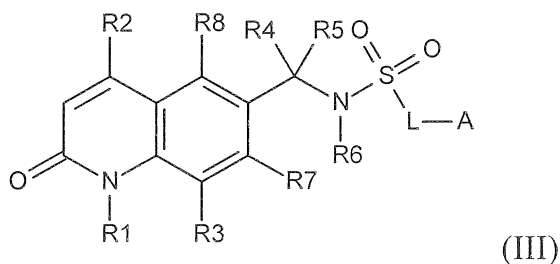
Ry được chọn từ nhóm gồm có xyano, halogen, C₁-C₄ alkyl, và C₁-C₄ haloalkyl.

Theo một phương án của sáng chế, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (II):



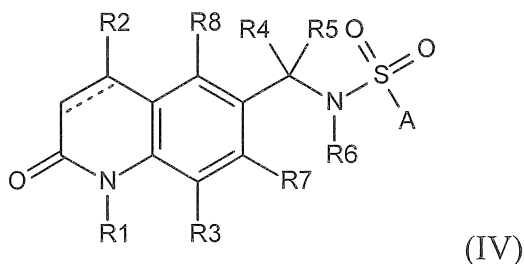
trong đó các phần tử thế là như được xác định trên đây; hoặc muối hoặc N-oxit của nó. Các giá trị được ưu tiên của R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, L, A, Rx, Ry và Rz đối với hợp chất có công thức (II), ở dạng kết hợp bất kỳ, là như được nêu trên đây.

Theo phương án khác của sáng chế, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (III):



trong đó các phần tử thế là như được xác định trên đây; hoặc muối hoặc N-oxit của nó. Các giá trị được ưu tiên của R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, L, A, Rx, Ry và Rz đối với hợp chất có công thức (III), ở dạng kết hợp bất kỳ, là như được nêu trên đây.

Theo phương án khác của sáng chế, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (IV)



trong đó:

R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₇ alkyl, C₁-C₇ haloalkyl, C₃-C₅ xycloalkyl-C₁-C₇ alkyl, C₃-C₇ alkenyl, C₃-C₇ alkynyl, aryl-C₁-C₇ alkyl, (heteroxyclyl có 3-6 cạnh)-C₁-C₇ alkyl, phenyl, C₃-C₅ xycloalkyl và heteroxyclyl có 4-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Rx;

R2 được chọn từ nhóm gồm có hydro, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R3, R7 và R8 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R4 và R5 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

hoặc R4 và R5, cùng với nguyên tử hoặc các nguyên tử mà chúng được gắn trực tiếp với, có thể tạo thành C₃-C₄ xycloalkyl hoặc C₃-C₄ heteroxyclyl;

R6 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₄ alkenyl, C₃-C₄ alkynyl, và C₁-C₃ alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

A là hydro, C₁-C₇ alkyl, C₃-C₅ xycloalkyl, heteroxyclyl hoặc aryl có 3-10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Ry;

Rx, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylcarbonyl, C₁-C₄ alkoxy carbonyl, axit cacboxylic, aminocarbonyl, C₁-C₄ aminocarbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

Ry, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylsulfanyl, C₁-C₄

haloalkylsulfanyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylcarbonyl, C₁-C₄ alkoxy carbonyl, axit cacboxylic, aminocarbonyl, C₁-C₄ aminocarbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl, xycloalkyl này không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều Rz; và

Rz độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄-alkyl và C₁-C₄-haloalkyl;

trong đó A không phải là butyl khi R₄ hoặc R₅ là metyl;

và trong đó R₁ không phải là metyl khi mỗi R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ và R₈ là hydro;

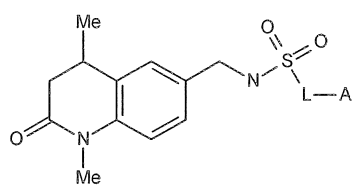
hoặc muối hoặc N-oxit của nó.

Các giá trị được ưu tiên của R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, A, R_x, R_y và R_z đối với hợp chất có công thức (IV), ở dạng kết hợp bất kỳ, là như được nêu trên đây.

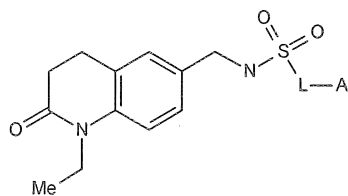
Bảng 1 dưới đây bao gồm các ví dụ về hợp chất theo sáng chế.

Bảng 1

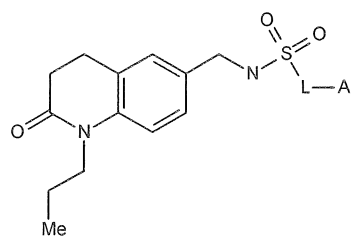
Mỗi cấu trúc sau đây có thể được kết hợp với các tổ hợp phần tử thế được liệt kê trong bảng dưới đây, sao cho hợp chất cụ thể 1.001 là cấu trúc 1.xxx được kết hợp với hợp chất x.001, hợp chất cụ thể 5.123 là cấu trúc 5.xxx được kết hợp với hợp chất x.123 trong bảng, và v.v..



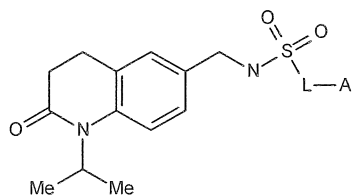
1.xxx



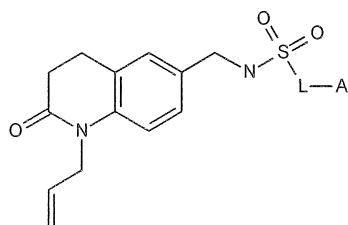
2.xxx



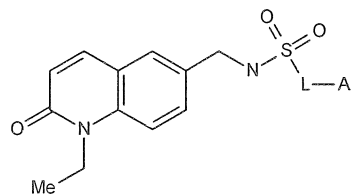
3.xxx



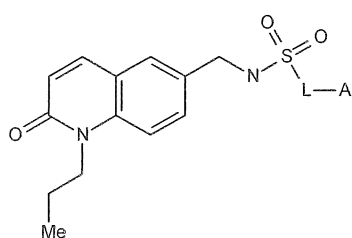
4.xxx



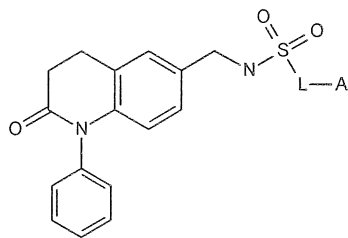
5.xxx



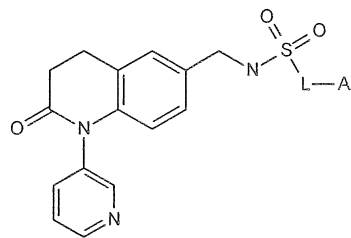
6.xxx



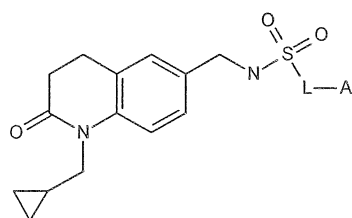
7.xxx



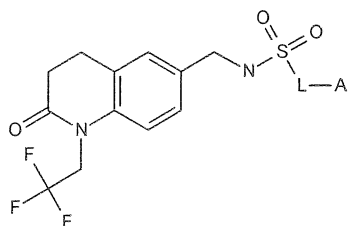
8.xxx



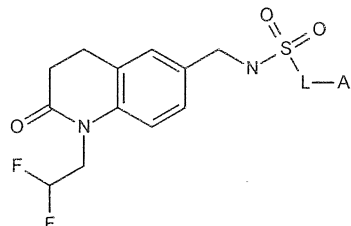
9.xxx



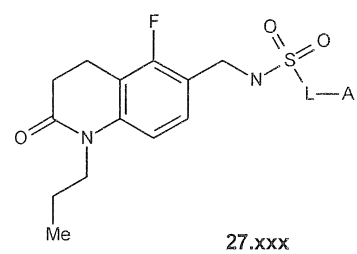
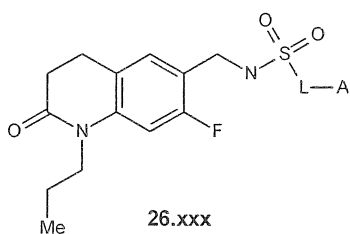
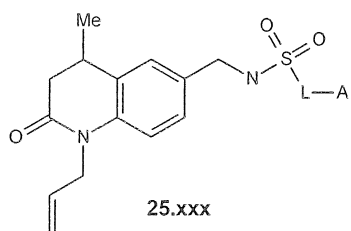
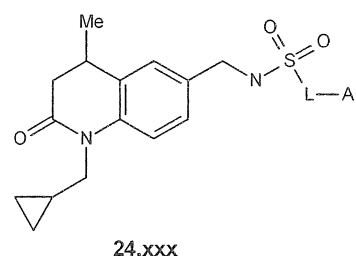
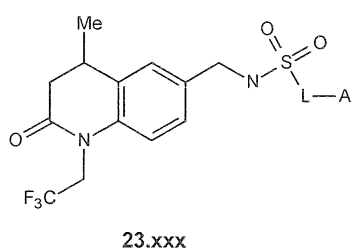
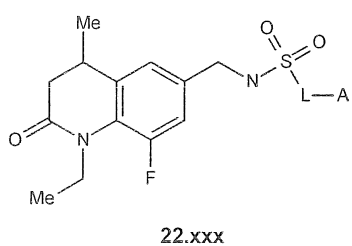
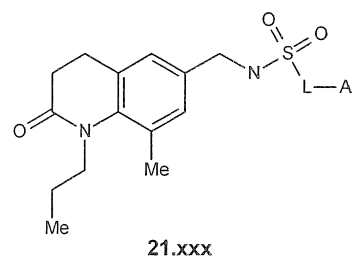
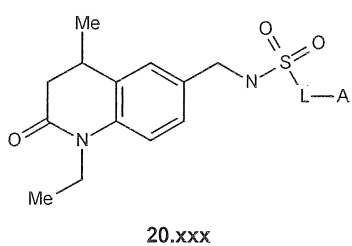
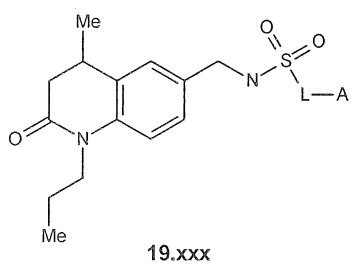
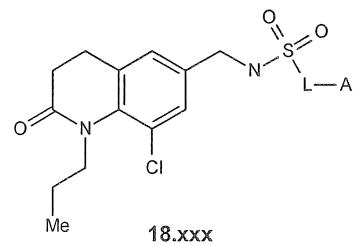
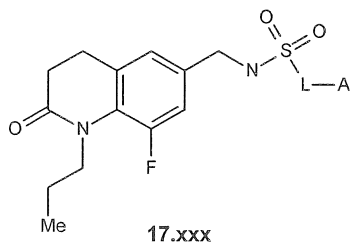
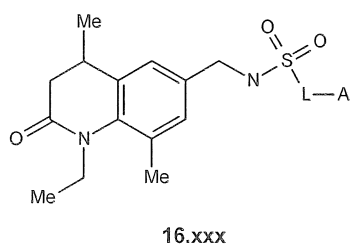
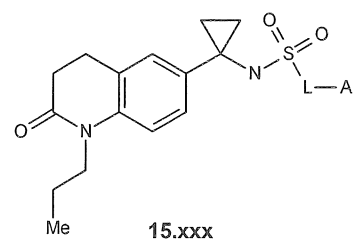
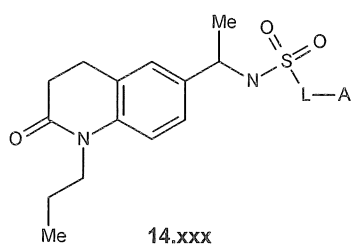
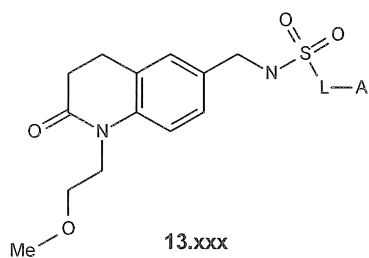
10.xxx



11.xxx



12.xxx



Hợp chất	L	A
x.001	liên kết	phenyl
x.002	liên kết	4-bromophenyl
x.003	liên kết	3-clophenyl

x.004	liên kết	4-clophenyl
x.005	liên kết	2,6-điflophenyl
x.006	liên kết	2,4-điflophenyl
x.007	liên kết	2-flophenyl
x.008	liên kết	3-flophenyl
x.009	liên kết	4-flophenyl
x.010	liên kết	4-metoxypheyl
x.011	liên kết	o-tolyl
x.012	liên kết	p-tolyl
x.013	liên kết	p-tolylmetyl
x.014	liên kết	2,4-đimetylphenyl
x.015	liên kết	4-(triflometyl)phenyl
x.016	liên kết	4-isopropoxyphenyl
x.017	liên kết	2-bromophenyl
x.018	liên kết	xyclopropyl
x.019	liên kết	butyl
x.020	liên kết	4,4,4-triflobutyl
x.021	-CH ₂ -	phenyl
x.022	-CH ₂ -	4-bromophenyl
x.023	-CH ₂ -	2-flophenyl
x.024	-CH ₂ -	p-tolyl
x.025	-CH ₂ -	2,4-điflophenyl
x.026	-CH ₂ -	2,6-điflophenyl
x.027	-CH ₂ -	4-(xyclopropyl)phenyl
x.028	-CH ₂ -	4-nitrophenyl

x.029	-CH ₂ -	2,4-diclophenyl
x.030	-CH ₂ -	3-flophenyl
x.031	-CH ₂ -	4-clophenyl
x.032	-CH ₂ -	6-(triflometyl)-3-pyridyl
x.033	-CH ₂ -	3-(triflometyl)phenyl
x.034	-CH ₂ -	-CH ₂ -metoxycacbonyl
x.035	-CH ₂ -CH ₂ -	phenyl
x.036	-CH ₂ -	4-bromo-2-flo-phenyl
x.037	-CH ₂ -	2,5-diflophenyl
x.038	-CH ₂ -	2,3-diflophenyl
x.039	-CH ₂ -	2-bromo-4-flo-phenyl
x.040	-CH ₂ -	2-bromo-4-clo-phenyl
x.041	-CH ₂ -	2-xyanophenyl
x.042	-CH ₂ -	4-xyano-2-flo-phenyl
x.043	-CH ₂ -	2-xyanophenyl
x.044	-CH ₂ -	2-clo-4-flo-phenyl
x.045	-CH ₂ -	4-tert-butylphenyl
x.046	-CH ₂ -	4-(triflometoxy)phenyl
x.047	-CH ₂ -	4-(triflometyl)phenyl
x.048	-CH ₂ -	2-bromophenyl
x.049	-CH ₂ -	3-bromophenyl
x.050	-CH ₂ -	4-(triflometylsulfanyl)phenyl
x.051	-CH=CH-	phenyl
x.052	-CH=CH-	4-bromophenyl
x.053	-CH=CH-	4-clophenyl

x.054	-CH=CH-	5-clothiazol-2-yl
x.055	-CH=CH-	5-clo-2-thienyl
x.056	-CH=CH-	2-flophenyl
x.057	-CH=CH-	4-flophenyl
x.058	-CH=CH-	5-metyl-2-thienyl
x.059	-CH=CH-	p-tolyl
x.060	-CH=CH-	metyl
x.061	liên kết	(5-metyl-2-thienyl)
x.062	liên kết	propyl
x.063	liên kết	(1-metylimidazol-4-yl)
x.064	liên kết	(2,5-điclo-3-thienyl)
x.066	-CH ₂ - CH=CH-	metyl
x.067	liên kết	3,3,3-triflopropyl
x.068	liên kết	3-thienyl
x.069	-CH=CH-	3-clophenyl
x.070	-CH=CH-	3-bromophenyl
x.071	-CH ₂ - CH=CH-	H
x.072	liên kết	2-thienyl
x.073	liên kết	(5-clo-2-thienyl)
x.074	liên kết	1-naptyl
x.075	liên kết	2-naptyl
x.076	liên kết	4-etylphenyl
x.077	liên kết	4-propylphenyl

x.078	liên kết	4-xyclopropylphenyl
x.079	liên kết	2-flo-4-metylphenyl

Theo một phương án, hợp chất theo sáng chế được dùng kết hợp với chất hỗ trợ chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Cụ thể, sáng chế đề xuất hợp phần có chứa hợp chất theo sáng chế và chất hỗ trợ chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề cập đến hợp phần hóa nông có chứa hợp chất theo sáng chế.

