



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

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

(11)



1-0047984

(51)⁸ C07D 237/16; C07D 513/04; A01N 43/76; A01N 43/78; A01N 43/90; A01P 13/00; C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 403/12; C07D 403/14; C07D 405/14; C07D 409/14; C07D 413/12; C07D 417/12; C07D 471/04; C07D 487/04; A01N 43/58; A01N 43/60 (13) B

(21) 1-2018-04315

(22) 29/03/2017

(86) PCT/JP2017/013043 29/03/2017

(87) WO 2017/170759 05/10/2017

(30) 2016-067797 30/03/2016 JP

(45) 25/06/2025 447

(43) 25/01/2019 370A

(73) ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (JP)

3-15, Edobori 1-chome, Nishi-ku, Osaka-shi, Osaka 5500002, Japan

(72) UEKI Toshihiko (JP); YAMADA Ryu (JP); TANAKA Hisaki (JP).

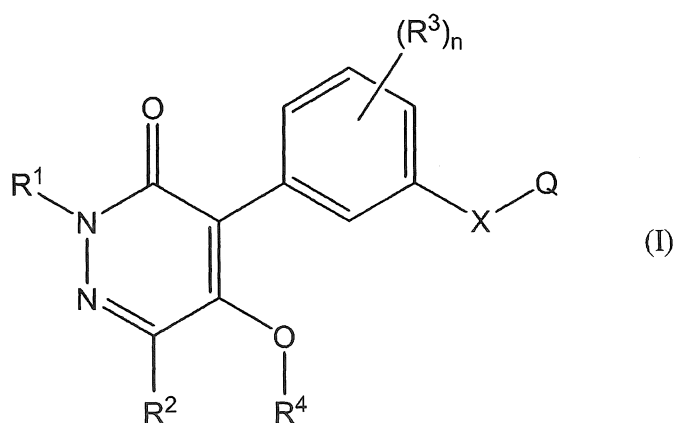
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT PYRIDAZINON HOẶC MUỐI CỦA NÓ, VÀ THUỐC DIỆT CỎ CHỨA NÓ

(21) 1-2018-04315

(57) Sáng chế đề cập đến thuốc diệt cỏ có hoạt tính diệt cỏ nổi trội đối với các thực vật không mong muốn.

Sáng chế còn đề cập đến hợp chất pyridazinon được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của nó:



trong đó X là -O-, -S-, -SO-, -SO₂- hoặc -N(Y)-; Q là aryl một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z hoặc các nhóm tương tự; Y là nguyên tử hydro hoặc alkyl; Z là halogen, alkyl hoặc các nhóm tương tự; R¹ là alkyl, alkenyl hoặc các nhóm tương tự; R² là nguyên tử hydro, alkyl hoặc các nhóm tương tự; R³ là halogen, hydroxy hoặc các nhóm tương tự; R⁴ là nguyên tử hydro, alkyl hoặc các nhóm tương tự; và n là số nguyên từ 0 đến 4.

LĨNH VỰC KỸ THUẬT ĐƯỢC ĐỀ CẬP

Sáng chế đề cập đến hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó. Cụ thể hơn, sáng chế đề cập đến hợp chất pyridazinon mới hoặc muối của nó hữu ích làm hoạt chất của thuốc diệt cỏ, và thuốc diệt cỏ chứa nó.

TÌNH TRẠNG KỸ THUẬT CỦA SÁNG CHẾ

Tài liệu sáng chế 1 bộc lộ hợp chất pyridazinon có cấu trúc hóa học đặc trưng. Hợp chất này có nhóm -O-A ở vị trí số 4 của vòng benzen được thể trên vòng pyridazinon, và có cấu trúc hóa học khác với cấu trúc hóa học của hợp chất theo sáng chế này.

Tài liệu sáng chế 2 bộc lộ hợp chất dị vòng thơm có cấu trúc hóa học đặc trưng. Hợp chất này không có vòng pyridazinon làm phần tử thể ở các vị trí m (các phần tử thể R^3 và R^4 trong tài liệu sáng chế 2) của vòng phenyl được gắn vào vòng pyridin thông qua L1, và khác biệt với hợp chất theo sáng chế này.

Tài liệu sáng chế 3 bộc lộ hợp chất pyridazinon có cấu trúc hóa học đặc trưng. Hợp chất này có nhóm phenyl hoặc nhóm dị vòng thơm liên kết trực tiếp với phần tử thể G (vòng benzen) trên vòng pyridazinon và có cấu trúc hóa học khác với cấu trúc hóa học của hợp chất theo sáng chế này.

Tài liệu sáng chế 4 bộc lộ hợp chất pyridazinon có cấu trúc hóa học đặc trưng. Hợp chất này có phần tử thể (phần tử thể R^1 trong tài liệu sáng chế 4) tương ứng với phần tử thể Q trong công thức (I) theo sáng chế được mô tả dưới đây, mà là nhóm $NR^{10}R^{11}$ hoặc nhóm vòng heteroxycloalkyl, và có cấu trúc hóa học khác với cấu trúc hóa học của hợp chất theo sáng chế này.

CÁC TÀI LIỆU NÊU TRONG PHẦN TÌNH TRẠNG KỸ THUẬT CÁC TÀI LIỆU SÁNG CHẾ

Tài liệu sáng chế 1: WO2014/119770

Tài liệu sáng chế 2: WO2014/207601

Tài liệu sáng chế 3: WO2009/086041

Tài liệu sáng chế 4: WO2008/013838

BẢN CHẤT KỸ THUẬT CỦA SÁNG CHẾ

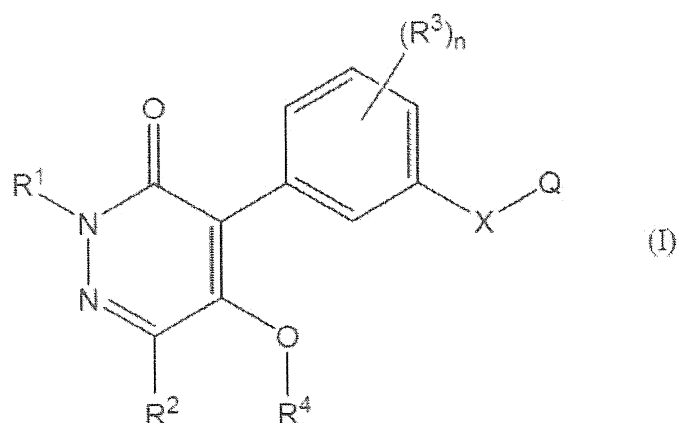
VẤN ĐỀ KỸ THUẬT

Mục đích của sáng chế là đề xuất thuốc diệt cỏ có hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời đối với cỏ dại, để tiết kiệm công sức trong hoạt động phòng trừ cỏ dại và để cải thiện năng suất của cây nông nghiệp và cây trồng trong vườn.

GIẢI PHÁP GIẢI QUYẾT VẤN ĐỀ

Các tác giả sáng chế đã tiến hành các nghiên cứu sâu rộng để đạt được mục đích nêu trên và kết quả là, đã phát hiện ra rằng hợp chất pyridazinon có cấu trúc hóa học đặc trưng có tác dụng diệt cỏ cao đối với nhiều loại cỏ dại với liều thấp, và đã tạo ra sáng chế.

Cụ thể, sáng chế đề xuất hợp chất pyridazinon được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của nó:



trong đó X là -O-, -S-, -SO-, -SO₂- hoặc -N(Y)-;

Q là aryl một vòng mà có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, aryl hai vòng có thể được thế bởi Z, hoặc heteroaryl hai vòng có thể được thế bởi Z;

Y là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

R¹ là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, haloalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkylthioalkyl, alkylsulfinylalkyl, alkylsulfonylalkyl, dialkylaminoalkyl, alkoxyalkyl, amino, nitro,

alkylcarbonylalkyl, alkoxycarbonylalkyl hoặc hydroxycarbonylalkyl;

R^2 là nguyên tử hydro, alkyl, haloalkyl, xycloalkyl, halogen, alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl hoặc xyano;

R^3 là halogen, hydroxy, alkyl, haloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, alkoxy, haloalkoxy, nitro, amino, alkylcarbonyl hoặc xycloalkyl;

R^4 là nguyên tử hydro, alkyl, $-C(O)R^6$, $-C(S)R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkoxyalkyl, $-CH(J^1)OCOOJ^2$, alkylcarbonylalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylcarbonylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkenyl, alkoxyalkoxyalkyl, alkoxycarbonylalkyl, alkynyl, xyanoalkyl, haloalkoxyalkyl hoặc dialkylaminoalkyl;

R^6 là alkyl, alkoxy, morpholino, dialkylamino, (aryl một vòng có thể được thế bởi Z)(alkyl)amino, xycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, haloalkyl, alkylthio, alkenyl, alkynyl, alkoxycarbonylalkyl, xycloalkylalkyl, xyanoalkyl, alkoxyalkoxyalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxy một vòng có thể được thế bởi Z, arylthio một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxyalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, arylthioalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkoxycarbonyl, alkoxyalkoxy, haloalkoxy, haloalkoxyalkoxy, alkylthioalkoxy, xycloalkoxyalkoxy, arylalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryloxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, alkenyloxyalkoxy, alkoxyalkoxyalkoxy, alkynyloxy, alkenyloxy, haloalkenyl, dialkylaminoalkyl, alkylthioalkoxyalkoxy, xycloalkylalkoxy, xycloalkylalkoxyalkoxy, arylalkoxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, heteroarylalkoxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z hoặc xycloalkoxy có thể được thế bởi Z;

R^7 là alkyl, haloalkyl, xycloalkyl hoặc aryl một vòng có thể được thế bởi Z;

Z là halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, xycloalkyl, xyano, nitro, $-C(O)OR^5$, formyl, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, $-CH=NOJ^3$ hoặc dialkylaminocarbonyl;

R^5 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

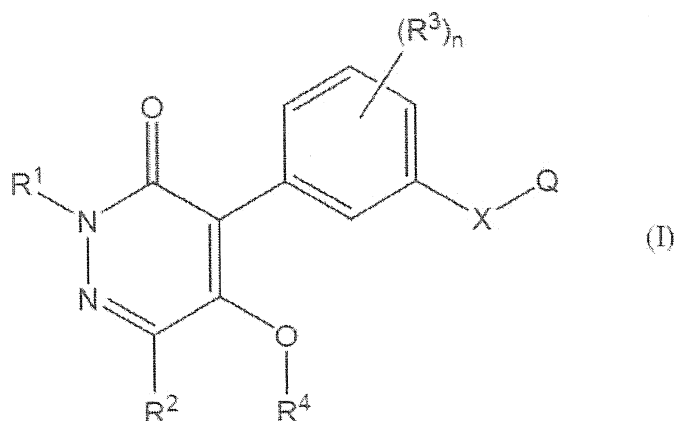
J^1 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

J^2 là alkyl hoặc xycloalkyl;

J^3 là nguyên tử hydro, alkylcarbonyl hoặc alkoxyalkyl; và

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

Tốt hơn là, sáng chế đề xuất hợp chất pyridazinon được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của nó:



trong đó X là -O-, -S-, -SO-, -SO₂- hoặc -N(Y)-;

Q là aryl một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, aryl hai vòng có thể được thế bởi Z hoặc heteroaryl hai vòng có thể được thế bởi Z;

Y là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

Z là halogen, alkyl, haloalkyl, cyano, nitro hoặc -C(O)OR⁵;

R¹ là alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc cycloalkyl;

R² là nguyên tử hydro, alkyl, haloalkyl hoặc cycloalkyl;

R³ là halogen, alkyl, haloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, alkoxy, haloalkoxy hoặc cycloalkyl;

R⁴ là nguyên tử hydro, alkyl, -C(O)R⁶ hoặc -SO₂R⁷;

R⁵ là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

R⁶ là alkyl, alkoxy hoặc morpholino;

R⁷ là alkyl; và

n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 4.

Sáng chế còn đề xuất hợp chất pyridazinon có công thức (I) hoặc muối của nó, thuốc diệt cỏ chứa nó làm hoạt chất, và phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn hoặc ức chế sự sinh trưởng của chúng, mà bao gồm việc đưa hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó với lượng có tác dụng diệt cỏ vào thực vật không mong muốn hoặc nơi mà chúng phát triển.

Hiệu quả có lợi của sáng chế

Hợp chất pyridazinon có công thức (I) hoặc muối của nó theo sáng chế thể hiện sự cải thiện rõ rệt về hoạt tính diệt cỏ đối với các thực vật không mong muốn (cỏ dại) so với các hợp chất tương tự thông thường.