Sáng chế đề xuất phương pháp cải thiện độ dung chịu của cây trồng đối với căng thẳng phi sinh học, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng hợp chất, hợp phần hoặc hỗn hợp theo sáng chế cho cây, phần cây, vật liệu nhân giống cây, hoặc vị trí sinh trưởng của cây.

Sáng chế đề xuất phương pháp điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của cây, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng hợp chất, hợp phần hoặc hỗn hợp theo sáng chế cho cây, phần cây, vật liệu nhân giống cây, hoặc vị trí sinh trưởng của cây. Theo một phương án, sự sinh trưởng của cây trồng được điều hòa hoặc cải thiện khi cây trồng chịu điều kiện căng thẳng phi sinh học.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp ức chế sự nảy mầm hạt của cây, bao gồm bước dùng hợp chất, hợp phần hoặc hỗn hợp theo sáng chế cho hạt, hoặc vị trí chứa hạt.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ cây trồng chống lại các tác động của hóa chất gây độc thực vật, bao gồm bước dùng hợp chất, hợp phần hoặc hỗn hợp theo sáng chế cho cây, phần cây, vật liệu nhân giống cây, hoặc vị trí sinh trưởng của cây.

Một cách thích hợp, hợp chất hoặc hợp phần này được dùng với lượng đủ để gây ra đáp ứng mong muốn.

Theo sáng chế, "điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của cây trồng" nghĩa là cải thiện sức sống của cây, cải thiện chất lượng của cây, cải thiện độ dung chịu đối với các yếu tố căng thẳng, và/hoặc cải thiện hiệu quả sử dụng đầu vào.

‘Cải thiện sức sống của cây’ nghĩa là một số tính trạng nhất định được cải thiện về mặt định tính hoặc định lượng so với cùng tính trạng đó ở cây đối chứng được sinh trưởng trong cùng điều kiện nhưng không áp dụng phương pháp theo sáng chế. Các tính trạng này bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, sự nảy mầm sớm và/hoặc được cải thiện, sự nảy mầm được cải thiện, khả năng sử dụng hạt ít hơn, sự sinh trưởng của rễ được cải thiện, hệ rễ được phát triển hơn, sự tạo nốt sần của rễ tăng, sự sinh trưởng của chồi tăng, sự đẻ nhánh tăng, các nhánh gốc khỏe hơn, các nhánh gốc sinh sản nhiều hơn, sự đứng vững của cây tăng hoặc được cải thiện, sự quay ngược của cây ít hơn (sự xoắn), sự tăng và/hoặc sự cải thiện chiều cao của cây, sự tăng khối lượng cây (tươi hoặc khô), các phiến lá lớn hơn, màu lá xanh hơn, hàm lượng sắc tố tăng, hoạt tính quang hợp tăng, sự ra hoa sớm hơn, các chùm dài hơn, sự chín của hạt sớm, kích thước hạt, quả hoặc vỏ giáp tăng, số vỏ giáp hoặc bông tăng, số hạt trên mỗi vỏ giáp hoặc bông tăng, khối lượng hạt tăng, sự điền đầy hạt được nâng cao, lá cơ bản chết ít hơn, sự chậm già hóa, sức sống của cây được cải thiện, mức axit amin trong các mô dự trữ tăng và/hoặc cần ít đầu vào hơn (ví dụ, cần ít phân bón, nước và/hoặc lao động hơn). Cây có sức sống cải thiện có thể tăng tính trạng bất kỳ được đề cập ở trên hoặc sự kết hợp bất kỳ của hai hoặc nhiều tính trạng được đề cập ở trên.

‘Cải thiện chất lượng của cây’ nghĩa là một số tính trạng nhất định được cải thiện về mặt định tính hoặc định lượng so với cùng tính trạng như vậy ở cây đối chứng được sinh trưởng trong cùng điều kiện nhưng không ứng dụng phương pháp theo sáng chế. Các tính trạng này bao gồm, nhưng không giới hạn ở, cải thiện hình dạng bên ngoài của cây, giảm etylen (sản xuất giảm và/hoặc ức chế nhận), cải thiện chất lượng của nguyên liệu thu hoạch được, ví dụ hạt, trái cây, lá, rau (chất lượng được cải thiện như vậy có thể biểu lộ dưới dạng cải thiện hình dạng bên ngoài của vật liệu thu hoạch được), cải thiện hàm lượng hydrat cacbon (ví dụ tăng lượng đường và/hoặc tinh bột, cải thiện tỷ lệ axit đường, giảm đường khử, tăng tốc độ phát triển của đường), cải thiện hàm lượng protein, cải thiện hàm lượng và thành phần dầu, cải thiện giá trị dinh dưỡng, giảm các hợp chất kháng dinh dưỡng, cải thiện tính chất về khả năng nhận cảm (ví dụ cải thiện vị) và/hoặc cải thiện lợi ích sức khỏe của người tiêu dùng (ví dụ tăng mức vitamin và chất chống oxy hóa), cải thiện các đặc điểm sau thu hoạch (ví dụ tăng cường thời hạn sử dụng và/hoặc độ ổn định bảo quản, khả năng xử lý dễ dàng hơn, chiết hợp chất dễ dàng hơn), phát triển cây trồng đồng nhất hơn (ví dụ đồng bộ hóa sự

nảy mầm, sự ra hoa và/hoặc sự ra quả của cây), và/hoặc cải thiện chất lượng hạt (ví dụ để sử dụng trong các mùa sau). Cây có chất lượng cải thiện có thể tăng tính trạng bất kỳ được đề cập ở trên hoặc sự kết hợp bất kỳ của hai hoặc nhiều tính trạng được đề cập ở trên.

‘Cải thiện độ dung chịu đối với các yếu tố căng thẳng’ nghĩa là một số tính trạng nhất định được cải thiện về mặt định tính hoặc định lượng so với cùng tính trạng như vậy ở cây đối chứng được sinh trưởng trong cùng điều kiện không ứng dụng phương pháp theo sáng chế. Các tính trạng này bao gồm bao gồm, nhưng không giới hạn ở, tăng độ dung chịu và/hoặc độ kháng đối với các yếu tố căng thẳng sinh học và/hoặc không sinh, và cụ thể các yếu tố căng thẳng phi sinh học mà gây ra các điều kiện sinh trưởng dưới tối ưu như hạn hán (ví dụ căng thẳng bất kỳ dẫn đến thiếu hàm lượng nước ở cây, thiếu khả năng hấp thụ nước hoặc giảm sự cung cấp nước cho cây), sự tiếp xúc với lạnh, sự tiếp xúc với nhiệt, căng thẳng thẩm thấu, căng thẳng UV, úng lụt, độ mặn tăng (ví dụ trong đất), sự tiếp xúc với khoáng chất tăng, sự tiếp xúc với ozon, sự tiếp xúc với ánh sáng cao và/hoặc sự có sẵn hạn chế của các chất dinh dưỡng (ví dụ chất dinh dưỡng nitơ và/hoặc phospho). Cây có độ dung chịu đối với các yếu tố căng thẳng được cải thiện có thể tăng một tính trạng bất kỳ trong số các tính trạng nêu trên hoặc sự kết hợp bất kỳ của hai hoặc nhiều tính trạng nêu trên. Trong trường hợp căng thẳng hạn hán và chất dinh dưỡng, độ dung chịu được cải thiện này có thể là do, ví dụ, sự hấp thu, sử dụng hoặc sự giữ lại nước và các chất dinh dưỡng một cách có hiệu quả hơn. Cụ thể, hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế là hữu dụng để cải thiện độ dung chịu đối với căng thẳng hạn hán.

‘Cải thiện hiệu quả sử dụng đầu vào’ nghĩa là cây trồng có khả năng sinh trưởng một cách hiệu quả hơn bằng cách sử dụng mức đầu vào đã cho so với sự sinh trưởng của cây đối chứng được sinh trưởng trong cùng điều kiện nhưng không ứng dụng phương pháp theo sáng chế. Cụ thể là, đầu vào bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, phân bón (như nitơ, phospho, kali, các vi chất dinh dưỡng), ánh sáng và nước. Cây có hiệu quả sử dụng đầu vào cải thiện có thể có sử dụng một trong số các đầu vào bất kỳ được đề cập ở trên hoặc sự kết hợp bất kỳ của hai hoặc nhiều đầu vào được đề cập ở trên.

Các tác dụng điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của cây trồng bao gồm giảm chiều cao cây, hoặc giảm sự đẻ nhánh, mà là các đặc điểm có lợi ở cây trồng hoặc điều kiện mà mong muốn có ít sinh khối hơn và ít đẻ nhánh hơn.

Bất kỳ hoặc tất cả các khía cạnh cải thiện cây trồng nêu trên có thể dẫn đến cải thiện sản lượng bằng cách cải thiện, ví dụ, sinh lý học của cây, sự sinh trưởng và phát triển của cây và/hoặc cấu trúc cây. Theo sáng chế, 'sản lượng' bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, (i) tăng sản xuất sinh khối, sản lượng hạt, hàm lượng tinh bột, hàm lượng dầu và/hoặc hàm lượng protein, mà có thể tạo ra từ (a) sự tăng lượng được sản xuất bởi chính cây trồng hoặc (b) cải thiện khả năng thu hoạch vật liệu của cây, (ii) cải thiện thành phần của vật liệu thu hoạch được (ví dụ cải thiện tỷ lệ axit đường, cải thiện thành phần dầu, tăng giá trị dinh dưỡng, giảm các hợp chất kháng dinh dưỡng, tăng các lợi ích sức khỏe của người tiêu dùng) và/hoặc (iii) tăng/tạo điều kiện thuận lợi cho khả năng thu hoạch cây trồng, cải thiện khả năng xử lý của cây trồng và/hoặc độ ổn định bảo quản/thời hạn sử dụng tốt hơn. Sản lượng của cây nông nghiệp tăng nghĩa là, khi có thể thực hiện được phép đo định lượng, sản lượng sản phẩm của cây tương ứng tăng thêm một lượng có thể đo được so với sản lượng của sản phẩm tương tự của cây được sản xuất trong cùng một điều kiện, nhưng không ứng dụng sáng chế này. Theo sáng chế, tốt hơn là sản lượng tăng thêm ít nhất 0,5%, được ưu tiên hơn là ít nhất 1%, được ưu tiên hơn nữa là ít nhất 2%, thậm chí được ưu tiên hơn nữa là ít nhất 4%, tốt hơn là 5% hoặc thậm chí nhiều hơn.

Bất kỳ hoặc tất cả các khía cạnh nâng cao sản lượng cây trồng nêu trên có thể dẫn đến sự sử dụng đất được cải thiện, nghĩa là, đất trước đây không sử dụng được hoặc dưới tối ưu cho trồng trọt có thể trở nên sử dụng được. Ví dụ, các cây thể hiện khả năng sống sót tăng trong điều kiện hạn hán, có thể có khả năng được trồng trọt ở các vùng có lượng mưa dưới tối ưu, ví dụ, có lẽ ở ven sa mạc hoặc thậm chí chính sa mạc.

Theo một khía cạnh của sáng chế, các khía cạnh nâng cao sản lượng cây trồng được tạo khi gần như không có căng thẳng từ các vật gây hại và/hoặc bệnh dịch và/hoặc căng thẳng phi sinh học. Theo khía cạnh khác của sáng chế, các sự cải thiện sức sống của cây, độ dung chịu căng thẳng, chất lượng và/hoặc sản lượng được tạo khi gần như không có căng thẳng từ các vật gây hại và/hoặc bệnh dịch. Ví dụ, các loài gây hại và/hoặc bệnh dịch có thể được kiểm soát bằng cách xử lý bằng thuốc diệt loài gây

hại được dùng trước, hoặc cùng thời điểm với, phương pháp theo sáng chế. Theo một khía cạnh khác nữa của sáng chế, cải thiện sức sống của cây, độ dung chịu căng thẳng, chất lượng và/hoặc sản lượng được tạo ra khi không có căng thẳng từ các loài gây hại và/hoặc bệnh dịch. Theo một phương án khác, cải thiện sức sống của cây, chất lượng và/hoặc sản lượng được tạo ra khi không có, hoặc gần như không có, căng thẳng phi sinh học.

Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng một mình, nhưng nhìn chung thường được tạo hợp phần thành hợp phần sử dụng chất bổ trợ tạo hợp phần, như chất mang, dung môi và chất hoạt động bề mặt (SFA). Do đó, sáng chế còn đề xuất hợp phần có chứa hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần về cơ bản gồm có hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần gồm hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp.

Sáng chế còn đề xuất hợp phần chất điều hòa sinh trưởng của cây có chứa hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần chất điều hòa sinh trưởng của cây về cơ bản gồm có hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần chất điều hòa sinh trưởng của cây gồm hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp.

Sáng chế còn đề xuất hợp phần kiểm soát căng thẳng phi sinh học ở cây có chứa hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần kiểm soát căng thẳng phi sinh học ở cây về cơ bản gồm có hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần kiểm soát căng thẳng phi sinh học ở cây gồm hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp.

Sáng chế còn đề xuất hợp phần chất ức chế sự nảy mầm của hạt có chứa hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần chất ức chế sự nảy mầm của hạt về cơ bản

gồm có hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp. Sáng chế cũng đề xuất hợp phần chất ức chế sự nảy mầm của hạt gồm hợp chất theo sáng chế và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp.

Hợp phần có thể ở dạng cô đặc mà được pha loãng trước khi sử dụng, mặc dù các hợp phần pha sẵn cũng có thể được sản xuất. Thường tiến hành pha loãng lần cuối cùng bằng nước, nhưng có thể tiến hành pha loãng bằng, ví dụ, phân bón lỏng, vi chất dinh dưỡng, cơ thể sinh vật, dầu hoặc các dung môi thay cho nước hoặc bổ sung thêm cùng với nước.

Các hợp phần này nhìn chung có chứa từ 0,1 đến 99 % theo khối lượng, đặc biệt từ 0,1 đến 95 % theo khối lượng, hợp chất theo sáng chế và từ 1 đến 99,9 % theo khối lượng chất bổ trợ tạo hợp phần mà tốt hơn là bao gồm từ 0 đến 25 % theo khối lượng chất hoạt động bề mặt.

Các hợp phần có thể được chọn từ nhiều loại hợp phần, nhiều loại trong số đó là đã biết từ ấn phẩm: Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, Xuất bản lần thứ 5, 1999. Các hợp phần này bao gồm bột rắc được (DP), bột hòa tan được (SP), hạt hòa tan trong nước (SG), hạt phân tán được trong nước (WG), bột thấm ướt được (WP), hạt (GR) (giải phóng chậm hoặc nhanh), chất cô tan được (SL), chất lỏng trộn lẫn được trong dầu (OL), chất lỏng thể tích cực thấp (UL), chất cô nhũ hóa được (EC), chất cô phân tán được (DC), nhũ tương (cả dầu trong nước (EW) và nước trong dầu (EO)), vi nhũ tương (ME), chất cô huyền phù (SC), sol khí, huyền phù viên nang (CS) và chế phẩm xử lý hạt. Loại hợp phần được chọn trong trường hợp bất kỳ sẽ phụ thuộc vào mục đích dự định cụ thể và các tính chất vật lý, hóa học và sinh học của hợp chất theo sáng chế.

Có thể điều chế bột rắc được (DP) bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều chất pha loãng rắn (ví dụ đất sét tự nhiên, cao lanh, pyrophyllit, bentonit, nhôm oxit, montmorillonit, đất tảo cát, đá phấn, đất diatomit, canxi phosphat, canxi và magie cacbonat, lưu huỳnh, đá vôi, bột nghiền, bột talc và các chất mang rắn vô cơ và hữu cơ khác) và nghiền cơ học hỗn hợp này thành bột mịn.

Có thể điều chế bột hòa tan được (SP) bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều muối vô cơ hòa tan trong nước (như natri bicacbonat, natri

cacbonat hoặc magie sulphat) hoặc một hoặc nhiều chất rắn hữu cơ hòa tan trong nước (như polysacarit) và, tùy ý, một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất làm phân tán hoặc hỗn hợp của các chất này để cải thiện độ phân tán/độ hòa tan trong nước. Sau đó, nghiền hỗn hợp thành bột mịn. Các hợp phần tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo ra hạt tan được trong nước (SG).

Có thể điều chế bột thấm ướt được (WP) bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn, một hoặc nhiều chất thấm ướt và, tốt hơn là, một hoặc nhiều chất làm phân tán và, tùy ý, một hoặc nhiều chất tạo huyền phù để xúc tiến sự phân tán trong chất lỏng. Sau đó, nghiền hỗn hợp thành bột mịn. Các hợp phần tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo ra hạt phân tán được trong nước (WG).