MÔ TẢ CHI TIẾT CÁC PHƯƠNG ÁN THỰC HIỆN SÁNG CHẾ

Nguyên tử halogen hoặc nguyên tử halogen làm phần tử thế trong công thức (I) có thể là nguyên tử flo, clo, brom hoặc iot. Số lượng nguyên tử halogen làm phần tử thế có thể là 1 hoặc ít nhất 2, và trong trường hợp ít nhất là 2, các nguyên tử halogen tương ứng có thể giống hoặc khác nhau. Hơn nữa, các vị trí thế của các nguyên tử halogen này có thể là các vị trí bất kỳ.

Alkyl hoặc gốc alkyl trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_1 - C_{12} mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, neopentyl, n-hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl hoặc n-dodexyl.

Alkoxy hoặc gốc alkoxy trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_1 - C_{12} mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như metoxy, etoxy, propoxy, isopropoxy, butoxy, pentyloxy, hexyloxy, heptyloxy, octyloxy, nonyloxy, detyloxy, undetyloxy hoặc dodetyloxy.

Alkenyl hoặc gốc alkenyl trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_2 - C_6 mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như vinyl, 1-propenyl, 2-propenyl, isopropenyl, 2-metyl-1-propenyl, 1-metyl-1-propenyl, 2-metyl-2-propenyl, 1-metyl-2-propenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 2-metyl-2-butenyl, 3-metyl-2-butenyl, 1-hexenyl hoặc 2,3-dimetyl-2-butenyl.

Alkynyl hoặc gốc alkynyl trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_2 - C_6 mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, 3-butylnyl, 1-metyl-2-propynyl, 2-metyl-3-butylnyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl hoặc 5-hexynyl.

Xycloalkyl hoặc gốc xycloalkyl trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_3 - C_7 , như xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl hoặc xycloheptyl.

Xycloalkyloxy hoặc gốc xycloalkyloxy trong công thức (I) có thể là, ví dụ, nhóm C_3 - C_7 , như xyclopropyloxy, xyclobutyloxy, xyclopentyloxy, xyclohexyloxy hoặc xycloheptyloxy.

Aryl một vòng trong công thức (I) có thể là, ví dụ, phenyl. Hơn nữa, heteroaryl một vòng có thể là, ví dụ, heteroaryl có 3 đến 6 cạnh chứa một đến bốn nguyên tử O, S hoặc N, cụ thể là, thienyl, furyl, pyreryl, oxazolyl, isoxazolyl, isoxazolinyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,3-triazolyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,3,4-tetrazolyl, pyridyl, pyrimidyl, pyrazinyl, pyridazinyl, 1,3,5-triazinyl, 1,2,4-triazinyl, imidazolinyl, imidazolidinyl, pyrazolinyl hoặc pyrazolidinyl.

Aryl hai vòng trong công thức (I) có thể là, ví dụ, naphthyl hoặc indenyl. Hơn nữa, heteroaryl hai vòng có thể là, ví dụ, heteroaryl ngưng tụ của vòng dị vòng có 5 đến 6 cạnh chứa một hoặc hai nguyên tử O, S hoặc N, và vòng benzen, cụ thể là, benzothienyl, benzofuryl, indolyl, benzothiazolyl, benzoimidazolyl, benzoisoxazolyl, benzoisothiazolyl, indazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, quinoxalyl, phtalazinyl, cinnolyl, quinazolinyl, naphthyridinyl, pyridopyrimidyl, pyridopyrazinyl, imidazolopyridyl, thiazolopyridyl, pyrazolopyrimidyl, imidazolopyrazinyl, imidazolopyridazinyl, triazolopyridyl, pyrazinopyrazinyl, pyrazinopyridazinyl, pyrimidopyridazinyl, pyrimidopyrimidyl, pyridopyridazinyl, pyrolopyridyl, thienopyridyl, oxazolopyridyl, pyrazolopyridyl, isoxazolopyridyl, isothiazolopyridyl, pyrolopyrimidyl, thienopyrimidyl, imidazolopyrimidyl, oxazolopyrimidyl, thiazolopyrimidyl, isoxazolopyrimidyl, isothiazolopyrimidyl, pyrolopyrazinyl, thienopyrazinyl, oxazolopyrazinyl, thiazolopyrazinyl, pyrazolopyrazinyl, isoxazolopyrazinyl, isothiazolopyrazinyl, pyrolopyridazinyl, thienopyridazinyl, oxazolopyridazinyl, thiazolopyridazinyl, pyrazolopyridazinyl, isoxazolopyridazinyl, isothiazolopyridazinyl, purinyl hoặc pteridinyl.

Trong công thức (I), "có thể được thế bởi Z" có nghĩa là khi mỗi nhóm được thế bởi Z, số lượng phần tử thế Z có thể là một hoặc nhiều hơn, và trong trường hợp mà số lượng phần tử thế có thể là hai hoặc nhiều hơn, thì các phần tử thế này có thể giống hoặc khác nhau. (Các) vị trí thế của (các) phần tử thế này có thể là (các) vị trí bất kỳ.

Muối của hợp chất pyridazinon có công thức (I) bao gồm tất cả các loại muối với điều kiện chúng được chấp nhận dùng trong nông nghiệp, và, ví dụ, muối của kim loại kiềm như muối natri và muối kali; muối của kim loại kiềm thổ như muối magie và muối canxi; muối amin như muối dimetylamin và muối trietylamin; muối của axit vô cơ như hydroclorua, perchlorat, sulfat và nitrat; và muối của axit hữu cơ như axetat và

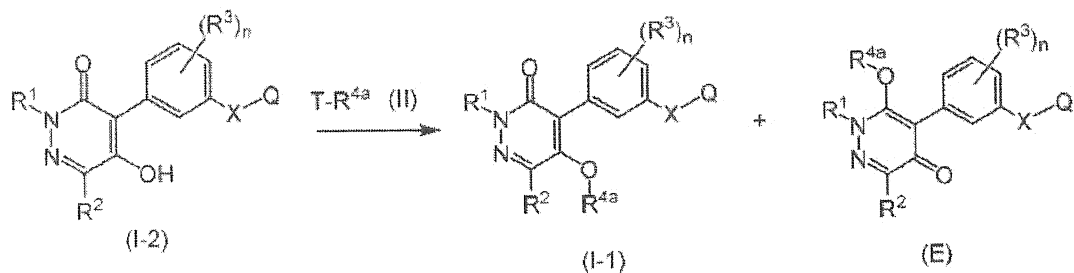
metansulfonat, có thể được đề cập đến.

Để làm hợp chất pyridazinon có công thức (I), các chất đồng phân như các chất đồng phân không đối quang và các chất đồng phân quang học đôi khi có thể có mặt, và sáng chế bao gồm các chất đồng phân tương ứng và hỗn hợp chất đồng phân. Trong bản mô tả này, các chất đồng phân được mô tả dưới dạng hỗn hợp trừ khi có quy định khác. Hơn nữa, trong sáng chế, các chất đồng phân khác nhau không phải là các chất đồng phân nêu trên được bao gồm trong phạm vi hiểu biết thông thường trong lĩnh vực kỹ thuật này. Hơn nữa, tùy thuộc vào loại chất đồng phân, nó có thể có cấu trúc hóa học khác công thức (I) nêu trên, nhưng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này, có thể nhận biết một cách đầy đủ rằng cấu trúc hóa học này có mối quan hệ về chất đồng phân với công thức (I), và chất đồng phân này rõ ràng là thuộc phạm vi của sáng chế.

Hợp chất pyridazinon có công thức (I) hoặc muối của nó (dưới đây được gọi là hợp chất theo sáng chế) có thể được sản xuất bằng quy trình sản xuất sau hoặc theo phương pháp thông thường để sản xuất muối hoặc các ví dụ điều chế được mô tả dưới đây. Tuy nhiên, phương pháp điều chế hợp chất theo sáng chế không chỉ giới hạn ở các cách này.

[Quy trình sản xuất 1]

Hợp chất có công thức (I-1) là hợp chất theo sáng chế có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (I-2) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (II) với sự có mặt của bazơ.



Trong các công thức này, T là nguyên tử clo, brom hoặc iot, R^{4a} là alkyl, $-C(O)R^6$,

$-C(S)R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkoxyalkyl, $-CH(J^1)OCOOJ^2$, alkylcarbonylalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylcarbonylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkenyl, alkoxyalkoxyalkyl,

alkoxycarbonylalkyl, alkynyl, xyanoalkyl, haloalkoxyalkyl hoặc dialkylaminoalkyl, và X, Q, R¹, R², R³, R⁶, R⁷, Z, J¹, J² và n là như được xác định trên đây.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, bazơ hữu cơ như triethylamin hoặc pyridin. Lượng bazơ thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (I-2).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trơ với phản ứng và có thể là, ví dụ, ete như diethyl ete, dioxan, tetrahydrofuran (THF) hoặc dimetoxyetan hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Lượng hợp chất có công thức (II) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 3 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (I-2).

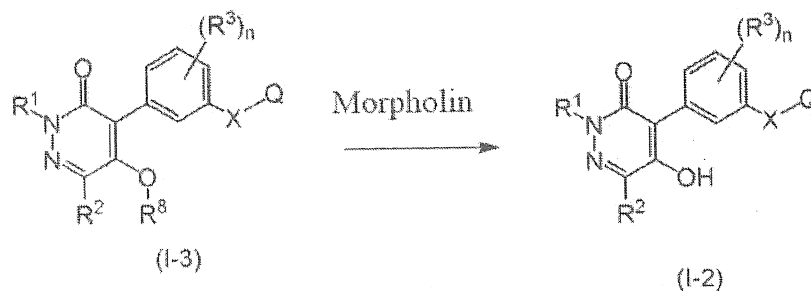
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ -30 đến 180°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ -10 đến 80°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 30 giờ.

Nhờ phản ứng này, tạo ra hỗn hợp gồm hợp chất có công thức (I-1) và chất đồng phân của nó tức là hợp chất được biểu thị bằng công thức (E). Hỗn hợp phản ứng thu được bằng phản ứng này, ví dụ, được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (I-1) có thể được tách ra.

Hợp chất có công thức (II) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết.

[Quy trình sản xuất 2]

Hợp chất có công thức (I-2) là hợp chất theo sáng chế có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (I-3) phản ứng với morpholin.



Trong các công thức này, R^8 là alkyl hoặc arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, như C_{1-3} alkyl hoặc benzyl, và X, Q, R^1 , R^2 , R^3 , Z và n là như được xác định trên đây.

Lượng morpholin được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 1 đến 20 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (I-3).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 30 đến 180°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 50 đến 130°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 30 giờ.

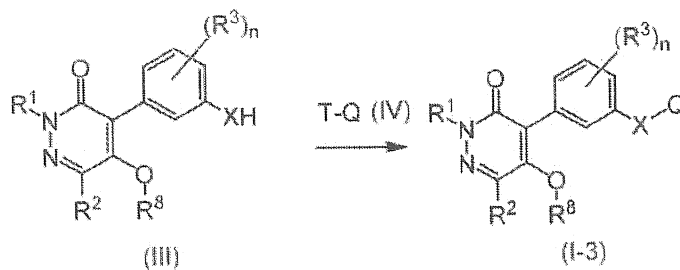
Hơn nữa, phản ứng này có thể được thực hiện dưới sự chiếu xạ bằng vi sóng, nhờ đó phản ứng này có thể được xúc tiến trong một số trường hợp.

Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trộn với nước, được axit hóa bằng axit và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (I-2) có thể được tách ra.

Hơn nữa, hợp chất có công thức (I-2) có thể được sản xuất, ví dụ, theo phương pháp được bộc lộ trong phần, ví dụ, Heterocycles, vol. 26, trang 1 đến 4 (1987) hoặc phương pháp phù hợp với việc sản xuất này.

[Quy trình sản xuất 3]

Hợp chất có công thức (I-3) là hợp chất theo sáng chế có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (III) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (IV) với sự có mặt của bazơ hoặc chất xúc tác.



Trong các công thức này, X, Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , T và n là như được xác định trên đây.

Bazo được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, alkoxit kim loại như kali tert-butoxit; hoặc bazo vô cơ như kali cacbonat, xesi cacbonat hoặc natri hydrua. Lượng bazo thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 3 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (III).

Chất xúc tác được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, chất xúc tác paladi như paladi(II) axetat, tetrakis(triphenylphosphin)paladi, tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi hoặc [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]paladi diclorua; hoặc chất xúc tác đồng như đồng clorua hoặc đồng iodua. Lượng chất xúc tác thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 0,5 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (IV).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trợ với phản ứng và có thể là, ví dụ, hydrocacbon thơm như benzen, toluen hoặc xylen; ete như dietyl ete, dioxan, THF hoặc dimetoxietan; amit như dimetylformamit (DMF); sulfoxit như dimetylsulfoxit (DMSO); nitril như axetonitril; xeton như axeton; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Lượng hợp chất có công thức (IV) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 3 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (III).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0 đến 200°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 20 đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 30 giờ.

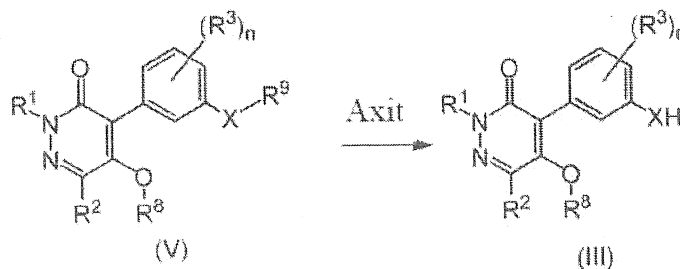
Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trung hòa bằng axit, được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách

tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (I-3) có thể được tách ra.

Hợp chất có công thức (IV) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết.

[Quy trình sản xuất 4]

Hợp chất có công thức (III) nêu trên có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (V) phản ứng với axit.



Trong các công thức này, R^9 là arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, như benzyl hoặc 4-metoxybenzyl, và X, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z và n là như được xác định trên đây.

Axit được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, axit trifloaxetic. Lượng axit thường nằm trong khoảng từ 1 đến 20 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (V).

Phản ứng này được thực hiện với sự có mặt của dung môi trong trường hợp cần thiết. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trợ với phản ứng và có thể là, ví dụ, axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit propionic; nước; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

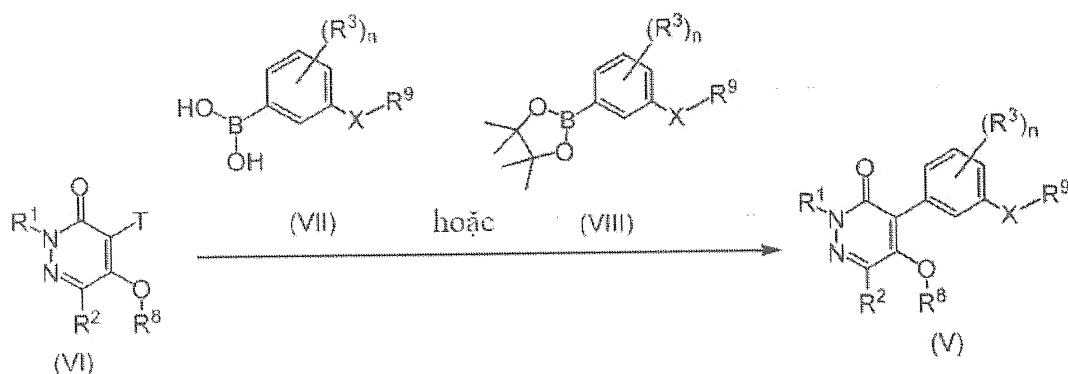
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 30 đến 180°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 50 đến 130°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 30 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (III) có thể được tách ra.

[Quy trình sản xuất 5]

Hợp chất có công thức (V) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được

biểu thị bằng công thức (VI) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (VII) hoặc (VIII) với sự có mặt của bazơ và chất xúc tác.



Trong các công thức này, X, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , R^9 , T và n là như được xác định trên đây.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, bazơ vô cơ như natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat hoặc kali phosphat. Lượng bazơ thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (VI).

Chất xúc tác được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, chất xúc tác paladi như paladi(II) axetat, tetrakis(triphenylphosphin)paladi, tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi hoặc [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]paladi diclorua. Lượng chất xúc tác thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 0,5 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (VI). Hơn nữa, để làm chất xúc tác, chất xúc tác chuyển pha có thể được sử dụng. Chất xúc tác chuyển pha được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, muối amoni alkyl bậc bốn như tetrabutylamoni bromua hoặc tetrabutylamoni clorua. Lượng chất xúc tác chuyển pha thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 1,0 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,7 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (VI).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trợ với phản ứng và có thể là, ví dụ, hydrocacbon thơm như benzen hoặc toluen; rượu như metanol, etanol hoặc propanol; ete như dietyl ete, dioxan, THF hoặc dimetoxietan; xeton như axeton hoặc metyl etyl xeton; amit như DMF; sulfoxit như DMSO; nước; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Trong phản ứng này, trong trường hợp cần thiết, phối tử có thể được sử dụng. Phối tử có thể là, ví dụ, 2-dicyclohexylphosphino-2',6'-dimetoxybiphenyl. Lượng phối tử thường nằm trong khoảng từ 0.002 đến 1 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,02 đến 0,4 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (VI).

Lượng hợp chất có công thức (VII) hoặc (VIII) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0.5 đến 2 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 1,5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (VI).

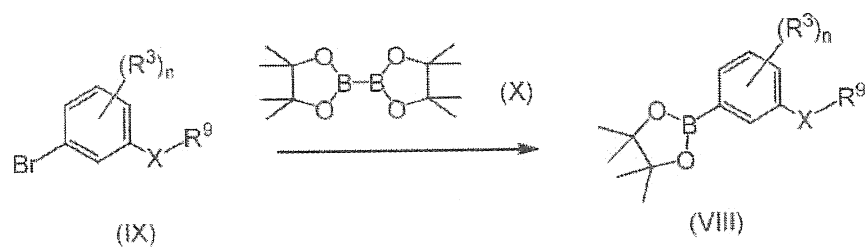
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0 đến 180°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 30 đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 100 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (V) có thể được tách ra.

Hợp chất có công thức (VII) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết.

Hợp chất có công thức (VI) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết. Ví dụ, hợp chất có công thức (VI) có thể được sản xuất theo phương pháp được bộc lộ trong Journal of Heterocyclic Chemistry, vol. 33, trang 1579 đến 1582 (1996) hoặc phương pháp phù hợp với việc sản xuất này. [Quy trình sản xuất 6]

Hợp chất có công thức (VIII) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (IX) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (X) với sự có mặt của bazơ và chất xúc tác.



Trong các công thức này, X, R³, R⁹ và n là như được xác định trên đây.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, bazơ vô cơ như natri

cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat, kali phosphat hoặc kali axetat. Lượng bazơ thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (IX).

Chất xúc tác được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, chất xúc tác paladi như paladi(II) axetat, tetrakis(triphenylphosphin)paladi hoặc tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi. Lượng chất xúc tác thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 0,5 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (IX).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trơ với phản ứng và có thể là, ví dụ, hydrocacbon thơm như benzen hoặc toluen; rượu như metanol, etanol hoặc propanol; ete như diethyl ete, dioxan, THF hoặc dimetoxyetan; xeton như axeton hoặc metyl etyl xeton; amit như DMF; sulfoxit như DMSO; nước; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Trong phản ứng này, trong trường hợp cần thiết, phối tử có thể được sử dụng. Phối tử có thể là, ví dụ, trixyclohexylphosphin hoặc 2-dixyclohexylphosphino-2',6'-dimetoxybiphenyl. Lượng phối tử thường nằm trong khoảng từ 0,002 đến 1 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,02 đến 0,4 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (IX).

Lượng hợp chất có công thức (X) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 2 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 1,5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (IX).

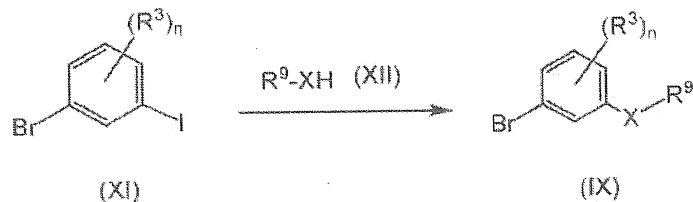
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0 đến 180°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 30 đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 100 giờ.

Hơn nữa, phản ứng này có thể được thực hiện dưới sự chiếu xạ bằng vi sóng, nhờ đó phản ứng này có thể được xúc tiến trong một số trường hợp.

Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (VIII) có thể được tách ra.

[Quy trình sản xuất 7]

Hợp chất có công thức (IX) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (XI) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (XII) với sự có mặt của bazơ và chất xúc tác.



Trong các công thức này, X, R³, R⁹ và n là như được xác định trên đây.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, bazơ vô cơ như natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat, xesi cacbonat hoặc kali phosphat; hoặc bazơ hữu cơ như triethylamin hoặc diisopropyletylamin. Lượng bazơ thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XI).

Chất xúc tác được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, chất xúc tác paladi như paladi(II) axetat, tetrakis(triphenylphosphin)paladi hoặc tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi. Lượng chất xúc tác thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 0,5 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 0,2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XI).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trợ với phản ứng và có thể là, ví dụ, hydrocarbon thơm như benzen hoặc toluen; rượu như metanol, etanol hoặc propanol; ete như dietyl ete, dioxan, THF hoặc dimetoxietan; xeton như axeton hoặc metyl etyl xeton; amit như DMF; sulfoxit như DMSO; nước; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Trong phản ứng này, trong trường hợp cần thiết, phối tử có thể được sử dụng. Phối tử có thể là, ví dụ, trixyclohexylphosphin, 2-dixyclohexylphosphino-2',6'-dimetoxybiphenyl hoặc 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimetylxanten. Lượng phối tử thường nằm trong khoảng từ 0,002 đến 1 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,02 đến 0,4 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XI).

Lượng hợp chất có công thức (XII) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 2 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 1,5 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XI).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0 đến 180°C,

tốt hơn là nằm trong khoảng từ 30 đến 150°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 100 giờ.

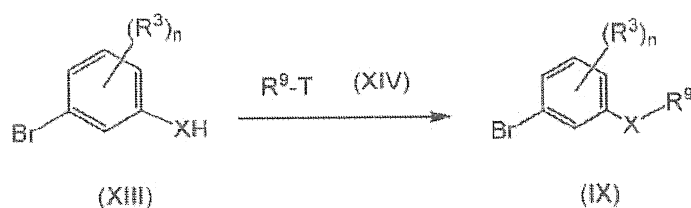
Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (IX) có thể được tách ra.

Hợp chất có công thức (XI) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết.

Hợp chất có công thức (XII) là hợp chất đã biết.

[Quy trình sản xuất 8]

Hợp chất có công thức (IX) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được biểu thị bằng công thức (XIII) phản ứng với hợp chất được biểu thị bằng công thức (XIV) với sự có mặt của bazơ.



Trong các công thức này, X, R³, R⁹, T và n là như được xác định trên đây.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, alkoxit kim loại như kali tert-butoxit; hoặc bazơ vô cơ như kali cacbonat, xesi cacbonat hoặc natri hydrua. Lượng bazơ thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 3 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XIII).

Phản ứng này thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi. Dung môi không bị giới hạn đặc biệt miễn là nó trơ với phản ứng và có thể là, ví dụ, hydrocacbon thơm như benzen, toluen hoặc xylen; ete như dietyl ete, dioxan, THF hoặc dimetoxietan; amit như DMF; sulfoxit như DMSO; nitril như axetonitril; xeton như axeton; hoặc hỗn hợp dung môi của chúng.

Lượng hợp chất có công thức (XIV) được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 3 đương lượng mol, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 2 đương lượng mol so với hợp chất có công thức (XIII).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 0 đến 200°C,

tốt hơn là nằm trong khoảng từ 20 đến 100°C. Thời gian phản ứng của phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 10 phút đến 30 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng này, ví dụ, hỗn hợp phản ứng này được trung hòa bằng axit, được trộn với nước và được chiết bằng dung môi hữu cơ, và lớp hữu cơ thu được được làm khô, được cô, được tinh chế bằng cách sắc ký cột silicagel, và các cách tương tự, nhờ đó hợp chất có công thức (IX) có thể được tách ra.

Hợp chất có công thức (XIII) là hợp chất đã biết hoặc có thể được sản xuất bằng phương pháp đã biết từ hợp chất đã biết.

Các quy trình sản xuất các hợp chất trung gian dùng để sản xuất các hợp chất theo sáng chế không chỉ giới hạn ở các quy trình sản xuất được nêu làm ví dụ trên đây, và quy trình sản xuất bất kỳ có thể được dùng. Hơn nữa, các nguyên liệu ban đầu khác nhau cũng không chỉ giới hạn ở các hợp chất được nêu làm ví dụ trên đây, và các hợp chất bất kỳ có thể được sử dụng với điều kiện chúng là các hợp chất có khả năng tạo ra hợp chất theo sáng chế.