Có thể tạo ra hạt (GR) bằng cách nghiền thành hạt hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế và một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn dạng bột, hoặc từ hạt trống đã được tạo hình sẵn bằng cách hấp thụ hợp chất theo sáng chế (hoặc dung dịch chứa nó, trong tác nhân thích hợp) trong vật liệu dạng hạt xốp (như đá bọt, đất sét atapungit, đất tẩy màu, đất tảo cát, đất diatomit hoặc lõi ngô đã được nghiền) hoặc bằng cách hấp thụ hợp chất theo sáng chế (hoặc dung dịch chứa nó, trong tác nhân thích hợp) lên trên vật liệu lõi cứng (như cát, silicat, cacbonat khoáng, sulphat hoặc phosphat) và làm khô nếu cần. Các tác nhân thường được dùng để hỗ trợ cho hấp thụ hoặc hấp phụ bao gồm dung môi (như các dung môi dầu mỡ béo và thơm, các rượu, ete, keton và este) và các tác nhân kết dính (như polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic, dextrin, các loại đường và dầu thực vật). Một hoặc nhiều chất phụ gia khác cũng có thể được bao gồm trong hạt (ví dụ chất nhũ hóa, chất thấm ướt hoặc chất làm phân tán).

Có thể điều chế chất cô phân tán được (DC) bằng cách hòa tan hợp chất theo sáng chế trong nước hoặc dung môi hữu cơ, như keton, rượu hoặc glycol ete. Các dung dịch này có thể chứa chất hoạt động bề mặt (ví dụ để cải thiện khả năng pha loãng trong nước hoặc chống kết tinh trong thùng phun).

Có thể điều chế chất cô nhũ hóa được (EC) hoặc nhũ tương dầu trong nước (EW) bằng cách hòa tan hợp chất theo sáng chế trong dung môi hữu cơ (tùy ý chứa một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất nhũ hóa hoặc hỗn hợp của các chất này). Các dung môi hữu cơ thích hợp để dùng trong EC bao gồm các hydrocacbon

thơm (như alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen, ví dụ SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 và SOLVESSO 200; SOLVESSO là Nhãn hiệu đã Đăng ký), các keton (như xyclohexanon hoặc metylxyclohexanon) và các rượu (như rượu benzylic, rượu furfurylic hoặc butanol), N-alkylpyrrolidon (như N-metylpyrrolidon hoặc N-octylpyrrolidon), dimetyl amit của axit béo (như C₈-C₁₀ dimetyl amit của axit béo) và các hydrocacbon được clo hóa. Sản phẩm EC khi thêm nước có thể tự chuyển thành nhũ tương với độ ổn định đủ để cho dùng phun sương nhờ thiết bị thích hợp. Việc điều chế EW bao gồm việc thu được hợp chất theo sáng chế dưới dạng chất lỏng (nếu không phải là chất lỏng ở nhiệt độ trong phòng, nó có thể được làm tan chảy ở nhiệt độ thích hợp, thường là dưới 70°C) hoặc trong dung dịch (bằng cách hòa tan nó trong dung môi thích hợp) và sau đó nhũ hóa chất lỏng hoặc dung dịch thu được trong nước chứa một hoặc nhiều SFA, dưới lực cắt cao, để sản xuất nhũ tương. Các dung môi thích hợp để dùng trong EW bao gồm các dầu thực vật, các hydrocacbon được clo hóa (như clobenzen), các dung môi thơm (như alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen) và các dung môi hữu cơ thích hợp khác có độ tan thấp trong nước.

Các vi nhũ tương (ME) có thể được điều chế bằng cách trộn nước với hỗn hợp của một hoặc nhiều dung môi với một hoặc nhiều SFA, để tự sinh ra một chế phẩm lỏng đẳng hướng ổn định về nhiệt động học. Hợp chất theo sáng chế ban đầu có mặt trong nước hoặc hỗn hợp dung môi/SFA. Dung môi thích hợp để sử dụng trong ME bao gồm các dung môi được mô tả trước đây trong bản mô tả này để sử dụng trong EC hoặc trong EW. ME có thể hoặc là hệ dầu trong nước, hoặc là hệ nước trong dầu (có thể xác định hệ nào hiện diện bằng cách đo độ dẫn điện) và có thể thích hợp để trộn lẫn các thuốc diệt loài gây hại tan trong nước và tan trong dầu trong cùng một hợp phần. ME thích hợp để pha loãng trong nước, duy trì dưới dạng vi nhũ tương hoặc tạo thành một nhũ tương dầu trong nước thông thường.

Chất cô huyền phù (SC) có thể có chứa huyền phù chứa nước hoặc không chứa nước của các hạt rắn không tan đã được nghiền mịn của hợp chất theo sáng chế. Có thể điều chế SC bằng cách nghiền bi hoặc nghiền hạt hợp chất rắn theo sáng chế trong môi trường thích hợp, tùy ý với một hoặc nhiều chất làm phân tán, để sản xuất huyền phù hạt mịn của hợp chất. Một hoặc nhiều chất thấm ướt có thể được bao gồm trong hợp phần và chất tạo huyền phù có thể có thể được bao gồm để giảm tỷ lệ lắng đọng hạt. Theo cách khác, hợp chất theo sáng chế có thể được nghiền khô và được bổ sung vào

nước, chứa các chất đã được mô tả trước đây trong bản mô tả này, để sản xuất thành phẩm mong muốn.

Chế phẩm sol khí có chứa hợp chất theo sáng chế và chất đẩy thích hợp (ví dụ *n*-butan). Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được hòa tan hoặc được phân tán trong môi trường thích hợp (ví dụ nước hoặc chất lỏng trộn lẫn được trong nước, như *n*-propanol) để tạo ra hợp phần để sử dụng trong bơm phun dẫn động bằng tay, không được điều áp.

Có thể điều chế dạng viên nang huyền phù (CS) theo cách tương tự với việc điều chế hợp phần EW nhưng với giai đoạn polyme hóa bổ sung sao cho thu được thể phân tán trong nước của các giọt dầu, trong đó mỗi giọt dầu được bao nang bởi vỏ polyme và chứa hợp chất theo sáng chế và, tùy ý, chất mang hoặc chất pha loãng đối với hợp chất này. Vỏ polyme có thể được tạo ra bằng phản ứng đa trùng ngưng bề mặt phân cách, hoặc bằng quy trình tụ giọt. Các hợp phần này có thể tạo ra sự giải phóng có kiểm soát hợp chất theo sáng chế và chúng có thể được sử dụng để xử lý hạt. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được tạo hợp phần trong chất nền polyme có khả năng phân hủy sinh học để tạo ra sự giải phóng chậm, có kiểm soát của hợp chất này.

Hợp phần này có thể bao gồm một hoặc nhiều tá dược để cải thiện đặc tính sinh học của hợp phần, ví dụ bằng cách cải thiện sự thấm ướt, lưu giữ hoặc phân bố trên bề mặt; độ chống chịu mưa trên các bề mặt đã được xử lý; hoặc sự hấp thu hoặc độ linh động của hợp chất theo sáng chế. Các tá dược như vậy bao gồm chất hoạt động bề mặt (SFA), tá dược phun dựa trên dầu, ví dụ một số dầu khoáng hoặc dầu thực vật tự nhiên nhất định (như dầu đậu tương và đậu hạt cải), và hỗn hợp của các chất này với chất hỗ trợ tăng cường sinh học khác (các thành phần có thể hỗ trợ hoặc cải biến tác động của hợp chất theo sáng chế).

Chất thấm ướt, chất làm phân tán và chất nhũ hóa có thể là các SFA loại cation, anion, lưỡng tính hoặc không ion.

Các SFA thích hợp thuộc loại cation bao gồm các hợp chất amoni bậc bốn (ví dụ xetyltrimetyl amoni bromua), các imidazolin và các muối amin.

Các SFA thích hợp thuộc loại anion bao gồm các muối kim loại kiềm của các axit béo, các muối monoeste béo của axit sulfuric (ví dụ natri lauryl sulphat), các muối của các hợp chất thơm sulfonat hóa (ví dụ natri dodecylbenzensulphonat, canxi

đodexylbenzenulphonat, butylnaphtalen sulphonat và hỗn hợp của natri *đi-isopropyl-* và *tri-isopropyl-* naphtalen sulphonat), các ete sulphat, rượu ete sulphat (ví dụ natri laureth-3-sulphat), ete cacboxylat (ví dụ natri laureth-3-cacboxylat), các phosphat este (các sản phẩm từ phản ứng giữa một hoặc nhiều rượu béo và axit phosphoric (chiếm ưu thế là các mono-este) hoặc phospho pentoxit (chiếm ưu thế là các *đi-este*), ví dụ phản ứng giữa rượu lauryl và axit tetraphosphoric; ngoài ra, các sản phẩm này có thể được etoxylat hóa), các sulphosucinamat, parafin hoặc các olefin sulphonat, các taurat và các lignosulphonat.

Các SFA thích hợp loại lưỡng tính bao gồm các betain, propionat và glyxinat.

Các SFA loại không ion phù hợp bao gồm các sản phẩm ngưng tụ của các oxit alkylen, như etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng, với rượu béo (như rượu oleyl hoặc rượu xetyl) hoặc với alkylphenol (như octylphenol, nonylphenol hoặc octylcresol); các este một phần dẫn xuất từ các axit béo mạch dài hoặc anhydrit hexitol; các sản phẩm ngưng tụ của este một phần nói trên với etylen oxit; các polyme khối (bao gồm etylen oxit và propylen oxit); các alkanolamit; các este đơn giản (ví dụ polyetylen glycol este của axit béo); các amin oxit (ví dụ lauryl *đi*metyl amin oxit) và các lexithin.

Các chất tạo huyền phù thích hợp bao gồm các keo ưa nước (như các polysacarit, polyvinylpyrolidon hoặc natri cacboxymetylxenluloza) và đất sét trương nở (như bentonit hoặc atapungit).

Hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế có thể được dùng cho cây, phần cây, cơ quan của cây, vật liệu nhân giống cây hoặc vị trí sinh trưởng của cây.

Thuật ngữ "cây trồng" dùng để chỉ tất cả các phần hữu hình của cây trồng, bao gồm hạt, cây giống, cây non, rễ, thân củ, thân cây, cuống, tán lá, và quả.

Thuật ngữ "vị trí" như dùng trong bản mô tả này có nghĩa là cánh đồng mà cây trồng sinh trưởng ở trong hoặc ở trên, hoặc nơi mà hạt của cây trồng được gieo xuống, hoặc nơi mà hạt sẽ được đặt vào trong đất. Nó bao gồm đất, hạt, và cây non, cũng như sinh dưỡng được thiết lập.

Thuật ngữ "vật liệu nhân giống cây" dùng để chỉ tất cả các phần có khả năng sinh sản của cây trồng, ví dụ hạt hoặc phần sinh dưỡng của cây trồng chẳng hạn như

phần cắt và thân củ. Nó bao gồm hạt theo nghĩa hẹp, cũng như là rễ, quả, thân củ, thân hành, thân rễ, và các phần của cây trồng.

Việc sử dụng được thực hiện bằng cách phun hợp phần, chủ yếu bằng thiết bị phun gắn trên máy kéo cho diện tích rộng, nhưng cũng có thể sử dụng các phương pháp khác như rắc bụi (đối với bột), nhỏ giọt hoặc tẩm. Theo cách khác, hợp phần có thể được dùng trên các luống trồng hoặc trực tiếp lên hạt trước hoặc vào thời điểm trồng.

Hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế có thể được dùng trước khi nảy mầm hoặc sau khi nảy mầm. Một cách thích hợp, khi hợp phần được sử dụng để điều hòa sự sinh trưởng của cây trồng thời vụ hoặc tăng cường độ dung chịu đối với căng thẳng phi sinh học, hợp phần này có thể được dùng sau khi cây trồng nảy mầm. Khi hợp phần được sử dụng để ức chế hoặc làm chậm sự nảy mầm của hạt, hợp phần này có thể được dùng trước khi nảy mầm.

Sáng chế dự định dùng hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế cho vật liệu nhân giống cây trước khi, trong khi, hoặc sau khi trồng, hoặc sự kết hợp bất kỳ của các cách dùng này.

Mặc dù các thành phần hoạt tính có thể được dùng cho vật liệu nhân giống cây ở trạng thái sinh lý bất kỳ, phương pháp thông thường là sử dụng hạt ở trạng thái đủ bền để không gây tổn hại trong quá trình xử lý. Thông thường, hạt sẽ được thu hoạch từ cánh đồng; được lấy khỏi cây; và được tách lõi bất kỳ, cuống, vỏ ngoài, và thịt quả bao quanh hoặc vật liệu cây không phải hạt khác. Hạt tốt hơn là cũng ổn định về mặt sinh học đến mức độ mà việc xử lý sẽ không gây ra sự phá hủy sinh học đối với hạt. Tin rằng việc xử lý có thể được dùng cho hạt ở thời điểm bất kỳ từ lúc thu hoạch hạt đến khi gieo hạt bao gồm trong quá trình gieo hạt.

Phương pháp dùng hoặc xử lý các thành phần hoạt tính trên vật liệu nhân giống cây hoặc cho vị trí trồng cây là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này và bao gồm hồ, phủ, vê viên và ngâm cũng như dùng cho khay ươm, dùng theo luống trồng, tẩm đất, phun vào đất, tưới nhỏ giọt, dùng thông qua bình phun hoặc xoay quanh trục trung tâm, hoặc kết hợp vào đất (vết rộng hoặc theo dải). Theo cách khác hoặc ngoài ra, các thành phần hoạt tính có thể được dùng trên chất nền thích hợp được gieo cùng với vật liệu nhân giống cây.

Tỷ lệ dùng hợp chất theo sáng chế có thể thay đổi trong giới hạn rộng và tùy thuộc vào tính chất của đất, phương pháp dùng (trước hoặc sau khi nảy mầm; hồ hạt; dùng cho luống hạt; dùng cho đất không phải đất trồng trọt v.v.), cây trồng thời vụ, điều kiện khí hậu chủ đạo, và các yếu tố khác bị chi phối bởi phương pháp dùng, thời gian dùng và cây trồng đích. Để dùng cho lá hoặc mầm, hợp chất theo sáng chế theo sáng chế nhìn chung được dùng ở tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1 đến 2000g/hecta, đặc biệt từ 5 đến 1000g/hecta. Để xử lý hạt, tỷ lệ dùng thường nằm trong khoảng từ 0,0005 đến 150g trên 100kg hạt.

Hợp chất và hợp phần theo sáng chế có thể được dùng cho cây hai lá mầm hoặc cây một lá mầm. Các nhóm cây của cây trồng có ích trong đó hợp phần theo sáng chế có thể được sử dụng bao gồm cây lâu năm và cây hàng năm, chẳng hạn như cây quả mọng ví dụ cây mâm xôi, cây việt quất, cây nam việt quất, cây mâm xôi và cây dâu tây; cây ngũ cốc ví dụ cây lúa mạch, cây bắp (cây ngô), cây kê, cây yến mạch, cây lúa, cây lúa mạch đen, cây cao lương tiểu hắc mạch và cây lúa mỳ; cây lấy sợi ví dụ cây bông, cây lanh, cây gai dầu, cây đay và cây siđan; field crops ví dụ củ cải đường và củ cải đường cho chăn nuôi, cây cà phê, cây hublông, cây mù tạc, cây hạt cải dầu (cây cải dầu), cây anh túc, cây mía, cây hướng dương, cây chè và cây thuốc lá; cây ăn quả ví dụ cây táo, cây mơ, cây bơ, cây chuối, cây anh đào, cây cam quýt, cây xuân đào, cây đào, cây lê và cây mận; cỏ ví dụ cỏ Bermuda, cỏ poa (bluegrass), cỏ ống (bentgrass), cỏ chân rết, cỏ đuôi trâu, cỏ hoang, cỏ St. Augustine và cỏ Zoysia; cây thảo mộc chẳng hạn như cây húng quế, cây lưu ly (borage), cây hẹ, cây rau mùi, cây oải hương, cây cần núi, cây bạc hà, cây thuộc họ bạc hà (oregano), cây mùi tây, cây hương thảo, cây xô thơm và cây xạ hương; cây họ đậu ví dụ cây đậu đỏ, cây đậu lăng, cây đậu Hà Lan và cây đậu tương; hạt ví dụ hạnh nhân, đào lộn hột, lạc, hạt dẻ, đậu phộng, hồ đào pécân, hồ trăn và óc chó; cây họ cọ ví dụ cây cọ dầu; cây cảnh ví dụ cây hoa, cây bụi và cây gỗ; các cây gỗ khác, ví dụ cây cacao, cây dừa, cây ô liu và cây cao su; cây rau ví dụ cây măng tây, cây cà tím, cây bông cải xanh, cây bắp cải, cây cà rốt, cây dưa chuột, cây tỏi, cây rau diếp, cây bí, cây dưa, cây mướp tây, cây hành, cây hồ tiêu, cây khoai tây, cây bí đỏ, cây đại hoàng, cây rau bina và cây cà chua; và cây leo ví dụ cây nho.

Cây trồng được hiểu là các cây trồng trong tự nhiên, thu được bằng phương pháp lai giống thông thường hoặc thu được bằng kỹ thuật di truyền. Chúng bao gồm cây trồng chứa cái gọi là các tính trạng đầu ra (ví dụ, cải thiện tính ổn định bảo quản, giá trị dinh dưỡng cao hơn và cải thiện mùi vị).

Cây trồng được hiểu là còn bao gồm các cây trồng có khả năng dung chịu đối với thuốc diệt cỏ như bromoxynil hoặc nhóm thuốc diệt cỏ như chất ức chế ALS, EPSPS, GS, HPPD và PPO. Ví dụ về cây trồng được tạo khả năng dung chịu đối với imidazolinon, ví dụ imazamox, bằng phương pháp lai giống thông thường là cây cải dầu mùa hè Clearfield®. Ví dụ về cây trồng được tạo khả năng dung chịu đối với các thuốc diệt cỏ bằng phương pháp kỹ thuật di truyền bao gồm ví dụ các giống ngô kháng glyphosat và glufosinat được bán trên thị trường với nhãn hiệu RoundupReady®, Herculex I® và LibertyLink®.

Cây trồng còn được hiểu là các cây trồng có khả năng đề kháng tự nhiên hoặc được tạo khả năng đề kháng đối với côn trùng gây hại. Thuật ngữ này còn bao gồm cây trồng được biến đổi bằng cách sử dụng các kỹ thuật ADN tái tổ hợp, ví dụ, để có khả năng tổng hợp một hoặc nhiều độc tố tác dụng chọn lọc, như đã được biết, ví dụ, từ vi khuẩn sản xuất độc tố. Các ví dụ về độc tố mà có thể được biểu hiện bao gồm nội độc tố δ -, protein diệt côn trùng sinh dưỡng (Vip), protein diệt côn trùng của vi khuẩn định cư ở giun tròn, và độc tố được sản xuất bởi bộ cặp, động vật thuộc lớp nhện, ong bắp cày và nấm.

Ví dụ về cây trồng được cải biến để biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* là cây ngô Bt KnockOut® (Syngenta Seeds). Ví dụ về cây trồng có chứa nhiều hơn một gen mã hóa cho tính kháng thuốc diệt côn trùng và do đó biểu hiện nhiều hơn một độc tố là VipCot® (Syngenta Seeds). Cây trồng hoặc vật liệu hạt của chúng có thể còn kháng nhiều loại gây hại cùng lúc (gọi là sự kiện chuyển gen xếp chồng khi tạo ra bởi sự cải biến di truyền). Ví dụ, cây trồng có khả năng biểu hiện protein diệt côn trùng trong khi đồng thời có khả năng dung chịu thuốc diệt cỏ, ví dụ Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng để ức chế hoặc làm chậm sự nảy mầm hạt của của cây trồng không thời vụ, ví dụ làm một phần của chương trình không chế cỏ dại tích hợp. Do sự chậm nảy mầm của cỏ dại, hạt có thể tạo ra cây

giống thời vụ có sự khởi đầu mạnh hơn bằng cách làm giảm sự cạnh tranh với cỏ dại. Theo cách khác, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng để làm chậm sự nảy mầm hạt của cây trồng thời vụ, ví dụ để làm tăng tính linh động về thời điểm trồng cây đối với người trồng cây.

Thông thường, để kiểm soát cây trồng, người trồng cây sẽ sử dụng một hoặc nhiều chất sinh học hoặc hóa chất nông nghiệp khác ngoài hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế. Sáng chế cũng đề xuất hỗn hợp có chứa hợp chất hoặc hợp phần theo sáng chế, và thành phần hoạt tính khác.

Ví dụ về chất sinh học hoặc hóa chất nông nghiệp bao gồm thuốc diệt loài gây hại, như thuốc diệt ve bét, thuốc diệt vi khuẩn, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt giun tròn, chất điều hòa sinh trưởng của cây, chất tăng cường cây trồng, chất làm an toàn cũng như chất dinh dưỡng cho cây và phân bón cho cây. Ví dụ về thành phần pha trộn thích hợp có thể được tìm thấy trong ấn phẩm Pesticide Manual, ấn bản lần thứ 15 (xuất bản bởi British Crop Protection Council). Các hỗn hợp này có thể dùng cho cây, vật liệu nhân giống của cây hoặc vị trí trồng cây hoặc đồng thời (ví dụ hỗn hợp pha sẵn hoặc hỗn hợp trộn trong thùng), hoặc tuần tự theo thời gian biểu thích hợp. Sự đồng sử dụng của các thuốc diệt loài gây hại với sáng chế này có lợi ích phụ về giảm thiểu thời gian của người nông dân dùng để sử dụng các sản phẩm cho các cây trồng. Dạng kết hợp này cũng có thể bao hàm các tính trạng cây trồng cụ thể được kết hợp vào cây trồng bằng cách sử dụng phương pháp bất kỳ, ví dụ phương pháp cải biến di truyền hoặc gây giống thông thường.

Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I), công thức (II), công thức (III), hoặc công thức (IV), hoặc hợp phần có chứa hợp chất theo công thức (I), (II), (III), hoặc (IV) và chất bổ trợ tạo hợp phần chấp nhận được dùng trong nông nghiệp, để cải thiện độ dung chịu của cây trồng đối với căng thẳng phi sinh học, điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của cây, ức chế sự nảy mầm của hạt và/hoặc bảo vệ cây trồng chống lại các tác động của hóa chất gây độc thực vật.

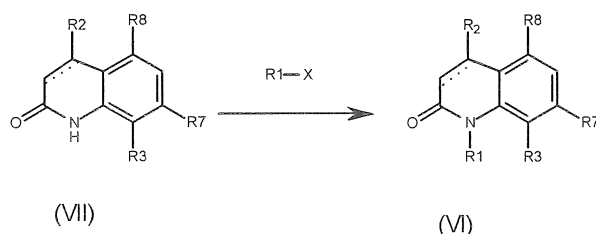
Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng hợp chất, hợp phần hoặc hỗn hợp theo sáng chế, để cải thiện độ dung chịu của cây trồng đối với căng thẳng phi sinh học, điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của cây, ức chế sự nảy mầm của hạt và/hoặc bảo vệ cây trồng chống lại các tác động gây độc thực vật của hóa chất.

Các hợp chất theo sáng chế này có thể được điều chế bằng các phương pháp sau.

Các ví dụ điều chế

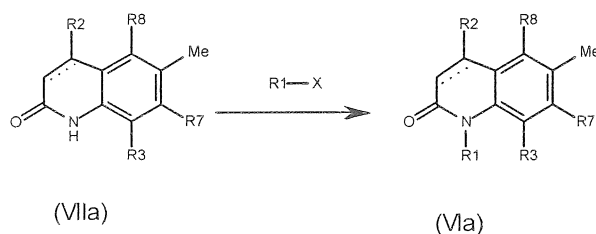
Sơ đồ 1-7 đưa ra phương pháp điều chế hợp chất có công thức (I), hợp chất có công thức (II) và hợp chất có công thức (III) theo sáng chế, trong đó R4, R5, R6, R7 và R8 là H khi có mặt.

Sơ đồ 1:



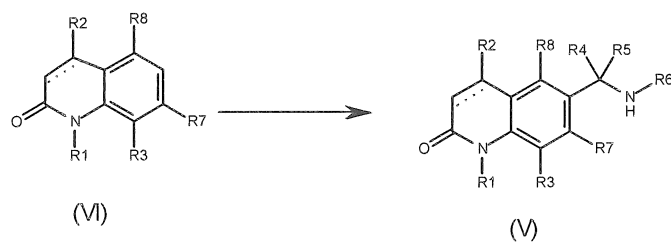
Hợp chất có công thức (VII) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này. Hợp chất có công thức (VI) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (VII) bằng phản ứng với chất alkyl hóa có công thức R1-X, trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, mesylat, triflat hoặc tosylat. Ví dụ, R1-X có thể là propyl iodua, etyl iodua, allyl bromua hoặc methyl iodua. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ, và tùy ý trong sự có mặt của chất xúc tác ái nhân.

Sơ đồ 2:



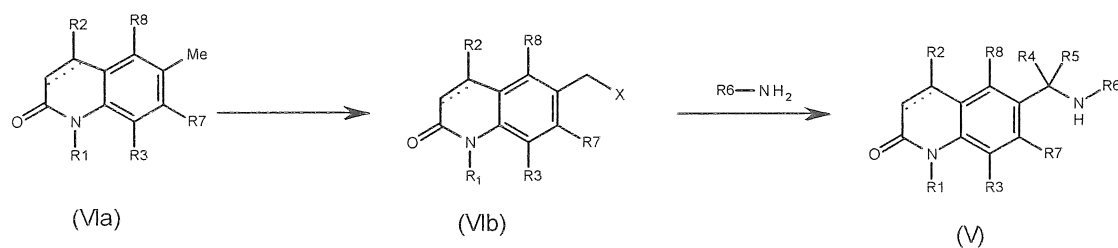
Hợp chất có công thức (VIIa) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này. Hợp chất có công thức (VIa) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (VIIa) bằng phản ứng với chất alkyl hóa có công thức R1-X, trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, mesylat, triflat hoặc tosylat. Ví dụ, R1-X có thể là propyl iodua, etyl iodua, allyl bromua hoặc methyl iodua. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ, và tùy ý trong sự có mặt của chất xúc tác ái nhân.

Sơ đồ 3:



Hợp chất có công thức (V), trong đó R4, R5 và R6 là H, có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (VI) bằng phản ứng với 2-clo-*N*-(hydroxymetyl)axetamid trong dung môi như axit axetic, và tùy ý trong sự có mặt của axit mạnh hơn như axit sulfuric, sau đó là thủy phân 2-cloaxetamid thu được bằng axit như HCl trong dung môi rượu. Hợp chất (V) có thể thu được dưới dạng muối hydroclorua của nó hoặc amin tự do sau khi trung hòa bằng bazơ.

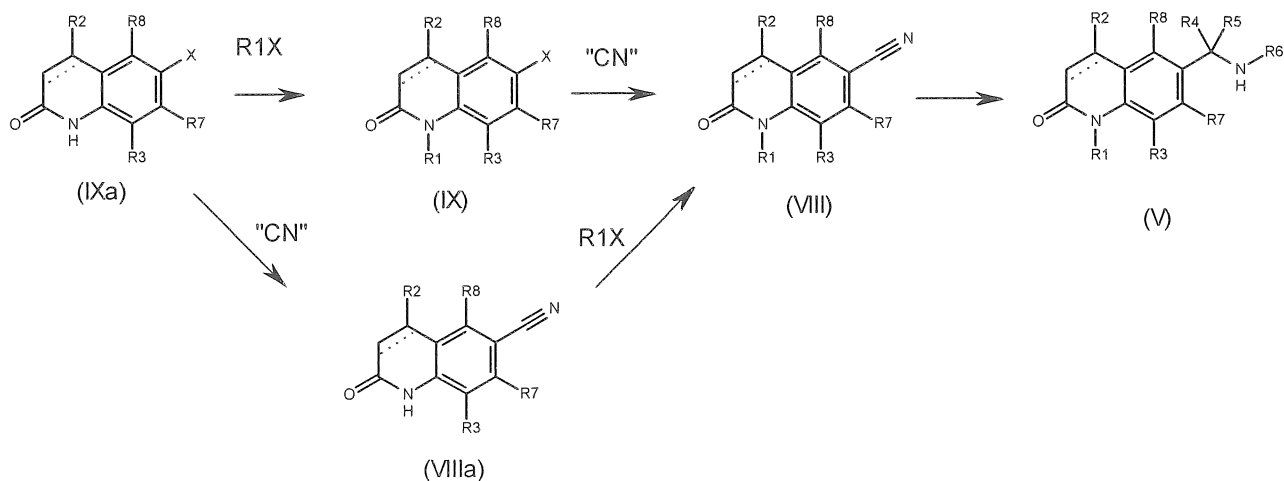
Sơ đồ 4:



Hợp chất có công thức (V), trong đó R4 và R5 là H, có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (VIb) trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, bằng phản ứng với amin có công thức R6NH₂ hoặc muối hydroclorua của nó có công thức R6NH₃Cl, trong sự có mặt hoặc không có mặt của bazơ như trietyl amin hoặc diisopropylamin. Ví dụ, R6NH₂ có thể là amoniac, metyl amin hoặc etyl amin.

Hợp chất có công thức (VIb) có thể thu được từ hợp chất có công thức (VIa) trong đó X là nhóm rời chuyển như Cl hoặc Br, bằng phản ứng gốc với *N*-bromosuccinimit hoặc *N*-closuccinimit trong sự có mặt của chất khơi mào như AIBN hoặc dibenzoyl peroxit.

Sơ đồ 5:



Hợp chất có công thức (V), trong đó R4, R5 và R6 là H, có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (VIII) bằng cách khử gốc xyano trong môi trường hydro trong sự có mặt của chất xúc tác như paladi trên than, hoặc bằng chất khử như natri borohyđrua trong sự có mặt của chất xúc tác chẳng hạn như niken clorua hoặc coban clorua.

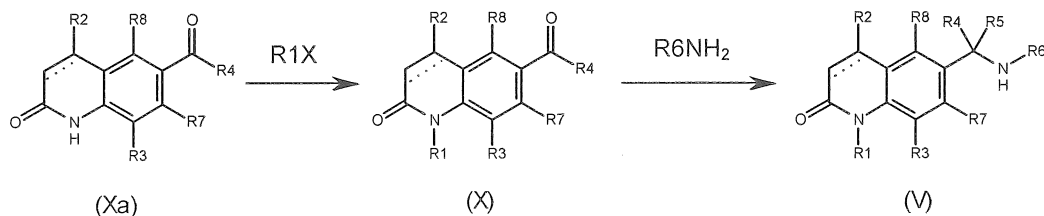
Hợp chất có công thức (VIII) có thể thu được từ hợp chất có công thức (IX) trong đó X là nhóm rời chuyển như Cl hoặc Br, I hoặc OTf bằng phản ứng ghép nối với muối xyanua như CuCN, NaCN, K₃[Fe(CN)₆], trong sự có mặt hoặc không có mặt của chất xúc tác như paladi (0) hoặc đồng, cuối cùng với phối tử bổ sung như được mô tả trong tài liệu (xem Zanon et al, *J. Am. Chem Soc.* 2003, 125, 2890-2891, Buchwald, S & all, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2013, 52: 10035-10039).

Hợp chất có công thức (IX) có thể thu được từ hợp chất có công thức (IXa) bằng phản ứng với chất alkyl hóa có công thức R1-X, trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, mesylat, triflat hoặc tosylat. Ví dụ, R1-X có thể là propyl iđua, etyl iđua, allyl bromua, hoặc metyl iđua. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ, và tùy ý trong sự có mặt của chất xúc tác ái nhân.

Theo cách khác, hợp chất có công thức (VIII) có thể thu được từ hợp chất có công thức (VIIIa) bằng phản ứng với chất alkyl hóa có công thức R1-X, trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, mesylat, triflat hoặc tosylat. Ví dụ, R1-X có thể là propyl iđua, etyl iđua, allyl bromua, hoặc metyl iđua. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ, và tùy ý trong sự có mặt của chất xúc tác ái nhân.

Hợp chất có công thức (VIIIa) có thể được điều chế từ hợp chất (IXa) trong đó X là nhóm rời chuyển như Cl hoặc Br, I hoặc OTf bằng phản ứng ghép nối với muối xyanua như đã được mô tả đối với hợp chất (VIIIa).

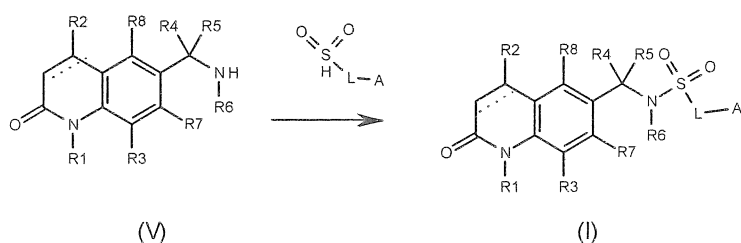
Sơ đồ 6:



Hợp chất có công thức (V) trong đó R5 là H, có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (X) bằng cách khử amin của gốc cacbonyl trong sự có mặt của amin có công thức R6NH₂ hoặc muối tương ứng của nó trong sự có mặt của chất khử như natri xyanobohydrua và cuối cùng là axit hữu cơ bổ sung như axit axetic.