Các hợp chất theo sáng chế có khả năng phòng trừ cỏ dại không mong muốn ở phạm vi rộng như cỏ dại hằng năm và cỏ dại lâu năm, cụ thể là, cỏ dại gây hại khác nhau, ví dụ, họ Hòa thảo như cỏ lông vọc nước (*Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* Vasing.), cỏ tíc nhỏ (*Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne* Henr., *Digitaria horizontalis* Willd.), cỏ đuôi chồn xanh (*Setaria viridis* L.), cỏ đuôi chồn lớn (*Setaria faberi* Herrm.), cỏ đuôi chồn vàng (*Setaria lutescens* Hubb.), cỏ màn trầu (*Eleusine indica* L.), yến mạch dại (*Avena fatua* L.), cỏ Johnson (*Sorghum halepense* L.), cỏ quỳ (*Agropyron repens* L.), cỏ alexander (*Brachiaria plantaginea*), cỏ Ghinê (*Panicum maximum* Jacq.), cỏ lông Para (*Panicum purpurascens*), cỏ witchgrass mềm mượt (*Panicum dichotomiflorum*), cỏ đuôi phụng (*Leptochloa chinensis*), cỏ đuôi phụng dỏ (*Leptochloa panicea*), cỏ poa một năm (*Poa annua* L.), black grass (*Alopecurus myosuroides* Huds., *Alopecurus aequalis* Sobol.), cỏ cuống xanh cholorado (*Agropyron tsukushiense* (Honda) Ohwi), cỏ tín hiệu lá rộng (*Brachiaria platyphylla* Nash), cỏ echin phương nam (*Cenchrus echinatus* L.), cỏ mạch đen của Ý (*Lolium multiflorum* Lam.), cỏ mạch đen cứng (*Lolium rigidum* Gaud.), cỏ quỳn tước (*Bromus tectorum* L.) và cỏ Bermuda (*Cynodon dactylon* Pers.); họ Cói như cỏ lác rận

(*Cyperus iria* L.), cỏ gấu (*Cyperus rotundus* L.), cỏ gấu tàu (*Cyperus esculentus* L.), cỏ nến Nhật Bản (*Scirpus juncoides*), cỏ cháo (*Cyperus serotinus*), cây cói dài hoa nhỏ (*Cyperus difformis*), cỏ năng kim (*Eleocharis acicularis*), và cây hạt dẻ nước (*Eleocharis kuroquvai*); họ Trạch tả như rau mác lá nhỏ Nhật Bản (*Sagittaria pygmaea*), rau mác (*Sagittaria trifolia*), và cây trạch tả lá hẹp (*Alisma canaliculatum*); họ Lục bình như cỏ mác (*Monochoria vaginalis*), và loài cỏ mác (*Monochoria korsakowii*); họ Lữ đàng như cây phiến lộ giá (*Lindernia pyxidaria*); họ Mã đề như cây sôm (*Dopatrium junceum*); họ Bàng lã như vảy ốc Ấn độ (*Rotala india*), và cây thân đỏ (*Ammannia multiflora*); họ Đàn thảo như đàn thảo thân dài (*Elatine triandra* SCHK.); họ Cẩm quỳ như cây cối xay Ấn độ (*Abutilon theophrasti* MEDIC), và rau mác gai (*Sida spinosa* L.); họ Cúc như cây kẻ đầu ngựa thông thường (*Xanthium strumarium* L.), cỏ phấn hương thông thường (*Ambrosia elatior* L.), cây kẻ (*Breea setosa* (BIEB.) KITAM.), cỏ thỏ có lông (*Galinsoga ciliata* Blake), cúc la mã đại (*Matricaria chamomilla* L.), cây tầm ma (*Lamium amplexicaule* L.), cây bồ công anh thấp (*Taraxacum officinale* weber), và cỏ bông (*Erigeron canadensis* L.); họ Cà như cây lụ lụ đen (*Solanum nigrum* L.), và cây cà độc dược (*Datura stramonium*); họ Dền như cây dền cơm (*Amaranthus viridis* L.), rau dền rẽ đỏ (*Amaranthus retroflexus* L.), kinh giới trắng thông thường (*Chenopodium album* L.), và cây rau chổi mê-li-cô (*Kochia scoparia* Schrad.); họ Rau răm như nghề điểm (*Polygonum lapathifolium* L.), nghề bím (*Polygonum persicaria* L.), kiều mạch đại (*Polygonum convolvulus* L.), và rau đắng (*Polygonum aviculare* L.); họ Thập tự như cây cải xoong rừng (*Cardamine flexuosa* WITH.), cây rau Tẻ Thái (*Capsella bursapastoris* Medik.), và cây mù tạc Ấn độ (*Brassica juncea* Czern.); họ Bìm bìm như cây bìm bìm cao (*Ipomoea purpurea* L.), dây bìm bìm đại (*Convolvulus arvensis* L.), và bìm bìm biếc (*Ipomoea hederacea* Jacq.); họ Rau sam như cây rau sam thông thường (*Portulaca oleracea* L.); họ Đậu như muồng lá tù (*Cassia obtusifolia* L.); họ Cẩm chướng như cây tràng sao thông thường (*Stellaria media* L.); họ Thiến thảo như cây Vắn vương (*Galium spurium* L.); họ Thầu dầu như tai tượng Úc (*Acalypha australis* L.); và họ Thái lai như cây Thái lai thông thường (*Commelina communis* L.). Do đó, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng một cách hiệu quả để phòng trừ chọn lọc cỏ dại gây hại hoặc phòng trừ không chọn lọc cỏ dại gây hại trong việc trồng trọt các cây trồng hữu ích như cây ngô (*Zea mays* L.), cây đậu tương (*Glycine max* Merr.), cây bông (*Gossypium* spp.), cây lúa mì

(*Triticum aestivum* L.), cây lúa (*Oryza sativa* L.), cây lúa mạch (*Hordeum vulgare* L.), cây lúa mạch đen (*Secale cereale* L.), cây yến mạch (*Avena sativa* L.), cây lúa miến (*Sorghum bicolor* Moench), cây cải dầu (*Brassica napus* L.), cây hướng dương (*Helianthus annuus* L.), cây củ cải đường (*Beta vulgaris* L.), cây mía (*Saccharum officinarum* L.), cỏ Nhật bản (*Zoysia japonica* Steud.), cây lạc (*Arachis hypogaea* L.), cây lanh (*Linum usitatissimum* L.), cây thuốc lá (*Nicotiana tabacum* L.), và cây cà phê (*Coffea* spp.).

Hợp chất theo sáng chế có thể được trộn với các chất phụ gia nông nghiệp khác nhau và được dùng ở dạng các chế phẩm khác nhau như bột rắc, hạt, hạt dễ phân tán trong nước, bột dễ thấm ướt, viên nén, viên tròn, viên nang (kể cả chế phẩm được bao gói bằng màng mỏng tan trong nước), huyền phù trên cơ sở nước, huyền phù trên cơ sở dầu, vi nhũ tương, hỗn nhũ tương, bột tan trong nước, chế phẩm đặc dễ nhũ hóa, chế phẩm đặc dễ hòa tan hoặc bột nhão. Có thể bào chế thành chế phẩm bất kỳ thường được sử dụng trong lĩnh vực này, với điều kiện mục đích của sáng chế đạt được nhờ đó.

Các chất phụ gia được sử dụng trong chế phẩm bao gồm, ví dụ, chất mang rắn như diatomit, vôi đã tôi, canxi cacbonat, talc, cacbon trắng, kaolin, bentonit, kaolinit, serixit, đất sét, natri cacbonat, natri bicarbonat, mirabilit, zeolit hoặc tinh bột; dung môi như nước, toluen, xylen, dung môi naphta, dioxan, axeton, isophoron, methyl isobutyl xeton, clorobenzen, cyclohexan, dimetyl sulfoxit, N,N-dimetylformamit, dimetylaxetamit, N-metyl-2-pyrrolidon hoặc rượu; chất hoạt động bề mặt anion hoặc chất phân tán như muối của axit béo, benzoat, alkylsulfosuccinat, dialkylsulfosuccinat, polycarboxylat, muối của este của axit alkylsulfuric, alkyl sulfat, alkylaryl sulfat, alkyl diglycol ete sulfat, muối của este của rượu và axit sulfuric, alkyl sulfonat, alkylaryl sulfonat, aryl sulfonat, lignin sulfonat, alkylbiphenyl ete disulfonat, polystyren sulfonat, muối của este của axit alkylphosphoric, alkylaryl phosphat, styrylaryl phosphat, muối của este của polyoxyetylen alkyl ete và axit sulfuric, polyoxyetylen alkylaryl ete sulfat, muối của este của polyoxyetylen alkylaryl ete và axit sulfuric, polyoxyetylen alkyl ete phosphat, muối của este của axit polyoxyetylen alkylaryl phosphoric, muối của este của polyoxyetylen aryl ete và axit phosphoric, naphthalen sulfonat được ngưng tụ với formaldehyt hoặc alkyl-naphthalen sulfonat được ngưng tụ với formaldehyt; chất hoạt động bề mặt không ion hóa hoặc chất phân tán

như sorbitan este của axit béo, glycerin este của axit béo, polyglyxerit của axit béo, rượu polyglycol ete của axit béo, axetylen glycol, rượu axetylen, polyme khối oxyalkylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkylaryl ete, polyoxyetylen styrylaryl ete, polyoxyetylen glycol alkyl ete, polyetylen glycol, polyoxyetylen este của axit béo, polyoxyetylen sorbitan este của axit béo, polyoxyetylen glycerin este của axit béo; và dầu thực vật hoặc dầu khoáng như dầu oliu, dầu bông gạo, dầu thầu dầu, dầu cọ, dầu hoa trà, dầu dừa, dầu vừng, dầu ngô, dầu cám gạo, dầu lạc, dầu hạt bông, dầu đậu nành, dầu hạt cải, dầu lanh, dầu trẩu hoặc parafin lỏng. Các chất phụ gia này có thể được chọn thích hợp để sử dụng riêng rẽ hoặc kết hợp dưới dạng hỗn hợp gồm hai hoặc nhiều chất, với điều kiện đạt được mục đích của sáng chế. Hơn nữa, các chất phụ gia khác nhau thường được sử dụng, như chất độn, chất làm đặc, chất chống lắng, chất chống đông, chất làm ổn định sự phân tán, chất an toàn, chất chống nấm mốc, chất tạo bột, chất gây rã và chất kết dính, có thể được sử dụng. Tỷ lệ trộn tính theo khối lượng của hợp chất theo sáng chế và các chất phụ gia khác nhau này có thể nằm trong khoảng từ 0,1:99,9 đến 95:5, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,2:99,8 đến 85:15 theo tỷ lệ khối lượng. Phương pháp trộn hợp chất theo sáng chế và các chất phụ gia khác nhau không bị giới hạn đặc biệt, và chúng có thể được trộn một cách thích hợp theo phương pháp đã biết.

Liều thuốc diệt cỏ chứa hợp chất theo sáng chế (lượng có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế) nói chung không thể được xác định, do nó thay đổi tùy thuộc vào điều kiện thời tiết, tình trạng đất, loại chế phẩm, loại thực vật không mong muốn cần được phòng trừ, mùa dùng thuốc, v.v.. Tuy nhiên, thường dùng với lượng hợp chất theo sáng chế (dưới đây còn được gọi là lượng hoạt chất) tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5.000 g, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 0,5 đến 3.000 g, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 1 đến 1.000 g, đặc biệt tốt là nằm trong khoảng từ 10 đến 500 g, trên mỗi hecta. Sáng chế bao gồm phương pháp phòng trừ các thực vật không mong muốn như vậy, bằng cách dùng thuốc diệt cỏ như vậy.

Hơn nữa, thuốc diệt cỏ chứa hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc dưới dạng hỗn hợp hoặc kết hợp với các chất nông hóa khác, phân bón, chất an toàn hoặc các chất tương tự. Khi thuốc diệt cỏ được sử dụng dưới dạng hỗn hợp hoặc kết hợp, các tác dụng hoặc chức năng tuyệt vời hơn có thể thu được trong một số

trường hợp. Các chất nông hóa khác này bao gồm, ví dụ, thuốc diệt cỏ, thuốc diệt nấm, thuốc kháng sinh, hormon thực vật và thuốc trừ sâu. Đặc biệt là, với chế phẩm diệt cỏ được trộn có hợp chất theo sáng chế được trộn với hoặc được sử dụng kết hợp với một hoặc nhiều hoạt chất của thuốc diệt cỏ khác, phạm vi của cỏ dại cần được phòng trừ, thời gian dùng chế phẩm, hoạt tính diệt cỏ, v.v. có thể được cải thiện theo hướng ưu tiên. Hợp chất theo sáng chế và các hoạt chất của các thuốc diệt cỏ khác có thể được bảo chế một cách riêng rẽ sao cho chúng có thể được trộn để sử dụng tại thời điểm dùng, hoặc chúng có thể được bảo chế cùng nhau. Sáng chế bao gồm chế phẩm diệt cỏ được trộn như vậy.