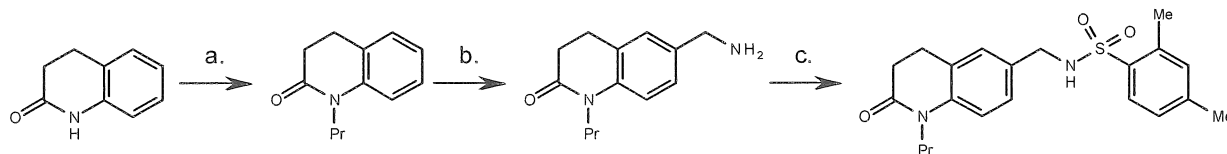
Hợp chất có công thức (X) có thể thu được từ hợp chất có công thức (Xa) bằng phản ứng với chất alkyl hóa có công thức R1-X, trong đó X là nhóm rời chuyển như halogen, mesylat, triflat hoặc tosylat. Ví dụ, R1-X có thể là propyl iodua, etyl iodua, allyl bromua, hoặc metyl iodua. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ, và tùy ý trong sự có mặt của chất xúc tác ái nhân.

Sơ đồ 7:



Hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (V) bằng phản ứng với sulfonyl clorua có công thức A-L-SO₂Cl. Các phản ứng này thường được tiến hành trong sự có mặt của bazơ hữu cơ, như *N*-etyldiisopropylamin. Ví dụ, A-L-SO₂Cl có thể là benzensulfonyl clorua, benzylsulfonyl clorua hoặc butylsulfonyl clorua. Hợp chất có công thức A-L-SO₂Cl là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này.

Ví dụ P1: Điều chế 2,4-dimetyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit (hợp chất 3.014)



a. 1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on

Hòa tan 3,4-dihydro-1H-quinolin-2-on (5,00g, 34mmol) trong dimetylformamit (DMF) (49 ml). Bổ sung kali cacbonat (14,2g, 102mmol). Ở nhiệt độ trong phòng, bổ sung từng giọt 1-bromopropan (12,5g, 102mmol, 9,27ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng bốn ngày ở nhiệt độ trong phòng và sau đó gia nhiệt trong 4 giờ ở nhiệt độ 60°C. Làm nguội hỗn hợp phản ứng xuống nhiệt độ trong phòng và rót hỗn hợp phản ứng vào 200ml nước đá. Chiết pha nước bằng 100ml etyl axetat (EtOAc). Rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước và nước muối. Làm khô pha hữu cơ bằng Na₂SO₄, lọc và cô để tạo ra 7,3g dầu màu vàng nhạt. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (5,2g, 27,5mmol, 81 %) dưới dạng dầu không màu. ¹H NMR (CDCl₃, 400MHz) δ 0,96 (3H, t); 1,68 (2H, sxt); 2,64 (2H, m); 2,88 (2H, m); 3,90 (2H, t); 6,99 (2H, m); 7,16 (1H, m); 7,24 (1H, m).

b. 6-(aminometyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on

Bổ sung 1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (4,50g, 23,8mmol) vào dung dịch chứa axit axetic (234 ml) và axit sulfuric (2,4ml). Ở nhiệt độ trong phòng, bổ sung 2-clo-N-(hydroxymetyl)axetamit (3,53g, 28,5mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong 72 giờ. Rót hỗn hợp phản ứng vào nước đá, và chiết hỗn hợp bằng tert-butyl methyl ete. Rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước muối. Làm khô pha hữu cơ bằng Na₂SO₄, lọc và cô. Thu được 7,8g amit thô và tinh chế trên silicagel để tạo ra 4,1g 2-cloaxetamit tương ứng, khuấy tiếp trong ete dầu mỏ, lọc và làm khô để tạo ra 3,4g chất rắn màu trắng.

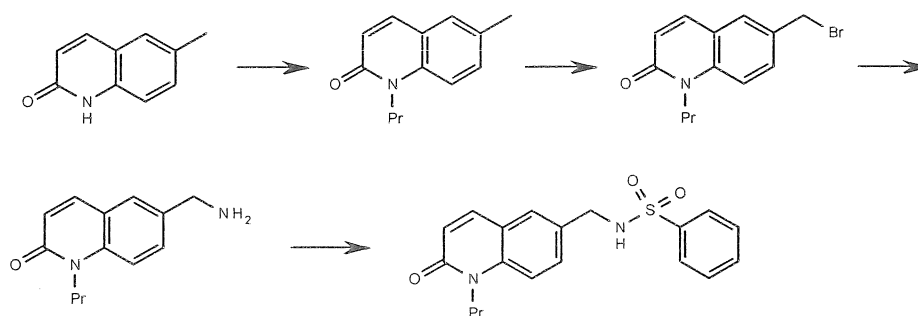
Hòa tan 2-cloaxetamit thu được vào hỗn hợp 1:1 của HCl đặc/EtOH (25ml), và sau đó gia nhiệt đến hồi lưu trong 3 giờ, sau đó khuấy qua đêm. Gia nhiệt lại hỗn hợp phản ứng trong 2 giờ ở điều kiện hồi lưu. Làm bay hơi dung môi dưới áp suất giảm và khuấy phần cặn trong ete, lọc và làm khô để tạo ra 6-(aminometyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on hydroclorua (3,26g, 12,8mmol, hiệu suất 54 %) dưới dạng chất

rắn màu be. ^1H NMR (DMSO, 400MHz) δ 0,87 (3H, t); 1,51 (2H, sxt); 2,53 (2H, m); 2,85 (2H, t); 3,87 (2H, t); 3,94 (2H, q); 4,86 (2H, br s); 7,18 (1H, d); 7,37 (1H, s); 7,41 (1H, d).

c. 2,4-đimetyl-*N*-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit (hợp chất 3.014)

Khuấy 6-(aminometyl)-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-2-on (0,055g, 0,216mmol) trong EtOAc (4ml). Làm lạnh hỗn hợp phản ứng trên đá. Bổ sung diisopropyletylamin (0,132ml, 0,756mmol) và sau đó là 2,4-đimetylbenzensulfonyl clorua (0,059g, 0,281mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong 3 giờ ở nhiệt độ 50°C. Cô hỗn hợp phản ứng. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 2,4-đimetyl-*N*-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit (59,4mg, 0,154mmol, hiệu suất 71 %) dưới dạng chất rắn màu trắng. điểm nóng chảy: 166°- 167°C; ^1H NMR (CDCl_3 , 400MHz) δ 0,94 (3H, t); 1,62 (2H, sxt); 2,37 (3H, s); 2,58 (4H, m); 2,78 (2H, m); 3,85 (2H, t); 4,05 (2H, d, $J = 6,2$); 4,89 (1H, t); 6,86 (1H, d); 6,95 (1H, s); 7,04 (1H, dd); 7,10 (2H, m).

Ví dụ P2: Điều chế *N*-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit (hợp chất 7.001)



a. 6-metyl-1-propyl-quinolin-2-on

Hòa tan 6-metyl-1H-quinolin-2-on (5,00g, 31,41mmol) trong DMF (50ml). Bổ sung kali cacbonat (8,68g, 62,8mmol), sau đó là 1-bromopropan (19,3g, 157mmol, 14,3ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng qua đêm ở nhiệt độ trong phòng và sau đó rót hỗn hợp phản ứng vào 200ml nước đá. Chiết pha nước bằng etyl axetat và rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước và nước muối. Làm khô pha hữu cơ bằng Na_2SO_4 , lọc và cô để tạo ra 9,1g dầu màu vàng nhạt. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 6-metyl-1-propyl-quinolin-2-on (2,3g, 11mmol, 36 %) dưới dạng dầu không màu. ^1H NMR

(400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1,04 (t, 3 H), 1,73 - 1,82 (m, 2 H), 2,41 (s, 3 H), 4,20 - 4,27 (m, 2 H), 6,65 - 6,70 (m, 1 H), 7,26 (s, 1H), 7,33 - 7,39 (m, 2 H), 7,60 (d, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,90, (202, $\text{M}+\text{H}^+$).

b. 6-(bromometyl)-1-propyl-quinolin-2-on

Hòa tan 6-metyl-1-propyl-quinolin-2-on (2,5g, 12mmol) trong dung dịch của cacbon tetraclorea (5ml) và 1-bromopyrrolidin-2,5-dion (2,5g, 14mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng và gia nhiệt ở nhiệt độ 80°C sau đó bổ sung azobisisobutyronitril (0,2g, 1,2mmol). Khuấy hỗn hợp thu được ở nhiệt độ 80°C trong 6 giờ và làm nguội. Bổ sung nước và chiết hỗn hợp bằng etyl axetat. Rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước muối, làm khô bằng Na_2SO_4 , lọc và cô để tạo ra 0,61g dầu màu nâu. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 6-(bromometyl)-1-propyl-quinolin-2-on (2,6g, 9,3mmol, 75%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1,02 - 1,08 (m, 3 H), 1,77 (sxt, 2 H), 4,19 - 4,29 (m, 2 H), 4,58 (s, 2 H), 6,72 (d, 1 H), 7,31 - 7,36 (m, 1 H), 7,56 - 7,66 (m, 3 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,94, (280, $\text{M}+\text{H}^+$).

c. 6-(aminometyl)-1-propyl-quinolin-2-on

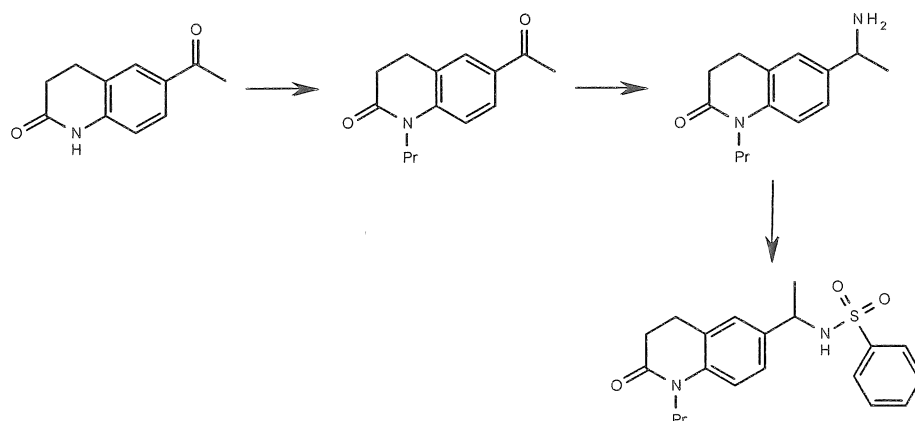
Hòa tan 6-(bromometyl)-1-propyl-quinolin-2-on (1,6g, 5,7mmol) trong dung dịch của NH_3/MeOH (41ml, 7mol/l). Khuấy dung dịch màu vàng qua đêm, sau khi biến đổi hoàn toàn, cô dung dịch trong chân không và tinh chế trên silicagel để tạo ra 6-(aminometyl)-1-propyl-quinolin-2-on (710mg, 3,28mmol, 57%); ^1H NMR (400 MHz, MeOH) δ ppm 1,03 (t, 3 H), 1,72 - 1,81 (m, 2 H), 4,20 (s, 2 H), 4,29 - 4,35 (m, 2 H), 6,72 (d, 1 H), 7,66 - 7,74 (m, 2 H), 7,78 (d, 1 H), 7,92 (d, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,26, (218, $\text{M}+\text{H}^+$).

d. N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit (hợp chất 7.001)

Khuấy 6-(aminometyl)-1-propyl-quinolin-2-on (0,100g, 0,462mmol) trong EtOAc (4ml). Làm lạnh hỗn hợp phản ứng trên đá. Bổ sung diisopropyletylamin (0,179mg, 1,38mmol) và sau đó benzensulfonyl clorua (0,089g, 0,508mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong 1 giờ và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit (86mg, hiệu suất 52%) dưới dạng chất rắn màu trắng. điểm nóng chảy: $204^\circ - 206^\circ\text{C}$; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 0,93 (t, 3 H), 1,60 (sxt, 2 H), 4,06 (d, 2 H), 4,11 - 4,21 (m, 2 H), 6,53 - 6,64 (m, 1 H),

7,51 (s, 1 H), 7,41 - 7,48 (m, 2 H), 7,51 - 7,64 (m, 3 H), 7,76 - 7,86 (m, 3 H), 8,21 (t, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,85, (357, $M+H^+$).

Ví dụ P3: Điều chế N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)ethyl]benzensulfonamit (hợp chất 14.001)



a. Điều chế 6-axetyl-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on

Hòa tan 6-axetyl-3,4-dihydro-1H-quinolin-2-on (500mg, 2,64mmol) trong DMF (5ml) và bổ sung kali cacbonat (0,547g, 3,96mmol) sau đó là 1-bromopropan (0,487g, 3,96mmol, 0,36ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng qua đêm ở nhiệt độ trong phòng và bổ sung kali cacbonat thêm nữa (0,550g, 1,5 đương lượng) và 1-bromopropan (0,18ml, 0,75 đương lượng). Gia nhiệt hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 50°C cho đến khi được biến đổi hoàn toàn, làm nguội hỗn hợp phản ứng xuống nhiệt độ trong phòng và rót vào nước đá. Chiết pha nước bằng etyl axetat. Rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước và nước muối, làm khô bằng Na_2SO_4 , lọc và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 6-axetyl-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (499mg, 2,15mmol, 81 %) dưới dạng chất rắn màu trắng. điểm nóng chảy: 90-93°C; 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 0,97 (t, 3 H), 1,62 - 1,72 (m, 2 H), 2,57 - 2,59 (m, 3 H), 2,68 (dd, 2 H), 2,93 - 2,98 (m, 2 H), 3,89 - 3,97 (m, 2 H), 7,03 (d, 1 H), 7,77 - 7,88 (m, 2 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,84, (232, $M+H^+$).

b. Điều chế 6-(1-aminoethyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on

Hòa tan 6-axetyl-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (480mg, 2,08mmol) trong metanol (7ml, 2,08mmol) sau đó bổ sung amoni axetat (1,62g, 20,8mmol) và natri xyanobo hydrua (0,686g, 10,4mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Loại bỏ dung môi dưới áp suất giảm và hòa tan phần cặn trong etyl axetat và

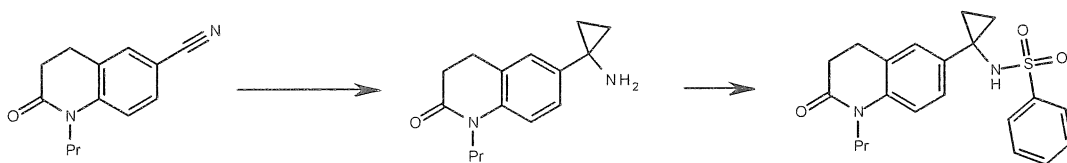
axit hóa bằng HCl 2M (cho đến khi độ pH: 2). Loại bỏ lớp hữu cơ. Sau đó, xử lý lớp chứa nước bằng NaOH 2M (cho đến khi độ pH: 12) và chiết 3 lần bằng etyl axetat. Rửa lớp hữu cơ kết hợp bằng nước muối, làm khô trên Na_2SO_4 , lọc và làm bay hơi để tạo ra 177mg dầu không màu.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 0,96 (t, 3 H), 1,38 (d, 3 H), 1,66 - 1,72 (m, 2 H), 2,63 (dd, 2 H), 2,84 - 2,91 (m, 2 H), 3,85 - 3,91 (m, 2 H), 4,06 - 4,16 (m, 2 H), 6,94 (d, 1 H), 7,15 - 7,22 (m, 2 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,76, (234, $\text{M}+\text{H}^+$).

c. N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)etyl]benzensulfonamit (hợp chất 14.001)

Khuấy 6-(1-aminoetyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (0,050g, 0,215mmol) trong EtOAc (2ml). Làm lạnh hỗn hợp phản ứng trên đá. Bổ sung diisopropyletylamin (0,093ml, 0,538mmol) và sau đó là benzensulfonyl clorua (0,039g, 0,215mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng qua đêm và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit (49mg, hiệu suất 61 %) dưới dạng gôm không màu. ^1H NMR (400 MHz, CLOROFORM-d) δ ppm 0,94 (t, 3 H), 1,42 (d, 3 H), 1,62 (sxt, 2 H), 2,49 - 2,59 (m, 2 H), 2,64 - 2,81 (m, 2 H), 3,77 - 3,89 (m, 2 H), 4,47 (quin, 1 H), 5,08 - 5,26 (m, 1 H), 6,79 (d, 1 H), 6,84 (d, 1 H), 6,99 (dd, 1 H), 7,33 - 7,42 (m, 2 H), 7,44 - 7,52 (m, 1 H), 7,67 - 7,80 (m, 2 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,93, (373, $\text{M}+\text{H}^+$).