Tỷ lệ trộn của hợp chất theo sáng chế và các hoạt chất của các hợp chất diệt cỏ khác nói chung không thể được xác định, do nó thay đổi tùy thuộc vào điều kiện thời tiết, tình trạng đất, loại chế phẩm, thời gian dùng, phương pháp dùng, v.v., nhưng các thuốc diệt cỏ khác được trộn với lượng tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,001 đến 10.000 phần khối lượng, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1.000 phần khối lượng trên mỗi một loại hoạt chất, tính theo 1 phần khối lượng của hợp chất theo sáng chế. Hơn nữa, liều dùng là liều sao cho tổng lượng các hoạt chất nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10.000 g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,2 đến 5.000 g, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 10 đến 3.000 g, trên mỗi hecta. Sáng chế bao gồm phương pháp phòng trừ cỏ dại không mong muốn bằng cách dùng chế phẩm diệt cỏ được trộn như vậy.

Hoạt chất có tác dụng diệt cỏ khác bao gồm, ví dụ, các hợp chất (1) đến (12) sau (các tên thông thường bao gồm tên được dùng để phê chuẩn theo ISO). Ngay cả khi không được nêu cụ thể trong bản mô tả này, trong trường hợp mà các hợp chất này có dạng muối, alkyl este, v.v., thì tất nhiên chúng đều được bao gồm.

(1) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ làm rối loạn hoạt tính hormon của thực vật, như hợp chất phenoxy như 2,4-D, 2,4-D-butotyl, 2,4-D-butyl, 2,4-D-dimethylamoni, 2,4-D-diolamin, 2,4-D-etyl, 2,4-D-2-ethylhexyl, 2,4-D-isobutyl, 2,4-D-isooctyl, 2,4-D-isopropyl, 2,4-D-isopropylamoni, 2,4-D-natri, 2,4-D-isopropanolamoni, 2,4-D-trolamin, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, 2,4-DB-dimethylamoni, 2,4-DB-isooctyl, 2,4-DB-kali, 2,4-DB-natri, muối 2,4-D cholin, dichlorprop, dichlorprop-butotyl, dichlorprop-dimethylamoni, dichlorprop-isooctyl, dichlorprop-kali, dichlorprop-P, dichlorprop-P-dimethylamoni, dichlorprop-P-kali, dichlorprop-P-natri, MCPA,

MCPA-butotyl, MCPA-dimetylamoni, MCPA-2-etylhexyl, MCPA-kali, MCPA-natri, MCPA-thioetyl, MCPB, MCPB-etyl, MCPB-natri, mecoprop, mecoprop-butotyl, mecoprop-natri, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, mecoprop-P-dimetylamoni, mecoprop-P-2-etylhexyl, mecoprop-P-kali, naproanilit, clomeprop, hoặc HIA-1; hợp chất axit carboxylic thơm như 2,3,6-TBA, dicamba, dicamba-butotyl, dicamba-diglycolamin, dicamba-dimetylamoni, dicamba-diolamin, dicamba-isopropylamoni, dicamba-kali, dicamba-natri, picloram, picloram-dimetylamoni, picloram-isotetyl, picloram-kali, picloram-triisopropanolamoni, picloram-triisopropylamoni, picloram-trolamin, triclopyr, triclopyr-butotyl, triclopyr-trietylamoni, clopyralid, clopyralid-olamin, clopyralid-kali, clopyralid-triisopropanolamoni, aminopyralid, aminoxyclopyrachlor, halauxifen, halauxifen-metyl, hoặc DAS-534; và naptalam, naptalam-natri, benazolin, benazolin-etyl, quinclorac, quimmerac, diflufenzopyr, diflufenzopyr-natri, fluroxypyr, fluroxypyr-2-butoxy-1-metyletyl, fluroxypyr-meptyl, chlorflurenol, chlorflurenol-metyl, hoặc clacyfos.

(2) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự quang hợp của thực vật, như hợp chất ure như chlorotoluron, diuron, fluometuron, linuron, isoproturon, metobenzuron, tebuthiuron, dimefuron, isouron, karbutilate, methabenzthiazuron, metoxuron, metoburomuron, monolinuron, neburon, siduron, terbumeton hoặc trietazine; hợp chất triazin như simazine, atrazin, atratone, simetryn, prometryn, dimethametryn, hexazinon, metribuzin, terbuthylazine, cyanazine, ametryn, cybutryne, terbutryn, propazine, metamitron, hoặc prometon; hợp chất uraxil như bromacil, bromacil-lithi, lenacil hoặc terbacil; hợp chất anilit như propanil hoặc cypromid; hợp chất carbamat như swep, desmedipham hoặc phenmedipham; hợp chất hydroxybenzonitril như bromoxynil, bromoxynil-octanoat, bromoxynil-heptanoat, ioxynil, ioxynil-octanoat, ioxynil-kali hoặc ioxynil-natri; và pyridat, bentazone, bentazone-natri, amicarbazone, methazole, pentanochlor hoặc phenmedipham.

(3) Hợp chất muối amoni bậc bốn như paraquat hoặc diquat, được cho là tự chuyển hóa thành các gốc tự do để tạo ra oxy hoạt tính trong cơ thể thực vật và thể hiện hiệu quả diệt cỏ nhanh.

(4) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự sinh tổng hợp chất diệp lục của thực vật và tích lũy bất thường chất peroxit bất sáng trong cơ thể thực vật, như hợp chất diphenylete như nitrofen, chlormethoxyfen, bifenox.

acifluorfen, acifluorfen-natri, fomesafen, fomesafen-natri, oxyfluorfen, lactofen, aclonifen, ethoxyfen-etyl, fluoroglycofen-etyl hoặc fluoroglycofen; hợp chất vòng imit như chlorphthalim, flumioxazin, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, cinidon-etyl, fluthiacet-metyl, hoặc EK-5385; và oxadiargyl, oxadiazon, sulfentrazone, carfentrazone-etyl, thidiazimin, pentoxazone, azafenidin, isopropazole, pyraflufen-etyl, benzfendizone, butafenacil, saflufenacil, fluazolate, profluazol, flufenpyr-etyl, bencarbazone, tiafenacil, pyrachlonil, trifludimoxazin, HNPC-B4047, IR-6396, EK-5439, EK-5498, SYN-523, hoặc hợp chất được bộc lộ trong WO2008/008763 (FMC CORPORATION).

(5) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ được đặc trưng bởi việc làm mất hoạt tính nhờ ức chế sự tạo sắc tố của thực vật như các carotenoit, như hợp chất pyridazinon như norflurazon, chloridazon hoặc metflurazon; hợp chất pyrazol như pyrazolynate, pyrazoxyfen, benzofenap, topramezone, pyrasulfotole hoặc tolpyralate; và amitrole, fluridone, flurtamone, diflufenican, methoxyphenone, clomazone, sulcotrione, mesotrione, tembotrione, tefuryltrione, fenquinotrione, cyclopyrimorate, isoxaflutole, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfat, isoxachlortole, benzobicyclon, bicyclopiron, picolinafen, beflubutamid, ketospiradox, ketospiradox-kali, hoặc hợp chất được bộc lộ trong JP2012-2571 (Sumitomo Chemical).

(6) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ bằng cách ức chế sự sinh tổng hợp lipid của thực vật, như hợp chất axit aryloxyphenoxypropionic như diclofop-metyl, diclofop, pyriphenop-natri, fluazifop-butyl, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-P-butyl, haloxyfop-metyl, haloxyfop, haloxyfop-etotyl, haloxyfop-P, haloxyfop-P-metyl, quizalofop-etyl, quizalofop-P, quizalofop-P-etyl, quizalofop-P-tefuryl, cyhalofop-butyl, fenoxaprop-etyl, fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-etyl, metamifop-propyl, metamifop, clodinafop-propargyl, clodinafop, propaquizafop, HNPC-A8169 hoặc SYP-1924; hợp chất xyclohexandion như alloxydim-natri, alloxydim, clethodim, sethoxydim, tralkoxydim, butroxydim, tepraloxym, profoxydim hoặc cycloxydim, và hợp chất phenylpyrazolin như pinoxaden.

(7) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự sinh tổng hợp axit amin của thực vật, như hợp chất sulfonylure như chlorimuron-etyl, chlorimuron, sulfometuron-metyl, sulfometuron, primisulfuron-metyl, primisulfuron, bensulfuron-metyl, bensulfuron, chlorsulfuron, metsulfuron-metyl, metsulfuron, cinosulfuron.

pyrazosulfuron-etyl, pyrazosulfuron, flazasulfuron, rimsulfuron, nicosulfuron, imazosulfuron, flucetosulfuron, cyclosulfamuron, prosulfuron, flupyr-sulfuron-metyl-natri, flupyr-sulfuron, triflusulfuron-metyl, triflusulfuron, halosulfuron-metyl, halosulfuron, thifensulfuron-metyl, thifensulfuron, ethoxysulfuron, oxasulfuron, etflametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, sulfosulfuron, triasulfuron, tribenuron-metyl, tribenuron, tritosulfuron, foramsulfuron, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-natri, mesosulfuron-metyl, mesosulfuron, orthosulfamuron, amidosulfuron, azimsulfuron, propyrisulfuron, metazosulfuron, methiopyrsulfuron, monosulfuron-metyl, orsosulfuron, iofensulfuron hoặc iofensulfuron-natri; hợp chất triazolopyrimidinsulfonamid như flumetsulam, metosulam, diclosulam, cloransulam-metyl, florasulam, penoxsulam hoặc pyroxsulam; hợp chất imidazolinon như imazapyr, imazapyr-isopropylamoni, imazethapyr, imazethapyr-amoni, imazaquin, imazaquin-amoni, imazamox, imazamox-amoni, imazamethabenz, imazamethabenz-metyl hoặc imazapic; hợp chất axit pyrimidinylsalixylic như pyrithiobac-natri, bispyribac-natri, pyriminobac-metyl, pyribenzoxim, pyriftalid, pyrimisulfan, hoặc triafamone; hợp chất sulfonylaminocarbonyl-triazolinon như flucarbazone, flucarbazone-natri, propoxycarbazone-natri, propoxycarbazone, hoặc thiencarbazone-metyl; và glyphosat, glyphosat-natri, glyphosat-kali, glyphosat-amoni, glyphosat-diamoni, glyphosat-isopropylamoni, glyphosat-trimesi, glyphosat-sesquínatri, glufosinat, glufosinat-amoni, glufosinat-P, glufosinat-P-amoni, glufosinat-P-natri, bilanafos, bilanafos-natri hoặc cinnethylin.

(8) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự nguyên phân của tế bào của thực vật, như hợp chất dinitroanilin như trifluralin, oryzalin, nitralin, pendimethalin, ethalfluralin, benfluralin, prodiamine, butralin hoặc dinitramin; hợp chất amit như bensulide, napropamide, napropamide-M, propyzamide hoặc pronamide; hợp chất phospho hữu cơ như amiprofos-metyl, butamifos, anilofos hoặc piperophos; hợp chất phenyl carbamat như propham, chlorpropham, barban hoặc carbetamide; hợp chất cumylamin như daimuron, cumylfuron, bromobutide hoặc methyl-dymron; và asulam, asulam-natri, dithiopyr, thiazopyr, chlorthal-dimetyl, chlorthal, diphenamid, flamprop-M-metyl, flamprop-M, hoặc flamprop-M-isopropyl.

(9) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự sinh tổng hợp

protein hoặc sự sinh tổng hợp lipid của thực vật, như hợp chất cloaxetamid nhưalachlor, metazachlor, butachlor, pretilachlor, metolachlor, S-metolachlor, thenylchlor, pethoxamid, acetochlor, propachlor, dimethenamide, dimethenamide-P, propisochlor hoặc dimethachlor; hợp chất thiocarbamat như molinate, dimepiperat, pyributicarb, EPTC, butylat, vernolate, pebulate, cycloate, prosulfocarb, esprocarb, thiobencarb, diallate, tri-alat hoặc orbencarb; và etobenzanid, mefenacet, flufenacet, tridiphane, cafenstrole, fentrazamide, oxaziclomefone, indanofan, benfuresate, pyroxasulfone, fenoxasulfon, methiozolin, dalapon, dalapon-natri, TCA-natri hoặc axit tricloaxetic.

(10) Các hợp chất được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ức chế sự sinh tổng hợp xenluloza của thực vật, như dichlobenil, triaziflam, indaziflam, flupoxam, hoặc isoxaben.

(11) MSMA, DSMA, CMA, endothall, endothall-dikali, endothall-natri, endothall-mono(N,N-dimetylalkylamoni), etofumesat, natri clorat, axit pelargonic, axit nonanoic, fosamine, fosamine-amoni, ipfencarbazone, acloleim, amoni sulfamat, borac, axit cloaxetic, natri cloaxetat, xyanamid, axit metylarsonic, axit dimetylarsinic, natri dimetylarsinat, dinoterb, dinoterb-amoni, dinoterb-diolamin, dinoterb-axetat, DNOC, sắt sulfat, flupropanate, flupropanate-natri, mefluidide, mefluidide-diolamin, metam, metam-amoni, metam-kali, metam-natri, metyl isothioxyanat, pentaclophenol, natri pentaclophenoxit, pentaclophenol laurat, quinoclamine, axit sunfuric, ure sulfat, xanthinosin, herbimycin, unguinol, metatyrosine, sarmentine, thaxtomin A, mevalocidin, alpha-limonen, pyribambenz-propyl, pyribambenz-isopropyl, JS-913, KHG-23844, H-9201, SIOC-0163, SIOC-0171, SIOC-0172, SIOC-0285, SIOC-0426, SIOC-H-057, ZJ-0166, ZJ-1835, ZJ-0453, ZJ-0777, ZJ-0862, hợp chất được bộc lộ trong WO2008/096398 (Kumiai Chemical).

(12) Các loài được cho là có tác dụng diệt cỏ nhờ ký sinh trên thực vật, như Xanthomonas campestris, Epicoccossirus nematosorus, Epicoccossirus nematosperus, Exserohilum monoseras, hoặc Drechsrela monoceras.

Một hoặc nhiều hợp chất có thể được chọn một cách thích hợp trong số các hợp chất trên đây là các hoạt chất của thuốc diệt cỏ khác. Các hoạt chất của thuốc diệt cỏ khác không chỉ giới hạn ở các hợp chất được nêu làm ví dụ trên đây.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Dưới đây, sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn dựa vào các ví dụ, nhưng cần phải hiểu rằng phạm vi của sáng chế không bị giới hạn ở các ví dụ này theo cách bất kỳ. Trước hết, các ví dụ điều chế các hợp chất theo sáng chế sẽ được mô tả.

VÍ DỤ ĐIỀU CHẾ 1

Điều chế 4-(5-((3-clo-5-(triflometyl)pyridin-2-yl)thio)-2-metylphenyl)-5-metoxý-2,6-dimetylpyridazin-3(2H)-on (hợp chất số 1-32 được nêu dưới đây)

(1) Trong môi trường khí nitơ, diisopropyletylamin (1,2 ml) được bổ sung vào dung dịch hỗn hợp chứa 2-bromo-4-iodo-1-metylbenzen (1,0 g), (4-metoxýphenyl)metanthiol (520 mg), tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi (80 mg), 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimetylanten (100 mg) và 1,4-dioxan (10 ml), tiếp theo cho phản ứng trong điều kiện hồi lưu trong 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được để nguội, được trộn với nước và được chiết hai lần bằng etyl axetat (30 ml). Lớp hữu cơ thu được được rửa bằng nước muối và được làm khô bằng natri sulfat khan, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp, và cặn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký cột (heptan:etyl axetat = 20:1, tỷ lệ thể tích, điều kiện tương tự được áp dụng dưới đây) để thu được (3-bromo-4-metylphenyl) (4-metoxýbenzyl)sulfan (1,07 g, hiệu suất: 98%) dưới dạng dầu màu nâu. Dữ liệu phổ NMR của sản phẩm này như sau.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,35(3H, s), 3,79(3H, s), 4,04(2H, s), 6,83(2H, d, $J = 8,7$ Hz), 7,08-7,21(4H, m), 7,48(1H, d, $J = 0,6$ Hz)

(2) Trong môi trường khí nitơ, dung dịch hỗn hợp chứa (3-bromo-4-metylphenyl) (4-metoxýbenzyl)sulfan (1,07 g), bis(pinacolato)diboron (1,26 g), tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi (120 mg), trixyclohexylphosphin (150 mg), kali axetat (490 mg) và 1,4-dioxan (15 ml) được cho phản ứng ở nhiệt độ 120°C trong 7 giờ. Hỗn hợp phản ứng này được để nguội, chất rắn không tan được lấy ra bằng Xelit, và chất rắn này được rửa bằng etyl axetat. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp, và cặn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký cột (heptan:etyl axetat = 20:1) để thu được 2-(5-((4-metoxýbenzyl)thio)-2-metylphenyl)-4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan (1,07 g, hiệu suất: 87%) dưới dạng chất rắn màu trắng. Dữ liệu phổ NMR của sản phẩm đã được tinh chế này như sau.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,38(12H, s), 2,48(3H, s), 3,77(3H, s).

4,03(2H, s), 6,80(2H, d, $J = 8,4$ Hz), 7,04(1H, d, $J = 8,1$ Hz), 7,17-7,27(3H, m), 7,76(1H, dd, $J = 1,5$ Hz, $J = 6,6$ Hz)

(3) Dung dịch hỗn hợp chứa 2-(5-((4-metoxymethyl)thio)-2-methylphenyl)-4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan (381 mg), 4-bromo-5-metoxymethyl-2,6-dimethylpyridazin-3(2H)-on (200 mg), tetrakis(triphenylphosphin)paladi (40 mg), natri cacbonat (200 mg), tetrabutylamoni bromua (144 mg), 1,4-dioxan (6 ml) và nước (4 ml) được cho phản ứng ở nhiệt độ 120°C trong 45 phút. Hỗn hợp phản ứng được để nguội, được trộn với nước và được chiết hai lần bằng ethyl axetat (20 ml). Lớp hữu cơ thu được được rửa bằng nước muối và được làm khô bằng natri sulfat khan, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp, và cặn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký cột (heptan:ethyl axetat = 1:1) để thu được 5-metoxymethyl-4-(5-((4-metoxymethyl)thio)-2-methylphenyl)-2,6-dimethylpyridazin-3(2H)-on (275 mg, hiệu suất: 81%) dưới dạng chất rắn màu trắng. Dữ liệu phổ NMR của sản phẩm đã được tinh chế này như sau.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,16(3H, s), 2,27(3H, s), 3,24(3H, s), 3,68(3H, s), 3,77(3H, s), 4,03(2H, s), 6,79(2H, d, $J = 8,7$ Hz), 7,15-7,26(5H, m)

(4) 5-metoxymethyl-4-(5-((4-metoxymethyl)thio)-2-methylphenyl)-2,6-dimethylpyridazin-3(2H)-on (275 mg) được hòa tan trong axit trifloaxetic (2 ml) và được cho phản ứng ở nhiệt độ 60°C trong 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng này được để nguội, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp để thu được 4-(5-mercapto-2-methylphenyl)-5-metoxymethyl-2,6-dimethylpyridazin-3(2H)-on (190 mg, hiệu suất: 99%) dưới dạng chất rắn màu nâu.

(5) Dung dịch hỗn hợp chứa 4-(5-mercapto-2-methylphenyl)-5-metoxymethyl-2,6-dimethylpyridazin-3(2H)-on (190 mg) thu được ở bước (4) nêu trên, 2,3-dicloro-5-(triflometyl)pyridin (223 mg), xesi cacbonat (336 mg) và dimethylformamit (5 ml) được cho phản ứng ở nhiệt độ 60°C trong 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng được để nguội, được trộn với nước và được chiết hai lần bằng ethyl axetat (20 ml). Lớp hữu cơ thu được được rửa bằng nước muối và được làm khô bằng natri sulfat khan, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp, và cặn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký cột (heptan:ethyl axetat = 3:2) để thu được sản phẩm mong muốn (122 mg, hiệu suất: 39%) dưới dạng chất rắn màu trắng. Dữ liệu phổ NMR của sản phẩm đã được tinh chế này như sau.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,24(3H, s), 2,30(3H, s), 3,53(3H, s), 3,73(3H, s), 7,36-7,38(2H, m), 7,48(1H, dd, $J = 2,1$ Hz, $J = 8,4$ Hz), 7,76(1H, dd, $J = 0,6$ Hz, $J = 2,1$ Hz), 8,33(1H, dd, $J = 0,9$ Hz, $J = 1,8$ Hz)

VÍ DỤ ĐIỀU CHẾ 2

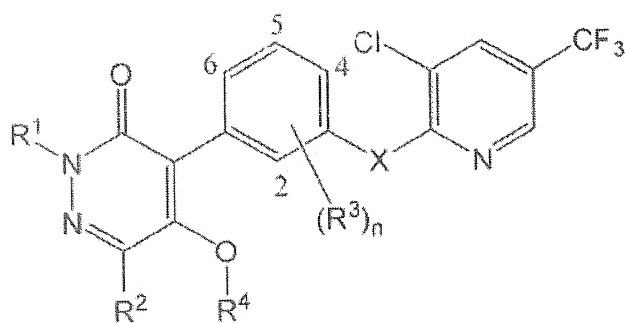
Điều chế 4-(5-((3-clo-5-(triflometyl)pyridin-2-yl)thio)-2-metylphenyl)-5-hydroxy-2,6-dimetylpyridazin-3(2H)-on (hợp chất số 1-2 được nêu dưới đây)

4-(5-((3-clo-5-(triflometyl)pyridin-2-yl)thio)-2-metylphenyl)-5-metoxi-2,6-dimetylpyridazin-3(2H)-on (122 mg) được hòa tan trong morpholin (2 ml), được đẩy kín trong ống và được cho phản ứng dưới sự chiếu xạ bằng vi sóng ở nhiệt độ 140°C trong 50 phút. Sau khi hoàn thành phản ứng, morpholin dư được chưng cất, cặn được axit hóa bằng axit axetic, và lớp nước được chiết hai lần bằng etyl axetat (10 ml). Lớp hữu cơ thu được được làm khô bằng natri sulfat, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp, và cặn thu được được tinh chế bằng cách sắc ký cột (heptan:etyl axetat = 1:1) để thu được sản phẩm mong muốn (51 mg, hiệu suất: 43%) dưới dạng chất rắn màu trắng. Sản phẩm này có điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 99 đến 102°C , và dữ liệu phổ NMR của nó như sau.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,24(3H, s), 2,30(3H, s), 3,73(3H, s), 7,36-7,48 (3H, m), 7,79(1H, d, $J = 1,8$ Hz), 8,32(1H, dd, $J = 0,9$ Hz, $J = 1,8$ Hz)

Các ví dụ điển hình của các hợp chất theo sáng chế được thể hiện trong các bảng 1 đến 3. Các hợp chất này có thể được điều chế theo các ví dụ điều chế hoặc các quy trình sản xuất trên đây. Trong các bảng 1 đến 3, lần lượt No. là hợp chất số, Me là nhóm metyl, Et là nhóm etyl, Pr là nhóm n-propyl, i-Pr là nhóm isopropyl, n-Bu là nhóm n-butyl, t-Bu là nhóm tert-butyl, c-Pr là nhóm xyclopropyl, c-Hex là nhóm xyclohexyl, Ph là nhóm phenyl, và Bn là nhóm benzyl. Ngoài ra, "2,6-(Me)₂" trong các bảng có nghĩa là các nhóm metyl dưới dạng phần tử thế là lần lượt ở các vị trí 2 và 6, và định nghĩa của các nhóm tương tự được áp dụng dưới đây.

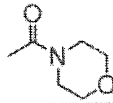
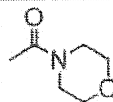
Các trị số được mô tả trong cột "các đặc tính vật lý" trong các bảng 1 đến 3 là các điểm nóng chảy ($^\circ\text{C}$), và của các hợp chất có NMR trong cột "các đặc tính vật lý", dữ liệu phổ ^1H -NMR được thể hiện trong bảng 4.