Ví dụ P4: Điều chế N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)xyclopropyl]benzensulfonamit (hợp chất 15.001)



a. Điều chế 6-(1-aminoxyclopropyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on

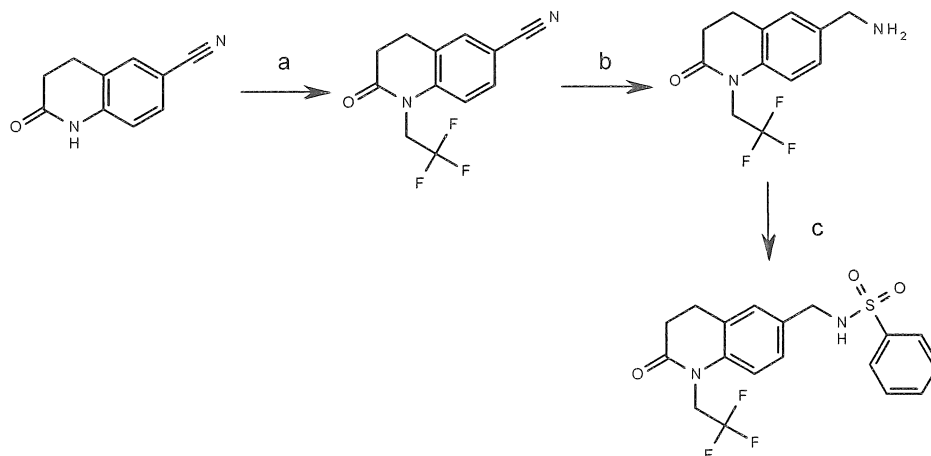
Dưới argon, hòa tan 2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-cacbonitril (0,215g, 1 mmol) trong dietyl ete (10ml). Bổ sung titan(IV) isopropoxit (0,323g, 1,1mmol) và làm nguội hỗn hợp phản ứng xuống nhiệt độ 0°C . Bổ sung từng giọt etylmagie bromua (1,0mol/l) trong TBME (2,2ml, 1,9g, 2,2mmol) và khuấy trong 10 phút sau đó làm ấm

đến nhiệt độ trong phòng. Bổ sung bortrifloriddietylerat (0,265ml, 0,323g) và khuấy. Bổ sung dung dịch chứa axit clohydric (1M), sau đó là TBME vào hỗn hợp phản ứng, thu gom lớp chứa nước và xử lý bằng natri hydroxit (2M) cho đến khi độ pH=10). Sau đó, chiết hỗn hợp bằng TBME ba lần. Kết hợp lớp hữu cơ, rửa bằng nước muối, làm khô trên Na_2SO_4 và cô trong chân không. Tinh chế phần cặn bằng silicagel để tạo ra 6-(1-aminocyclopropyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (77mg, 0,315mmol) dưới dạng dầu không màu. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 0,94 (d, 3 H) 1,66 (sxt, 2 H) 2,61 - 2,66 (m, 2 H) 2,85 - 2,90 (m, 2 H) 3,85 - 3,91 (m, 2H) 6,92 (d, 1 H) 7,09 - 7,19 (m, 2 H). LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,55, (245, $\text{M}+\text{H}^+$).

b. N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)cyclopropyl]benzensulfonamit (hợp chất 15.001)

Khuấy 6-(1-aminocyclopropyl)-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-2-on (0,050g, 0,204mmol) trong EtOAc (2ml). Làm lạnh hỗn hợp phản ứng trên đá. Bổ sung diisopropyletylamin (0,087ml, 0,511mmol) và sau đó là benzensulfonyl clorua (0,037g, 0,204mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng qua đêm và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)cyclopropyl]benzensulfonamit (57mg, hiệu suất 72%) dưới dạng gồm không màu. ^1H NMR (400 MHz, CLOROFORM-d) δ ppm 0,87 - 0,98 (m, 3 H), 1,02 - 1,08 (m, 2 H), 1,29 - 1,37 (m, 2 H), 1,59 (sxt, 2 H), 2,48 - 2,57 (m, 2 H), 2,61 - 2,70 (m, 2 H), 3,76 - 3,88 (m, 2 H), 6,11 (s, 1 H), 6,64 - 6,74 (m, 1 H), 6,84 (d, 1 H), 7,01 (dd, 1 H), 7,24 - 7,32 (m, 2 H), 7,36 - 7,44 (m, 1 H), 7,61 - 7,68 (m, 2 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,93, (385, $\text{M}+\text{H}^+$).

Ví dụ P5: Điều chế 6-(aminometyl)-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-2-on (hợp chất 11.001)



a. 2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-đihydroquinolin-6-cacbonitril

Hòa tan 2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-cacbonitril (0,500g, 2,90mmol) trong DMF (15 ml) và bổ sung kali cacbonat (1,01g, 7,26mmol) sau đó là bổ sung 2,2,2-trifloetyl triflometansulfonat (0,604ml, 4,07mmol) từng giọt. Gia nhiệt hỗn hợp phản ứng đến nhiệt độ 50°C và khuấy trong 2 giờ. Bổ sung 0,5 đương lượng khác của 2,2,2-trifloetyl triflometansulfonat (0,216ml) và khuấy hỗn hợp phản ứng trong 2 giờ nữa. Rót hỗn hợp phản ứng lên trên nước và chiết hỗn hợp phản ứng bằng etyl axetat. Rửa các lớp hữu cơ kết hợp bằng nước và nước muối, làm khô trên Na₂SO₄ và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-đihydroquinolin-6-cacbonitril (0,485 g, 66%) dưới dạng gồm màu vàng nhạt.; ¹H NMR (400 MHz, CLOROFORM-d) δ ppm 2,73 - 2,81 (m, 2 H), 2,98 - 3,07 (m, 2 H), 4,67 (q, 2 H), 7,15 (d, 1 H), 7,45 - 7,53 (m, 1 H), 7,59 (dd, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,84, (255, M+H⁺).

b. 6-(aminometyl)-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on

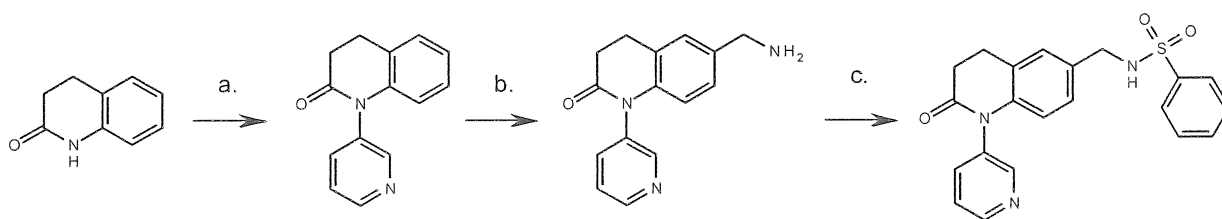
Cho 2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-đihydroquinolin-6-cacbonitril (0,485g, 1,91 mmol) và Pd/C 10% (0,049g, 0,046mmol) vào trong bình thót cổ dưới argon và bổ sung etanol đã loại khí (19ml). Bổ sung axit clohydric gốc nước (32 % khối lượng, 1,404 ml) và khuấy hỗn hợp phản ứng dưới môi trường khí hydro phân tử qua đêm. Lọc hỗn hợp phản ứng qua đệm xelit và cô để tạo ra 6-(aminometyl)-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on thô (602mg, định lượng) dưới dạng muối hydroclorua của nó. Hợp chất này được sử dụng như vậy cho bước tiếp theo. ¹H NMR (400 MHz, METANOL-d₄) δ ppm 2,70 (t, 2 H), 2,98 (t, 2 H), 4,08 (s, 2 H), 4,74 - 4,85

(m, 2 H), 7,26 - 7,47 (m, 3 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,30, (255, $M+H^+$).

c. N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit (hợp chất 11.001)

Tạo huyền phù 6-(aminometyl)-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-2-on hydroclorua (0,150g, 0,509mmol) trong etyl axetat (5ml) và bổ sung từng giọt *N*-etyl-*N*-isopropyl-propan-2-amin (0,218ml, 1,27mmol). Sau đó, bổ sung từng giọt benzensulfonyl clorua (0,102g, 0,560mmol) và khuấy hỗn hợp phản ứng trong 3 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Loại bỏ dung môi trong chân không và tinh chế hợp chất thô trên silicagel để tạo ra N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit (144 mg, 71%) dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt. 1H NMR (400 MHz, CLOROFORM-*d*) δ ppm 1,26 (t, 1 H), 2,05 (s, 1 H), 2,61 - 2,72 (m, 2 H), 2,82 - 2,91 (m, 2 H), 4,04 - 4,17 (m, 2 H), 4,04 - 4,19 (m, 3 H), 4,61 (q, 2 H), 5,03 (t, 1 H), 6,94 (d, 1 H), 7,01 - 7,06 (m, 1 H), 7,07 - 7,16 (m, 1 H), 7,47 - 7,54 (m, 2 H), 7,55 - 7,66 (m, 1 H), 7,86 (d, 2 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,92, (399, $M+H^+$).

Ví dụ P6: Điều chế N-[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit 9.001



a. 1-(3-pyridyl)-3,4-dihydroquinolin-2-on

Dưới argon, bổ sung 3,4-dihydro-1H-quinolin-2-on (0,736g, 5,00 mmol), xesi cacbonat (4,14g, 12,5mmol), đồng Iodua (0,145, 1mmol) và etyl 2-oxoxyclohexanecarboxylat (0,426g, 2,25mmol). Sau đó, bổ sung 3-iodopyridin (1,13g, 5,5mmol) trong dimetylsulfoxit (5ml), và gia nhiệt hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ 110°C trong 3 giờ. Rót hỗn hợp vào 20ml nước đá, chiết pha nước bằng etyl axetat và rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng nước và nước muối, làm khô bằng Na_2SO_4 , lọc và cô. Tinh chế sản phẩm thô trên silicagel để tạo ra 1-(3-pyridyl)-3,4-dihydroquinolin-2-on

(746mg, 3,32mmol, 66,5 %). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 2,82 - 2,89 (m, 2 H), 3,06 - 3,13 (m, 2 H), 6,34 (d, 1 H), 7,00 - 7,10 (m, 2 H), 7,24 (d, 1 H), 7,46 (dd, 1 H), 7,64 (dt, 1 H), 8,52 (d, 1 H), 8,66 (dd, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,72, (225, $\text{M}+\text{H}^+$).

b. 6-(aminometyl)-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on

Hòa tan 1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on (312mg, 1,39mmol) trong axit axetic (5ml) trong axit sulfuric (1,5ml), sau đó bổ sung 2-clo-N-(hydroxymetyl)axetamit (0,171g, 1,39mmol), khuấy hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ ở nhiệt độ 50°C . Bổ sung nước đá và dung dịch chứa kali cacbonat, chiết pha nước bằng etyl axetat, và làm khô pha hữu cơ và cô trong chân không. Tinh chế sản phẩm thô bằng sắc ký nhanh để tạo ra 2-clo-N-[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-6-yl]metyl]axetamit (177mg, 38%); ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 2,84 (dd, 2 H), 3,05 - 3,13 (m, 2 H), 4,06 - 4,13 (m, 2 H), 4,43 (d, 2 H), 6,32 (d, 1 H), 6,90 (br. s., 1 H), 6,99 (d, 1 H), 7,19 (s, 1 H), 7,47 (dd, 1 H), 7,62 (dt, 1 H), 8,50 (d, 1 H), 8,67 (dd, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,62, (328, $\text{M}-\text{H}^+$), (329, $\text{M}+\text{H}^+$).

Bổ sung axit clohydric (1,25ml) vào 2-clo-N-[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-6-yl]metyl]axetamit (167mg, 0,506mmol) trong etanol (1,25ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng qua đêm ở nhiệt độ $90-95^\circ\text{C}$. Bổ sung etanol (10 ml) vào hỗn hợp này và lọc chất kết tủa, sau đó rửa bằng etyl ete để tạo ra 6-(aminometyl)-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on dihydroclorua (155 mg, 93%), hợp chất này được sử dụng trực tiếp cho bước tiếp theo; LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,22, (254, $\text{M}+\text{H}^+$).

c. Điều chế N-[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit (hợp chất 9.001)

Tạo huyền phù 6-(aminometyl)-1-(3-pyridyl)-3,4-đihydroquinolin-2-on dihydroclorua (0,163g, 0,50mmol) trong etyl axetat (6,5ml) với diisopropyletylamin (0,226g, 1,75mmol) và khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 15 phút. Bổ sung benzensulfonyl clorua (0,115g, 0,65mmol) và khuấy hỗn hợp phản ứng qua cuối tuần ở nhiệt độ trong phòng. Bổ sung nước và chiết hai lần bằng etyl axetat. Rửa các pha hữu cơ kết hợp bằng dung dịch chứa natri hydro cacbonat, làm khô và cô để tạo ra N-

[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]methyl]benzensulfonamit (48 mg, 24%) sau khi tinh chế bằng sắc ký nhanh. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 2,76 - 2,85 (m, 2 H), 2,98 - 3,05 (m, 2 H), 4,06 - 4,13 (m, 2 H), 4,83 (t, 1 H), 6,23 (d, 1 H), 6,88 (d, 1 H), 7,11 (s, 1 H), 7,46 (dd, 1 H), 7,49 - 7,56 (m, 2 H), 7,60 (d, 2 H), 7,87 (d, 2 H), 8,42 (d, 1 H), 8,66 (d, $J=3,67$ Hz, 1 H); LC-MS (Phương pháp A): điểm nóng chảy 0,79, (392, $\text{M}-\text{H}^+$), (394, $\text{M}+\text{H}^+$).

Hợp chất theo sáng chế được điều chế bằng cách sử dụng các phương pháp này, như được trình bày trong bảng dưới đây.

Hợp chất	Tên	RT (phút)	[M+H] (được đo)	Phương pháp	MP ($^{\circ}\text{C}$)
2.024	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-1-(p-tolyl)metansulfonamit	0,91	373	A	
3.024	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-1-(p-tolyl)metansulfonamit	0,96	387	A	
2.015	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-4-(triflometyl)benzensulfonamit	0,94	413	A	180-181
2.012	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-4-metyl-benzensulfonamit	0,89	359	A	202-203
3.012	4-metyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]benzensulfonamit	0,94	373	A	153-154
3.015	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-4-(triflometyl)benzensulfonamit	0,99	427	A	138-140
2.006	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-2,4-diflo-benzensulfonamit	0,86	381	A	167-168
2.009	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-4-flo-benzensulfonamit	0,85	363	A	190-191
2.017	2-bromo-N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]benzensulfonamit	0,87	425	A	206-207
2.011	N-[(1-ethyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)methyl]-2-metyl-benzensulfonamit	0,88	359	A	203-206

2.014	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2,4-đimetyl-benzensulfonamit	0,93	373	A	199-200
2.001	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,84	346	A	114-124
2.010	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-4-metoxo-benzensulfonamit	0,85	375	A	147-150
2.007	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-flo-benzensulfonamit	0,84	364	A	155-163
2.002	4-bromo-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit				176-183
3.006	2,4-điflo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,91	395	A	141-144
3.005	2,6-điflo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,88	395	A	182-183
3.009	4-flo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,9	377	A	143-144
3.007	2-flo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,89	377	A	155-156
3.001	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,89	359	A	159-161
3.011	2-metyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,93	373	A	163-165
3.004	4-clo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,95	393	A	138-139
3.010	4-metoxo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,9	390	A	143-144
3.014	2,4-đimetyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,98	388	A	166-167
3.017	2-bromo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,93	439	A	157-159
3.016	4-isopropoxy-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,99	417	A	138-139

3.002	4-bromo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,96	439	A	143-145
3.023	1-(2-flophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,41	391	B	
3.025	1-(2,4-diflophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,44	409	B	
3.026	1-(2,6-diflophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,42	409	B	
3.036	1-(4-bromo-2-flo-phenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,58	469	B	
3.037	1-(2,5-diflophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,43	409	B	
3.038	1-(2,3-diflophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,44	409	B	
3.039	1-(2-bromo-4-flo-phenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,55	469	B	
3.040	1-(2-bromo-4-clo-phenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,66	485	B	
3.041	1-(4-xyanophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,3	398	B	
3.042	1-(4-xyano-2-flo-phenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,35	416	B	
3.043	1-(2-xyanophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,31	398	B	
3.044	1-(2-clo-4-flo-phenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,49	425	B	
3.045	1-(4-tert-butylphenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-	1,77	429	B	

	yl)metyl]metansulfonamit				
3.046	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[4-(triflometoxy)phenyl]metansulfonamit	1,62	457	B	
3047	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[4-(triflometyl)phenyl]metansulfonamit	1,58	441	B	
3.033	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[3-(triflometyl)phenyl]metansulfonamit	1,57	441	B	
3.031	1-(4-clophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,51	407	B	
3.050	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[4-(triflometylsulfanyl)phenyl]metansulfonamit	1,7	473	B	
3.032	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[6-(triflometyl)-3-pyridyl]metansulfonamit	1,4	442	B	
3.022	1-(2-bromophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,52	451	B	
3.035	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-phenyl-etansulfonamit	1,45	387	B	
3.030	1-(3-flophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,41	391	B	
3.029	1-(2,4-diclophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,64	441	B	
3.049	1-(3-bromophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,53	451	B	
3.028	1-(4-nitrophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,38	418	B	
3.022	1-(4-bromophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,54	451	B	
3.034	metyl 3-[(2-oxo-1-propyl-3,4-	1,13	369	B	

	đihydroquinolin-6-yl)metylsulfamoyl]propanoat				
3.021	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-phenyl-metansulfonamit	1,38	373	B	
3.019	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]butan-1-sulfonamit	1,34	339	B	
3.018	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]xyclopropan-sulfonamit	1,15	323	B	
2.023	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-(2-flophenyl)metansulfonamit	1,29	377	B	
2.025	1-(2,4-điflophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,33	395	B	
2.026	1-(2,6-điflophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,31	395	B	
2.036	1-(4-bromo-2-flo-phenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,47	455	B	
2.037	1-(2,5-điflophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,32	395	B	
2.038	1-(2,3-điflophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,33	395	B	
2.039	1-(2-bromo-4-flo-phenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,57	455	B	
2.040	1-(2-bromo-4-clo-phenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,56	471	B	
2.041	1-(2-xyanophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,2	384	B	
2.042	1-(2-clo-4-flo-phenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,39	411	B	
2.045	1-(4-tert-butylphenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,68	415	B	

2.046	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[4-(triflometoxy)phenyl]metansulfonamit	1,53	443	B	
2.047	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[4-(triflometyl)phenyl]metansulfonamit	1,49	427	B	
2.033	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[3-(triflometyl)phenyl]metansulfonamit	1,48	427	B	
2.031	1-(4-clophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,41	393	B	
2.032	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-[6-(triflometyl)-3-pyridyl]metansulfonamit	1,29	428	B	
2.048	1-(2-bromophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,41	437	B	
2.035	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-phenyl-etansulfonamit	1,34	373	B	
2.030	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-(3-flophenyl)metansulfonamit	1,3	377	B	
2.029	1-(2,4-diclophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,54	427	B	
2.049	1-(3-bromophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,43	437	B	
2.022	1-(4-bromophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,44	437	B	
2.034	metyl 3-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metylsulfamoyl]propanoat	1,01	355	B	
2.021	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-phenyl-metansulfonamit	1,27	359	B	
2.019	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]butan-1-sulfonamit	1,22	325	B	
3.027	1-(4-xyclopropylphenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-	1,7	413	B	

	3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit				
2.027	1-(4-xylopropylphenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]metansulfonamit	1,6	399	B	
3.051	(E)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-phenyl-etensulfonamit	0,94	385	A	165-168
3.053	(E)-2-(4-clophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	1,00	419	A	153-154
3.056	(E)-2-(2-flophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,95	403	A	139-173
2.051	(E)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-phenyl-etensulfonamit	0,88	371	A	134-137
3.060	(E)-N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]prop-1-en-1-sulfonamit	0,83	323	A	95-99
3.020	4,4,4-triflo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]butan-1-sulfonamit	0,90	393	A	
3.061	5-metyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-2-sulfonamit	0,95	379	A	151-154
2.059	(E)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-(p-tolyl)etensulfonamit	0,93	385	A	151-153
2.062	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]propan-1-sulfonamit	0,8	311	A	
3.063	1-metyl-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]imidazol-4-sulfonamit	0,73	363	A	168-171
2.063	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-1-metyl-imidazol-4-sulfonamit	0,63	349	A	165-167
2.064	2,5-điclo-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-3-sulfonamit	0,94	421	A	198-201

2.018	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]xyclopropansulfonamit	0,75	309	A	104-106
3.059	(E)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-(p-tolyl)etensulfonamit	0,97	399	A	172-174
3.052	(E)-2-(4-bromophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	1,01	465	A	150-152
3.066	(E)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]but-2-en-1-sulfonamit	0,88	337	A	
2.060	(E)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]prop-1-en-1-sulfonamit	0,78	309	A	
3.062	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]propan-1-sulfonamit	0,85	325	A	
2.067	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-3,3,3-triflo-propan-1-sulfonamit	0,86	365	A	
3.067	3,3,3-triflo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]propan-1-sulfonamit	0,91	379	A	132-135
2.068	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-3-sulfonamit	0,85	351	A	128-131
3.068	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-3-sulfonamit	0,88	365	A	150-154
2.052	(E)-2-(4-bromophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,96	451	A	119-124
2.069	(E)-2-(3-clophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,93	405	A	149-151
2.020	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]-4,4,4-triflo-butan-1-sulfonamit	0,85	379	A	
2.070	(E)-2-(3-bromophenyl)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,97	451	A	144-147
3.069	(E)-2-(3-clophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,98	419	A	129-133

3.070	(E)-2-(3-brómophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	1,00	465	A	148-153
3.060	(E)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]prop-1-en-1-sulfonamit	0,84	323	A	95-99
3.020	4,4,4-triflo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]butan-1-sulfonamit	0,91	393	A	
3.056	(E)-2-(2-flophenyl)-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]etensulfonamit	0,95	403	A	169-173
2.051	(E)-N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]-2-phenyl-etensulfonamit	0,87	371	A	134-137
2.061	N-[(1-etyl-2-oxo-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]-5-metyl-thiophen-2-sulfonamit	0,87	365	A	149-152
3.064	2,5-ďiclo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-3-sulfonamit	1,00	433	A	131-134
3.071	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]prop-2-en-1-sulfonamit	0,80	323	A	
16.001	N-[(1-etyl-4,8-ďimetyl-2-oxo-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,93	373	A	
9.001	N-[[2-oxo-1-(3-pyridyl)-3,4-ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,78	394	A	
8.001	N-[(2-oxo-1-phenyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,91	393	A	
8.006	2,4-ďiflo-N-[(2-oxo-1-phenyl-3,4-ďihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,94	429	A	
7.009	4-flo-N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit	0,86	376	A	
7.001	2,4-ďiflo-N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit	0,85	357	A	
7.006	2,4-ďiflo-N-[(2-oxo-1-propyl-6-quinolyl)metyl]benzensulfonamit	0,88	393	A	

13.006	2,4-ďiflo-N-[[1-(2-metoxyetyl)-2-oxo-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,86	411	A	
13.001	N-[[1-(2-metoxyetyl)-2-oxo-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,83	375	A	
5.006	N-[(1-aly1-2-oxo-3,4-ďihydroquinolin-6- yl)metyl]-2,4-ďiflo-benzensulfonamit	0,9	393	A	
5.001	N-[(1-aly1-2-oxo-3,4-ďihydroquinolin-6- yl)metyl]benzensulfonamit	0,88	357	A	
11.006	2,4-ďiflo-N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,94	435	A	
11.001	N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,92	399	A	
10.006	N-[[1-(xyclopropylmetyl)-2-oxo-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]-2,4-ďiflo- benzensulfonamit	0,94	407	A	
10.001	N-[[1-(xyclopropylmetyl)-2-oxo-3,4- ďihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,92	371	A	
22.001	N-[(1-etyl-8-flo-4-metyl-2-oxo-3,4- ďihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,91	377	A	
3.073	5-clo-N-[(2-oxo-1-propyl-3,4- ďihydroquinolin-6-yl)metyl]thiophen-2- sulfonamit	0,97	399	A	144 - 147
3.072	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6- yl)metyl]thiophen-2-sulfonamit	0,88	365	A	151 - 153
17.001	N-[(8-flo-2-oxo-1-propyl-3,4- ďihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,93	377	A	
3.074	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6- yl)metyl]naphtalen-1-sulfonamit	0,96	409	A	176 - 179
3.075	N-[(2-oxo-1-propyl-3,4-ďihydroquinolin-6- yl)metyl]naphtalen-2-sulfonamit	0,96	409	A	169 - 173
14.006	2,4-ďiflo-N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4- ďihydroquinolin-6-yl)etyl]benzensulfonamit	0,95	409	A	

14.009	4-flo-N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)etyl]benzensulfonamit	0,94	391	A	
14.001	N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)etyl]benzensulfonamit	0,93	373	A	
15.006	2,4-diflo-N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)xyclopropyl]benzensulfonamit	0,96	421	A	
15.009	4-flo-N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)xyclopropyl]benzensulfonamit	0,95	403	A	
15.001	N-[1-(2-oxo-1-propyl-3,4-dihydroquinolin-6-yl)xyclopropyl]benzensulfonamit	0,93	385	A	
20.006	N-[(1-etyl-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-2,4-diflo-benzensulfonamit	0,95	395	A	
20.001	N-[(1-etyl-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,87	359	A	
23.001	N-[[4-metyl-2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,95	413	A	
23.006	2,4-diflo-N-[[4-metyl-2-oxo-1-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,97	449	A	
24.001	N-[[1-(xyclopropylmetyl)-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]benzensulfonamit	0,96	385	A	
24.006	N-[[1-(xyclopropylmetyl)-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl]metyl]-2,4-diflo-benzensulfonamit	0,98	421	A	
25.001	N-[(1-aly-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,92	371	A	
25.006	N-[(1-aly-4-metyl-2-oxo-3,4-dihydroquinolin-6-yl)metyl]-2,4-diflo-benzensulfonamit	0,92	407	A	
26.001	N-[(7-flo-2-oxo-1-propyl-3,4-	0,93	377	A	

	đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit				
27.001	N-[(5-flo-2-oxo-1-propyl-3,4-đihydroquinolin-6-yl)metyl]benzensulfonamit	0,92	377	A	

Phương pháp - A:

Phổ được ghi trên hồi phổ kế của hãng Waters (Khối phổ kế tứ cực đơn SQD hoặc ZQ) được trang bị nguồn phun điện tử (Độ phân cực: ion dương hoặc âm, Mao dẫn: 3,00 kV, Khoảng giá trị nón: 30-60V, Bộ chiết: 2,00V, Nhiệt độ nguồn: 150°C, Nhiệt độ khử solvat hóa: 350°C, Dòng khí hình nón: 0 l/giờ, Lưu lượng khí khử solvat hóa: 650 l/giờ, Khoảng khối lượng: từ 100 đến 900Da) và Acquity UPLC của hãng Waters: Bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Bộ tiết lưu dung môi, bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Cột: Waters UPLC HSS T3, 1,8µm, 30 x 2,1mm, Nhiệt độ: 60 °C, Khoảng bước sóng DAD (nm): từ 210 đến 500, Gradient dung môi: A = nước + MeOH 5% + HCOOH 0,05 %, B= Axetonitril + HCOOH 0,05 %: gradient: gradient: 0 phút 0% B, 100%A; 1,2-1,5 phút 100% B; Lưu lượng (ml/phút) 0,85

Phương pháp - B:

Phổ được ghi trên Khối phổ kế của hãng Waters SQD 2 được trang bị nguồn phun điện tử (Độ phân cực: ion dương, Mao dẫn: 3,5kV, Khoảng giá trị nón: 30V, Bộ chiết: 3,00V, Nhiệt độ nguồn: 150°C, Nhiệt độ khử solvat hóa: 400°C, Dòng khí hình nón: 60 l/giờ, Lưu lượng khí khử solvat hóa: 700 l/giờ, Khoảng khối lượng: từ 140 đến 800Da) và Acquity UPLC của hãng Waters: Bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Bộ tiết lưu dung môi, bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Cột: Waters UPLC HSS T3, 1,8 micromet, 30 x 2,1mm, Nhiệt độ: 60°C, Khoảng bước sóng DAD (nm): từ 210 đến 400, Gradient dung môi: A = nước + MeOH 5% + HCOOH 0,1%, B= Axetonitril + HCOOH 0,1%; gradient: 0 phút 100% A; 2,5 phút 100% B ; 2,8 phút 100% B; 3,0 phút 100% A; Lưu lượng (ml/phút) 0,75.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ sinh học

A) Việc sử dụng nước giảm đi ở cây đậu tương

Thử nghiệm ảnh hưởng của các hợp chất đến việc làm giảm sử dụng nước ở cây như sau. Hòa tan mỗi hợp chất trong hợp phần chất cô nhũ hóa được (EC) trồng, sau đó pha loãng đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa chất hoạt động bề mặt bổ sung (EXTRAVON 1g/20 lít). Các hợp chất này được dùng bằng cách phun vào lá cây đậu tương 12 ngày tuổi (giống S20-G7) được sinh trưởng trong buồng sinh trưởng cây trong môi trường được kiểm soát. Đánh giá việc sử dụng nước ở cây trong ngày bằng cách cân nhiều lần các chậu trong đó cây được sinh trưởng trước và sau khi dùng hợp chất tại các thời điểm đã nêu (được biểu thị bằng ngày sau khi dùng (DAA)). Sử dụng số liệu về việc sử dụng nước trước khi dùng để hiệu chỉnh sự khác biệt bất kỳ về việc sử dụng nước xảy ra do các tác động không phải do việc xử lý (ví dụ do sự khác biệt về kích thước cây). Giá trị sử dụng nước chưa được biến đổi được cho qua phân tích hiệp phương sai, hiệu chỉnh tác dụng của việc xử lý và sử dụng việc sử dụng nước đường cơ sở 1 ngày trước khi dùng làm đồng tham số.

Các kết quả được biểu thị so với xử lý đối chứng âm (hợp phần EC pha loãng không có hoạt chất nhưng có EXTRAVON 1g/20 lít).

Việc dùng hóa chất (0 DAA) diễn ra khoảng từ 08:00 đến 09:30 sáng. WU được đo trong ngày (sự chiếu sáng buồng sinh trưởng là từ 06:00 đến 20:00) ở các thời điểm này: 0 DAA sáng (10:30-12:50), 0 DAA chiều (14:00-19:50), 1 DAA sáng (7:30-12:50), 1 DAA chiều (14:00-19:50), 2 DAA sáng (07:30-12:50) và 2 DAA chiều (14:00-19:50). Tính WU tổng lũy tích (0-2,5 DAA) bằng cách tính tổng số liệu WU nêu trên.

Bảng B1: Sự tăng hoặc giảm theo tỉ lệ phần trăm của việc sử dụng nước (WU) trong ngày của các cây đậu tương được phun hợp chất đã nêu ở nồng độ 500 μ M so với xử lý đối chứng âm (ví dụ 0 = giống với đối chứng âm; -8,5 = sự giảm sử dụng nước - 8,5% so với xử lý đối chứng âm).

Giá trị WU trung bình của 6 chậu (mỗi chậu 3 cây) cho mỗi xử lý được trình bày.