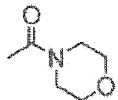
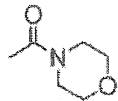
Bảng 1

No.	R ¹	R ²	R ³	R ¹	X	Các đặc tính vật lý
1-1	Me	Me	6-Me	H	O	102-105
1-2	Me	Me	6-Me	H	S	99-102
1-3	Me	Me	6-Et	H	O	94-96
1-4	Me	Me	6-Et	H	S	109-111
1-5	Me	Me	6-Pr	H	O	
1-6	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	O	
1-7	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	O	
1-8	Me	Me	6-CF ₃	H	O	
1-9	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	
1-10	Me	Me	6-OMe	H	O	133
1-11	Me	Me	6-Cl	H	O	
1-12	Me	Me	2-Me	H	O	190
1-13	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	O	90
1-14	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	O	94
1-15	Me	Me	4-Me	H	O	
1-16	Me	Me	6-Pr	H	S	
1-17	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	S	
1-18	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	S	
1-19	Me	Me	6-CF ₃	H	S	
1-20	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	S	
1-21	Me	Me	6-OMe	H	S	
1-22	Me	Me	6-Cl	H	S	
1-23	Me	Me	2-Me	H	S	
1-24	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	S	
1-25	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	S	
1-26	Me	Me	4-Me	H	S	
1-27	Me	Me	6-Me	Me	O	NMR
1-28	Me	Me	6-Et	Me	O	NMR
1-29	Me	Me	2-Me	Me	O	NMR
1-30	Me	Me	6-Pr	Me	O	
1-31	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	O	
1-32	Me	Me	6-Me	Me	S	NMR

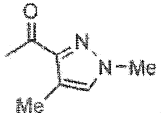
Bảng 1 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
1-33	Me	Me	6-Et	Me	S	
1-34	Me	Me	6-Pr	Me	S	
1-35	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	S	
1-36	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	Me	O	
1-37	Me	Me	6-CF ₃	Me	O	
1-38	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	Me	S	
1-39	Me	Me	6-CF ₃	Me	S	
1-40	Me	Me	6-Me	COMe	O	NMR
1-41	Me	Me	6-Me	COOEt	O	NMR
1-42	Me	Me	6-Me	COMe	S	127-130
1-43	Me	Me	6-Me	COOEt	S	
1-44	Me	Me	2-Me	COMe	O	118
1-45	Me	Me	6-Et	COMe	O	138
1-46	Me	Me	6-Et	COMe	S	174
1-47	Me	Me	6-Me	COEt	O	
1-48	Me	Me	6-Et	COEt	O	
1-49	Me	Me	6-Me	CO- <i>i</i> -Pr	O	
1-50	Me	Me	6-Et	CO- <i>i</i> -Pr	O	
1-51	Me	Me	6-Me	CO- <i>t</i> -Bu	O	
1-52	Me	Me	6-Et	CO- <i>t</i> -Bu	O	
1-53	Me	Me	6-Me	COOMe	O	
1-54	Me	Me	6-Et	COOMe	O	
1-55	Me	Me	6-Me	COOEt	O	
1-56	Me	Me	6-Et	COOEt	O	
1-57	Me	Me	6-Me	COO- <i>i</i> -Pr	O	
1-58	Me	Me	6-Et	COO- <i>i</i> -Pr	O	
1-59	Me	Me	6-Me	COO- <i>t</i> -Bu	O	NMR
1-60	Me	Me	6-Et	COO- <i>t</i> -Bu	O	
1-61	Me	Me	6-Me		O	
1-62	Me	Me	6-Me	SO ₂ Me	O	60
1-63	Me	Me	6-Et		O	
1-64	Me	Me	6-Et	SO ₂ Me	O	
1-65	Et	Me	6-Me	H	O	97
1-66	Et	Me	6-Et	H	O	
1-67	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	O	

Bảng 1 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ¹	X	Các đặc tính vật lý
1-68	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	O	
1-69	Me	Me	6-Et	COOEt	S	
1-70	Me	Me	6-Me	COEt	S	
1-71	Me	Me	6-Et	COEt	S	
1-72	Me	Me	6-Me	CO <i>i</i> -Pr	S	
1-73	Me	Me	6-Et	CO <i>i</i> -Pr	S	
1-74	Me	Me	6-Me	CO <i>t</i> -Bu	S	
1-75	Me	Me	6-Et	CO <i>t</i> -Bu	S	
1-76	Me	Me	6-Me	COOMe	S	
1-77	Me	Me	6-Et	COOMe	S	
1-78	Me	Me	6-Me	COOEt	S	
1-79	Me	Me	6-Et	COOEt	S	
1-80	Me	Me	6-Me	COO <i>i</i> -Pr	S	
1-81	Me	Me	6-Et	COO <i>i</i> -Pr	S	
1-82	Me	Me	6-Me	COO <i>t</i> -Bu	S	
1-83	Me	Me	6-Et	COO <i>t</i> -Bu	S	
1-84	Me	Me	6-Me		S	
1-85	Me	Me	6-Me	SO ₂ Me	S	
1-86	Me	Me	6-Et		S	
1-87	Me	Me	6-Et	SO ₂ Me	S	
1-88	Et	Me	6-Me	H	S	
1-89	Et	Me	6-Et	H	S	
1-90	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	S	
1-91	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	S	
1-92	Me	Me	6-Et	H	NMe	
1-93	Me	Me	6-Et	Me	NMe	
1-94	Me	H	6-Me	H	O	
1-95	Me	H	6-Et	H	O	184
1-96	Me	H	6-Me	Me	O	
1-97	Me	H	6-Et	Me	O	
1-98	Me	Et	6-Me	H	O	NMR
1-99	Me	Et	6-Et	H	O	
1-100	Me	Et	6-Me	Me	O	NMR
1-101	Me	Et	6-Et	Me	O	
1-102	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	H	O	
1-103	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	H	O	

Bảng 1 (tiếp theo)

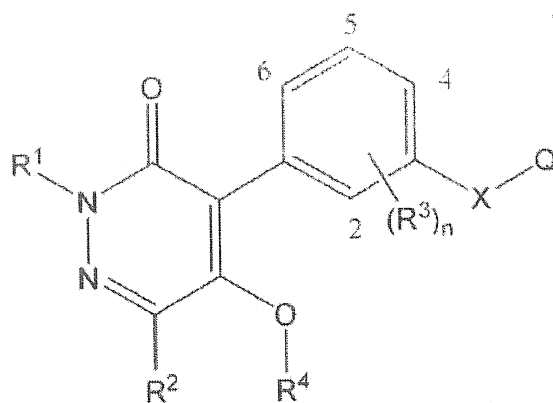
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
1-104	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	Me	O	
1-105	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	Me	O	
1-106	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	H	O	
1-107	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	H	O	
1-108	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	Me	O	
1-109	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	Me	O	
1-110	Me	H	6-Me	H	S	
1-111	Me	H	6-Et	H	S	
1-112	Me	H	6-Me	Me	S	
1-113	Me	H	6-Et	Me	S	
1-114	Me	Et	6-Me	H	S	
1-115	Me	Et	6-Et	H	S	
1-116	Me	Et	6-Me	Me	S	
1-117	Me	Et	6-Et	Me	S	
1-118	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	H	S	
1-119	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	H	S	
1-120	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	Me	S	
1-121	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	Me	S	
1-122	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	H	S	
1-123	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	H	S	
1-124	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	Me	S	
1-125	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	Me	S	
1-126	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	Me	O	
1-127	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	O	
1-128	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	Me	S	
1-129	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	S	
1-130	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
1-131	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOEt	O	NMR
1-132	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
1-133	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOO <i>i</i> -Pr	O	NMR
1-134	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	105
1-135	Me	Me	6-Me	CO <i>n</i> -Bu	O	NMR
1-136	Me	Me	6-Me		O	NMR

Bảng 1 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
1-137	Me	Et	6-Me	COMe	O	NMR
1-138	Me	Et	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
1-139	Me	Et	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
1-140	Me	CF ₃	6-Me	Me	O	NMR
1-141	Me	CF ₂	6-Me	H	O	NMR
1-142	Me	CF ₃	6-Me	COMe	O	NMR
1-143	Me	Me	6-Me	H	NMe	187-188
1-144	Me	Me	6-Me	H	NH	199-202
1-145	Me	Me	6-Me	COMe	NMe	147
1-146	Me	Me	6-Me	COMe	NH	204-205
1-147	Me	Me	6-Me	Me	NMe	NMR
1-148	Me	Me	6-Me	Me	NH	NMR
1-149	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	85-89
1-150	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	O	109-112
1-151	Me	Me	4,6-(Me) ₂	CH(Me)OCOOMe	O	45
1-152	Me	Me	4,6-(Me) ₂	COMe	O	129
1-153	Me	Me	H	H	O	168
1-154	Me	Me	4-NO ₂ ,6-Me	H	O	54
1-155	Me	Me	4-NO ₂ ,6-Me	COMe	O	63
1-156	Me	Me	4-NH ₂ ,6-Me	COMe	O	48
1-157	Et	H	6-Me	H	O	184
1-158	Me	Me	4-Et,6-Me	H	O	98
1-159	Me	Me	4-Et,6-Me	COMe	O	144
1-160	Me	Me	4-COMe,6-Me	H	O	55
1-161	Me	Me	4-COMe,6-Me	COMe	O	62
1-162	Me	H	6-OCF ₃	H	O	NMR
1-163	Me	Me	6-OCF ₃	H	O	93
1-164	Me	Me	6-OCF ₃	COMe	O	103
1-165	Et	Me	6-Me	COMe	O	40
1-166	<i>c</i> -Pr-CH ₂ -	H	2-Me	H	O	113
1-167	CH ₂ =CHCH ₂ -	H	6-Me	H	O	79
1-168	Me	Me	6-OH	H	O	96
1-169	MeCOCH ₂ -	H	6-Me	H	O	172
1-170	<i>c</i> -Pr-CH ₂ -	H	2-Me	COMe	O	NMR
1-171	Me	H	6-Me	COMe	O	NMR
1-172	4-MeO-Bn-	H	6-Me	H	O	88

Bảng 1 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
I-173	Et	H	6-Et	H	O	164
I-174	Et	H	6-Et	COMe	O	77
I-175	MeOCH ₂ -	H	6-Me	H	O	73
I-176	MeOCH ₂ -	H	6-Me	COMe	O	NMR
I-177	Pr	H	6-Me	H	O	57
I-178	Me	H	6-Cl	H	O	90
I-179	Me	H	6-CF ₃	H	O	94
I-180	MeOCH ₂ CH ₂ -	H	6-Me	H	O	67
I-181	Et	H	6-Me	COMe	O	NMR
I-182	MeOCH ₂ CH ₂ -	H	6-Me	COMe	O	NMR
I-183	Me S CH ₂ -	Me	6-Me	H	O	68
I-184	Me	H	6-Cl	COMe	O	120
I-185	MeOOCCH ₂ -	Me	6-Me	Me	O	NMR
I-186	MeOOCCH ₂ -	Me	6-Me	COMe	O	
I-187	Me S CH ₂ -	Me	6-Me	COMe	O	NMR
I-188	HOOCCH ₂ -	Me	6-Me	H	O	140-143



Bảng 2

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-1	Me	Me	6-Me	H	O		
2-2	Me	Me	6-Me	H	O		121-124
2-3	Me	Me	6-Me	H	O		99-101
2-4	Me	Me	6-Me	H	O		
2-5	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-6	Me	Me	6-Me	H	O		
2-7	Me	Me	6-Me	H	O		202-204
2-8	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-9	Me	Me	6-Me	H	O		
2-10	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-11	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-12	Me	Me	6-Me	H	O		105-106
2-13	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-14	Me	Me	6-Et	H	O		NMR

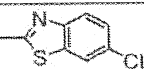
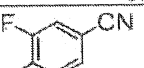
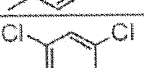
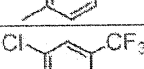
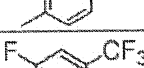
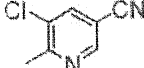
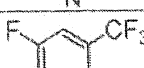
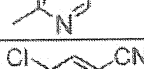
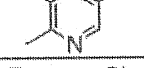
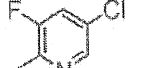
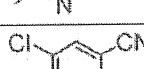
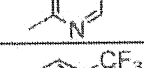
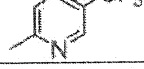
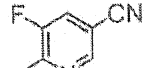
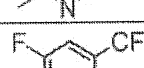
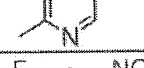
Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-15	Me	Me	6-Et	H	O		
2-16	Me	Me	6-Et	H	O		
2-17	Me	Me	6-Et	H	O		
2-18	Me	Me	6-Et	H	O		
2-19	Me	Me	6-Et	H	O		
2-20	Me	Me	6-Et	H	O		
2-21	Me	Me	6-Et	H	O		
2-22	Me	H	6-Et	H	O		
2-23	Me	H	6-Et	H	O		
2-24	Me	H	6-Et	H	O		
2-25	Me	H	6-Et	H	O		
2-26	Et	Me	6-Me	H	O		
2-27	Et	Me	6-Et	H	O		
2-28	i-Pr	Me	6-Me	H	O		
2-29	i-Pr	Me	6-Et	H	O		
2-30	Me	Me	6-Me	H	S		
2-31	Me	Me	6-Me	H	S		
2-32	Me	Me	6-Me	H	S		

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	
2-33	Me	Me	6-Me	H	S		
2-34	Me	Me	6-Me	H	S		
2-35	Me	Me	6-Me	H	S		
2-36	Me	Me	6-Me	H	S		
2-37	Me	Me	6-Me	H	S		
2-38	Me	Me	6-Me	H	S		
2-39	Me	Me	6-Me	H	S		
2-40	Me	Me	6-Me	H	S		
2-41	Me	Me	6-Me	H	S		
2-42	Me	Me	6-Me	H	S		
2-43	Me	Me	6-Et	H	S		
2-44	Me	Me	6-Et	H	S		
2-45	Me	Me	6-Et	H	S		
2-46	Me	Me	6-Et	H	S		
2-47	Me	Me	6-Et	H	S		
2-48	Me	Me	6-Et	H	S		
2-49	Me	Me	6-Et	H	S		
2-50	Me	Me	6-Et	H	S		