	%WU						
Hợp chất	0 DAA AM	0DAA PM	1DAA AM	1DAA PM	2 DAA AM	2 DAA PM	Tổng cộng từ 0 đến 2,5 DAA
Đối chứng không	0	0	0	0	0	0	0

được xử lý							
3.005	-37,5	-32,9	-24,9	-21,9	-12,9	-12,0	-21,9
2.010	-15,2	-5,7	-2,6	-1,7	-3,6	-2,4	-4,3
3.016	-3,6	-5,8	-1,3	-0,5	-1,1	0	-1,2
3.012	-43,9	-17,8	-1,8	2,1	1,7	3,0	-5,8
2.001	-35,3	-34,3	-29,1	-28,1	-19,6	-14,3	-25,7
3.001	-15,0	-13,1	-9,9	-6,7	-7,2	-5,8	-8,8
3.007	-16,1	-14,1	-12,7	-9,7	-7,7	-7,6	-10,8
3.006	-36,5	-35,8	-28,3	-24,2	-17,8	-14,9	-24,5
3.009	-17,5	-14,9	-9,4	-6,4	-5,5	-4,2	-8,5
3.011	-3,6	-4,0	-3,6	-2,3	-3,6	-2,4	-3,0
3.010	-28	-12,5	-3,0	-1,0	-2,1	-1,7	-5,7
2.007	-14,1	-9,5	-7,3	-6,6	-8,8	-5,7	-8,1
2.009	-5,3	-3,0	-2,0	-1,2	-3,1	-1,0	-2,3
2.006	-23,4	-17,6	-13,8	-13,0	-10,4	-7,3	-13,2
2.014	-2,8	-0,7	-0,2	-0,9	-0,9	-1,7	-1,1
3.002	-22,5	-20,6	-13,7	-9,4	-6,7	-4,7	-11,4
2.002	-10,4	-8,5	-6,5	-4,0	-5,6	-4,2	-5,8
2.068	-27,0	-22,4	-18,1	-14,7	-11,6	-7,5	-15,3
3.068	-46,0	-46,5	-39,3	-31,6	-22,3	-15,3	-31,6
3.060	-7,9	-4,6	-5,8	-2,6	-5,4	-2,7	-4,6
3.063	-9,3	-4,7	-5,1	-3,9	-6,6	-5,0	-5,5
3.064	-34,7	-29,8	-23,3	-21,3	-17,2	-13,5	-22,2
2.061	-50,4	-38,6	-7,9	-2,2	-0,5	-1,2	-13,7
3.061	-47,8	-22,2	+1	+3,4	+1,6	1,2	-13,7
3.020	-19,3	-12,3	-10,1	-5,5	-7,4	-4,2	-8,5
3.067	-28,4	-24,3	-19,3	-17,2	-13,3	-9,5	-17,2
3.074	-8,6	-3	0	+1	-1,5	0	-1,4
3.075	-10,8	-5,8	-2,1	-0,6	-2,1	-2	-3,3
15.001	-27,4	-24,2	-14,9	-13,9	-9,5	-7,2	-15,1

15.006	-32,6	-32,2	-23,6	-24,4	-17	-17,8	-23,8
17.001	-41,6	-43,1	-38	-36,3	-27,1	-26,3	-34,7
20.001	-50,1	-54	-58,5	-55,2	-55,8	-50,5	-54,4
3.072	-39,4	-42,4	-45,9	-40,9	-39,8	-32,2	-40,1
3.073	-44,6	-47,9	-54,9	-52,1	-53,3	-48,7	-51
22.001	-46,1	-48,5	-55,8	-53	-55,1	-50,1	-52,1
5.001	-15,1	-19,2	-18,7	-17,4	-16,5	-15,6	-17,1
5.006	-13,6	-13,6	-12,5	-11,5	-9,7	-9,9	-11,4
7.001	-17,1	-14,1	-9,1	-6,9	-6,9	-2,5	-8,8
7.006	-14,6	-12,2	-6,7	-4,2	-4,2	0	-6,1
7.009	-8,1	-7,4	-3,6	-3,5	-4	-1,7	-4,1
10.001	-25,2	-27,8	-23,8	-22,7	-14,9	-14,7	-20,8
10.006	-22,4	-20,3	-18,5	-18,2	-16,9	-17,8	-18,6
11.001	-20,8	-24,4	-26,2	-27,6	-26,9	-26,9	-26,1
11.006	-13	-14,7	-15,3	-15,7	-16,4	-16,5	-15,8
13.001	-15,1	-14,3	-11	-11	-8,9	-9,2	-11,1
13.006	-9,8	-10,2	-9,3	-10,1	-9,6	-10,3	-10,1
16.001	-39	-44,8	-49	-48,1	-45,7	-44,5	-46
24.001	-35,3	-40,3	-42,8	-42,8	-39,9	-38,3	-40,6
23.001	-31,3	-36,9	-39,7	-40,8	-35,9	-37,3	-37,7
25.001	-28,2	-37,2	-41	-39,6	-38,1	-36,7	-37,9

Các kết quả cho thấy rằng các cây đậu tương được xử lý bằng hợp chất theo sáng chế sử dụng ít nước hơn so với cây không được xử lý.

Bảng B2: Sự tăng hoặc giảm theo tỉ lệ phần trăm của việc sử dụng nước (WU) trong ngày của cây đậu tương được phun hợp chất đã nêu ở tỷ lệ đã nêu so với xử lý đối chứng âm (ví dụ 0 = giống với đối chứng âm; -8,5 = sự giảm sử dụng nước -8,5% so với xử lý đối chứng âm).

Giá trị WU trung bình của 6 chậu (mỗi chậu 3 cây) cho mỗi xử lý được trình bày.

		%WU						
Hợp chất	Tỷ lệ	0 DAA AM*	0DAA PM	1DAA AM	1DAA PM	2 DAA AM	2 DAA PM	Tổng cộng từ 0 đến 2,5 DAA
Quinabactin	31,25uM	-0,3	-0,3	0,2	-0,1	-0,9	-1,3	-0,7
2.001		-0,7	-1,4	-1,8	-0,9	-2,7	-1,5	-1,7
3.001		-4,4	-7,7	-6,9	-5,4	-5,8	-2,2	-5,7
Quinabactin	125uM	-15,3	-5,7	1,8	2,9	2,4	1,1	-0,5
2.001		-10,4	-11,5	-10,1	-10,9	-11,7	-10,1	-11,1
3.001		-23,7	-23,7	-15,7	-15,3	-9,3	-6,3	-14,8
Quinabactin	500uM	-42,0	-41,2	-18,6	-10,8	-3,8	-2,9	-16,9
2.001		-41,2	-43,4	-36,3	-33,2	-24,2	-19,5	-31,8
3.001		-44,6	-45,5	-36,4	-33,3	-21,4	-15,1	-31,1

Các kết quả cho thấy rằng các cây trồng được xử lý bằng hợp chất theo sáng chế sử dụng ít nước hơn so với các cây trồng được xử lý bằng hợp chất đối chứng quinabactin.

B) Việc sử dụng nước giảm đi ở cây ngô

Thử nghiệm ảnh hưởng của các hợp chất đến việc làm giảm sử dụng nước ở cây như sau. Các hợp chất được dùng bằng cách phun vào lá cây ngô 12 ngày tuổi (giống NK OCTET) được sinh trưởng trong buồng sinh trưởng cây trong môi trường được kiểm soát. Tất cả các hợp chất đều được dùng bằng cách sử dụng hợp phần chất cô nhũ hóa được (EC) đã được pha loãng đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa methyl este hạt cây cải dầu bổ trợ 0,4%. Đánh giá việc sử dụng nước ở cây trong ngày bằng cách cân nhiều lần các chậu trong đó cây được sinh trưởng trước và sau khi dùng hợp chất tại các thời điểm đã nêu (được biểu thị bằng ngày sau khi dùng (DAA)). Sử dụng số liệu về việc sử dụng nước trước khi dùng để hiệu chỉnh sự khác biệt bất kỳ về việc sử dụng nước xảy ra do các tác động không phải do việc xử lý (ví dụ do sự khác biệt về kích thước cây). Giá trị sử dụng nước chưa được biến đổi được cho qua phân tích hiệp phương sai, hiệu chỉnh tác dụng của việc xử lý và sử dụng việc sử dụng nước đường cơ sở 1 ngày trước khi dùng làm đồng tham số.

Việc dùng hóa chất (0 DAA) diễn ra khoảng từ 08:00 đến 09:30 sáng. WU được đo trong ngày (sự chiếu sáng buổi sinh trưởng là từ 06:00 đến 20:00) ở các thời điểm này: 0 DAA sáng (10:30-12:50), 0 DAA chiều (14:00-19:50), 1 DAA sáng (7:30-12:50), 1 DAA chiều (14:00-19:50), 2 DAA sáng (07:30-12:50) và 2 DAA chiều (14:00-19:50). Tính WU tổng lũy tích (0-2,5 DAA) bằng cách tính tổng số liệu WU nêu trên.

Bảng B3: Sự tăng hoặc giảm theo tỉ lệ phần trăm của việc sử dụng nước (WU) trong ngày của các cây ngô được phun hợp chất đã nêu ở nồng độ 500 μ M so với xử lý đối chứng âm (ví dụ 0 = giống với đối chứng âm; -8,5 = sự giảm sử dụng nước -8,5% so với xử lý đối chứng âm).

Giá trị WU trung bình của 6 chậu (mỗi chậu 3 cây) cho mỗi xử lý được trình bày.

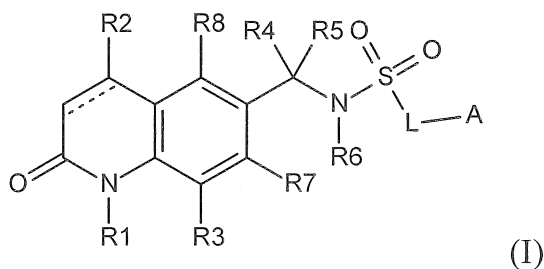
	%WU						
Hợp chất	0 DAA AM	0DAA PM	1DAA AM	1DAA PM	2 DAA AM	2 DAA PM	Tổng cộng từ 0 đến 2,5 DAA
Đối chứng không được xử lý	0	0	0	0	0	0	0
2.002	-10,8	-3,6	-3,2	-3,9	-1,2	-1,7	-3,2
2.006	-12,5	-6,7	-6,5	-5,5	-3,0	-3,2	-5,4
2.015	-8,9	-3,4	-4,0	-2,6	-1,9	-1,0	-2,9
2.051	-13,2	-8,5	-10,7	-8,6	-8,7	-6,5	-9,1
2.068	-16,6	-15,1	-12,9	-11,4	-9,2	-9,1	-11,8
2.069	-6,5	-3,5	-3,3	-3,7	-2,1	-1,9	-3,2
2.070	-8,1	-4,1	-6,1	-5,5	-4,8	-3,8	-5,0
3.002	-16,3	-12,2	-13,4	-10,5	-9,5	-7,0	-10,9
3.004	-17,3	-12,5	-14,1	-12,9	-11,8	-10,7	-12,8
3.005	-16,2	-10,5	-9,2	-7,9	-5,4	-5,3	-8,2
3.006	-18,0	-14,1	-12,6	-10,2	-6,6	-5,7	-10,3
3.007	-16,0	-12,0	-11,4	-9,5	-6,6	-5,9	-9,4
3.009	-16,9	-13,9	-13,2	-11,9	-9,0	-8,2	-11,6
3.010	-14,4	-8,3	-6,3	-5,4	-2,5	-2,2	-5,5

3.017	-5,8	-3,1	-3,1	-2,5	-1,8	-2,1	-2,7
3.020	-19,2	-13,7	-14,8	-12,1	-11,5	-8,5	-12,7
3.051	-11,2	-6,4	-8,1	-5,5	-5,4	-4,3	-6,2
3.052	-9,6	-4,6	-4,5	-4,5	-2,2	-2,5	-4,1
3.053	-8,0	-3,7	-4,1	-3,6	-2,9	-2,4	-3,6
3.056	-8,4	-2,7	-5,6	-4,4	-4,7	-3,2	-4,6
3.060	-14,8	-10,0	-10,6	-8,4	-8,2	-6,4	-9,3
3.062	-17,8	-13,0	-13,0	-9,8	-8,1	-6,3	-10,5
3.063	-8,4	-3,1	-3,0	-1,0	-1,5	+2	-1,4
3.064	-12,6	-14,2	-11,6	-9,9	-5,6	-4,7	-9,3
2.061	-18,8	-10,8	-7,5	-2,8	-1,6	-0,8	-6,2
3.061	-20,8	-19,1	-9,5	-7,5	-2,8	-3,9	-9
3.066	-10,8	-7,1	-7,1	-6,8	-4,7	-5,5	-6,4
3.067	-14,7	-10,7	-12,1	-11,5	-9,9	-10,1	-11,1
3.068	-25,5	-24,9	-15,8	-13,1	-8,9	-9,4	-14,8
3.069	-8,1	-4,1	-6,1	-5,5	-4,8	-3,8	-5,0
3.071	-11,2	-6,5	-4,5	-4,7	-3,5	-2,4	-4,9
3.075	-9,8	-7,9	-8,2	-6,4	-4,9	-3,3	-6,3
15.001	-8,2	-6,5	-6,5	-3,5	-2,8	-1,8	-4,3
15.006	-10,2	-3	-1,4	0,1	1,7	1,1	-1,2
15.009	-10,7	-7,8	-8,7	-5,8	-5,4	-5,7	-7,1
20.001	-21,7	-18,3	-19,2	-10,3	-8,1	-5,5	-12,9
20.006	-15,5	-14,5	-13,2	-7	-5,7	-4,3	-9,4

Các kết quả cho thấy rằng các cây ngô được xử lý bằng hợp chất theo sáng chế sử dụng ít nước hơn so với cây không được xử lý.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I)



trong đó:

R1 được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₇ alkyl, C₁-C₇ haloalkyl, C₃-C₅ xycloalkyl-C₁-C₇ alkyl, C₃-C₇ alkenyl, C₃-C₇ alkynyl, aryl-C₁-C₇ alkyl, (heteroxyclyl có 3-6 cạnh)-C₁-C₇ alkyl, phenyl, C₃-C₅ xycloalkyl và heteroxyclyl có 4-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Rx;

R2 được chọn từ nhóm gồm có hydro, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R3, R7 và R8 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy và C₃-C₄ xycloalkyl;

R4 và R5 độc lập được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

hoặc R4 và R5, cùng với nguyên tử hoặc các nguyên tử mà chúng được gắn trực tiếp với, có thể tạo thành C₃-C₄ xycloalkyl hoặc C₄ heteroxyclyl;

R6 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₄ alkenyl, C₃-C₄ alkynyl, và C₁-C₃ alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

L được chọn từ nhóm gồm có liên kết, mạch -C₁-C₄- alkyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkenyl thẳng, mạch -C₂-C₄- alkynyl thẳng, mạch -C₁-C₄- alkoxy thẳng qua đó nguyên tử oxy được gắn với A, mạch -amino-C₁-C₄-alkyl- thẳng qua đó nguyên tử nitơ được gắn với A, và mạch C₁-C₂alkyl-oxy-C₁-C₂alkyl thẳng, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl hoặc C₁-C₄ alkoxy;

A là hydro, C₁-C₇ alkyl, C₃-C₅ xycloalkyl, heteroxyclyl hoặc aryl có 3-10 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba Ry;

R_x, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylcacbonyl, C₁-C₄ alkoxycacbonyl, axit cacboxylic, aminocacbonyl, C₁-C₄ aminocacbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl;

R_y, độc lập với nhau, được chọn từ nhóm gồm có halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkyloxy, C₁-C₄ alkylsulfanyl, C₁-C₄ haloalkylsulfanyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylcacbonyl, C₁-C₄ alkoxycacbonyl, axit cacboxylic, aminocacbonyl, C₁-C₄ aminocacbonyl và C₃-C₄ xycloalkyl, xycloalkyl này không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R_z;

R_z độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄-alkyl và C₁-C₄-haloalkyl;

trong đó A không phải là butyl khi R₄ hoặc R₅ là metyl;

và trong đó R₁ không phải là metyl khi mỗi R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ và R₈ là hydro; hoặc muối hoặc N-oxit của nó.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R₁ được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₆ alkenyl và C₃-C₅ xyclopropyl-C₁-C₆-alkyl.

3. Hợp chất theo điểm 2, trong đó R₁ là etyl hoặc propyl.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó L là liên kết.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó A được chọn từ nhóm gồm có C₁-C₇ alkyl, phenyl và heteroaryl có 3-6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng từ một đến ba R_y.

6. Hợp chất theo điểm 5, trong đó A là phenyl tùy ý được thế bằng từ một đến ba phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkyl và C₁-C₄ haloalkoxy.

7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R₂ được chọn từ nhóm gồm có hydro và C₁-C₄ alkyl.

8. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R₃ được chọn từ nhóm gồm có hydro, halogen và C₁-C₄ alkyl.

9. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R2, R3, R4, R5, R6, R7 và R8 là hydro.
10. Hợp phần có chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, và chất bổ trợ tạo chế phẩm chấp nhận được dùng trong nông nghiệp.
11. Hỗn hợp có chứa hợp chất như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm 1-9, và thành phần hoạt tính khác.
12. Phương pháp cải thiện độ dung chịu của thực vật đối với căng thẳng phi sinh học, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 9, hợp phần theo điểm 10, hoặc hỗn hợp theo điểm 11 cho thực vật, phần của thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, hoặc vị trí sinh trưởng của thực vật.
13. Phương pháp ức chế sự nảy mầm hạt của thực vật, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 9, hợp phần theo điểm 10, hoặc hỗn hợp theo điểm 11 cho thực vật, phần của thực vật, vật liệu nhân giống thực vật hoặc vị trí sinh trưởng của thực vật.
14. Phương pháp điều hòa hoặc cải thiện sự sinh trưởng của thực vật, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 9, hợp phần theo điểm 10, hoặc hỗn hợp theo điểm 11 cho thực vật, phần của thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, hoặc vị trí sinh trưởng của thực vật.