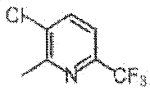
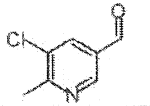
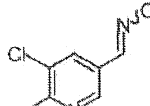
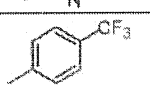
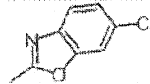
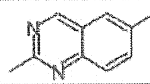
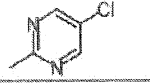
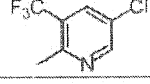
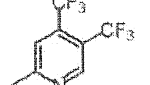
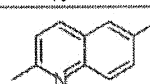
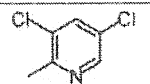
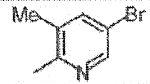
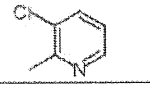
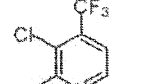
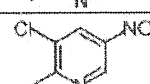
Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-51	Me	H	6-Et	H	S		
2-52	Me	H	6-Et	H	S		
2-53	Me	H	6-Et	H	S		
2-54	Me	H	6-Et	H	S		
2-55	Et	Me	6-Me	H	S		
2-56	Et	Me	6-Et	H	S		
2-57	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	S		
2-58	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	S		
2-59	Me	Me	6-Me	COMe	O		157
2-60	Me	Me	6-Me	COMe	O		170
2-61	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-62	Me	Me	6-Me	COMe	O		
2-63	Me	Me	6-Me	COMe	O		143-144
2-64	Me	Me	6-Me	COMe	O		
2-65	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-66	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-67	Me	Me	6-Et	COMe	O		

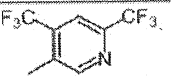
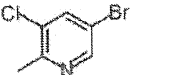
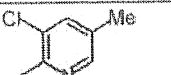
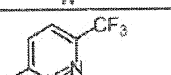
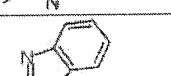
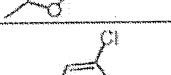
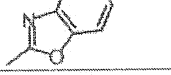
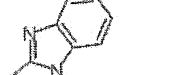
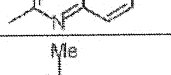
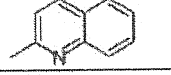
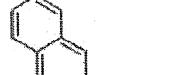
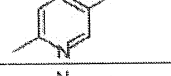
Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-68	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-69	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-70	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-71	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-72	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-73	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-74	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-75	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-76	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-77	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-78	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-79	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-80	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-81	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-82	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-83	Me	Me	6-Me	H	O		179
2-84	Me	Me	6-Me	H	O		188-189

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-85	Me	Me	6-Me	H	O		224-225
2-86	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-87	Me	Me	6-Me	H	O		137-139
2-88	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-89	Me	Et	6-Me	H	O		NMR
2-90	Me	Me	6-Me	H	O		120-122
2-91	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-92	Me	Me	6-Me	H	O		109-110
2-93	Me	Me	6-Me	H	O		96-98
2-94	Me	Me	6-Me	H	O		132-134
2-95	Me	Me	6-Me	H	O		104-105
2-96	Me	Me	6-Me	H	O		104-106
2-97	Me	Me	6-Me	H	O		86-87
2-98	Me	Me	6-Me	H	O		120-122
2-99	Me	Me	6-Me	H	O		105-108

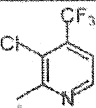
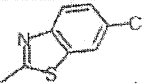
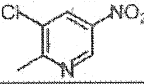
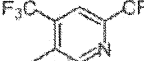
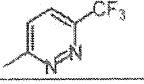
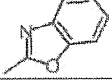
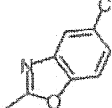
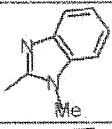
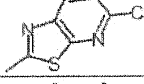
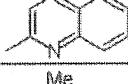
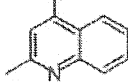
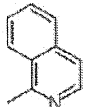
Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-100	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-101	Me	Me	6-Me	H	O		166-168
2-102	Me	Me	6-Me	H	O		102-105
2-103	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-104	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-105	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-106	Me	Me	6-Me	H	O		116-121
2-107	Me	Me	6-Me	H	O		113-118
2-108	Me	Me	6-Me	H	O		105-108
2-109	Me	Me	6-Me	H	O		223-224
2-110	Me	Me	6-Me	H	O		108-112
2-111	Me	Me	6-Me	H	O		110-112
2-112	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-113	Me	Me	6-Me	H	O		132-133
2-114	Me	Me	6-Me	COMe	O		142

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q ¹	Các đặc tính vật lý
2-115	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-116	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-117	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-118	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-119	Me	Me	6-Me	COMe	O		148-149
2-120	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-121	Me	Me	6-Me	COMe	O		186-187
2-122	Me	Et	6-Me	COMe	O		166-168
2-123	Me	Me	6-Me	COMe	O		207-208
2-124	Me	Me	6-Me	COMe	O		193
2-125	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-126	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-127	Me	Me	6-Me	COMe	O		170-171
2-128	Me	Me	6-Me	COMe	O		166
2-129	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-130	Me	Me	6-Me	COMe	O		173

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-131	Me	Me	6-Me	COMe	O		140
2-132	Me	Me	6-Me	COMe	O		143-144
2-133	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-134	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-135	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-136	Me	Me	6-Me	COMe	O		179-180
2-137	Me	Me	6-Me	COMe	O		160-161
2-138	Me	Me	6-Me	COMe	O		191-192
2-139	Me	Me	6-Me	COMe	O		149-152
2-140	Me	Me	6-Me	COMe	O		202
2-141	Me	Me	6-Me	COMe	O		137-141
2-142	Me	Me	6-Me	COMe	O		127-129
2-143	Me	Me	6-Me	COMe	O		167-168
2-144	Me	Me	6-Me	COMe	O		198-199

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-145	Me	Me	6-Me	COMe	O		143
2-146	Me	Me	6-Me	COMe	O		147
2-147	Me	Me	6-Me	COMe	O		207-208
2-148	Me	Me	6-Me	COMe	O		181-182
2-149	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O		NMR
2-150	Me	Me	6-Et	H	O		95-99
2-151	Me	Me	6-Me	H	O		115
2-152	Me	Me	6-Me	COMe	O		157
2-153	Me	Me	6-Me	H	O		94
2-154	Me	Me	6-Me	COMe	O		146
2-155	Me	Me	6-Me	H	O		198
2-156	Me	Me	6-Me	H	O		123
2-157	Me	Me	6-Me	COMe	O		188
2-158	Me	Me	6-Me	COMe	O		147
2-159	Me	Me	6-Et	COMe	O		163
2-160	Me	H	6-Et	COMe	O		NMR
2-161	Me	Me	6-Et	H	O		86-90

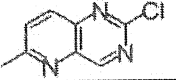
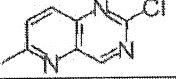
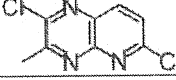
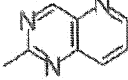
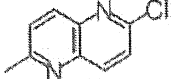
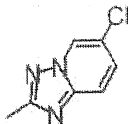
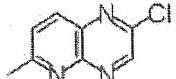
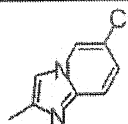
Bảng 2 (tiếp theo)

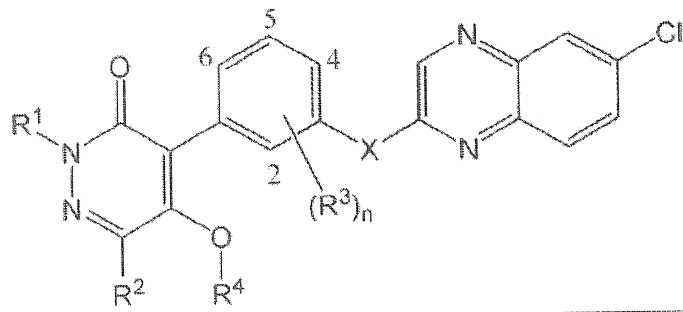
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-162	Me	Me	6-Et	H	O		176
2-163	Me	H	6-Me	H	O		250
2-164	Me	H	6-Me	COMe	O		NMR
2-165	Me	Me	6-Et	H	O		95
2-166	Me	Me	6-Et	H	O		147
2-167	Et	H	6-Me	H	O		239
2-168	Ph	H	6-Me	H	O		234
2-169	Et	H	6-Me	COMe	O		131
2-170	Ph	H	6-Me	COMe	O		63
2-171	<i>i</i> -Pr	H	6-Me	H	O		229
2-172	<i>i</i> -Pr	H	6-Me	COMe	O		NMR
2-173	Me	H	6-Me	H	O		99
2-174	Me	H	6-Me	COMe	O		114
2-175	Me	Me	6-OCF ₃	H	O		92
2-176	Et	Me	6-Me	H	O		92
2-177	Et	Me	6-Me	COMe	O		138
2-178	Me	H	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O		40-42
2-179	CHF ₂ CH ₂ -	H	6-Me	H	O		210
2-180	Me	H	6-Me	H	O		186-189

Bảng 2 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-181	Me	H	6-Me	H	O		250
2-182	Me	H	6-Me	H	O		140
2-183	Me	H	6-Me	H	O		105
2-184	Me	H	6-Me	H	O		210
2-185	Me	H	6-Me	H	O		150
2-186	<i>n</i> -Pr-CH ₂ -	H	6-Me	H	O		211
2-187	Me	Me	6-Et	H	O		183
2-188	Me	Me	6-Et	H	O		55
2-189	Me	Me	6-Et	COMe	O		138
2-190	Me	Me	6-Et	COMe	O		NMR
2-191	Me	Me	6-Me	H	O		140
2-192	Ph	H	6-Me	COMe	O		63
2-193	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-194	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-195	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-196	Me	Me	6-Me	H	O		149-150

Bảng 2 (tiếp theo)

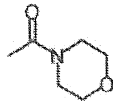
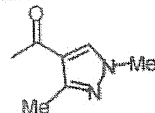
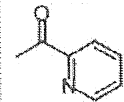
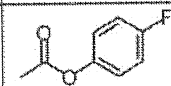
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Các đặc tính vật lý
2-197	Me	Me	6-Me	COMe	O		137-138
2-198	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-199	Me	Me	6-Me	COMe	O		183-185
2-200	Me	Me	6-Me	Me	O		229-230
2-201	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-202	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-203	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-204	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-205	Me	Me	6-Me	Me	O		173-175



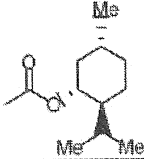
Bảng 3

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
3-1	Me	Me	6-Me	H	O	202-204
3-2	Me	Me	6-Me	H	S	
3-3	Me	Me	6-Et	H	O	
3-4	Me	Me	6-Et	H	S	
3-5	Me	Me	6-Pr	H	O	
3-6	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	O	
3-7	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	O	
3-8	Me	Me	6-CF ₃	H	O	
3-9	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	
3-10	Me	Me	6-OMe	H	O	
3-11	Me	Me	6-Cl	H	O	
3-12	Me	Me	2-Me	H	O	
3-13	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	O	
3-14	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	O	
3-15	Me	Me	4-Me	H	O	
3-16	Me	Me	6-Pr	H	S	
3-17	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	S	
3-18	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	S	
3-19	Me	Me	6-CF ₃	H	S	
3-20	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	S	
3-21	Me	Me	6-OMe	H	S	
3-22	Me	Me	6-Cl	H	S	
3-23	Me	Me	2-Me	H	S	
3-24	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	S	
3-25	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	S	
3-26	Me	Me	4-Me	H	S	
3-27	Me	Me	6-Me	Me	O	NMR
3-28	Me	Me	6-Et	Me	O	
3-29	Me	Me	2-Me	Me	O	
3-30	Me	Me	6-Pr	Me	O	
3-31	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	O	
3-32	Me	Me	6-Me	Me	S	

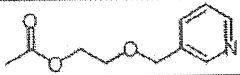
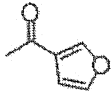
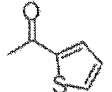
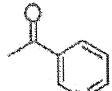
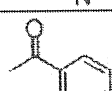
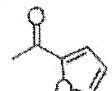
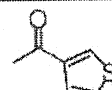
Bảng 3 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
3-33	Me	Me	6-Me	COMe	O	192
3-34	Me	Et	6-Me	H	O	164-168
3-35	Me	Me	6-Me	COOEt	O	NMR
3-36	Me	Me	6-Me	CO <i>n</i> -Bu	O	112-113
3-37	Me	Me	6-Me	CO <i>c</i> -Pr	O	NMR
3-38	Me	Me	6-Me	COPh	O	200-201
3-39	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-40	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
3-41	Me	Me	6-Me	CH ₂ Ph	O	128
3-42	Me	Me	6-Me	CO <i>t</i> -Bu	O	178-180
3-43	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-44	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
3-45	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OMe	O	168-169
3-46	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ COOMe	O	NMR
3-47	Me	Me	6-Me	COCH ₂ Ph	O	NMR
3-48	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OPh	O	NMR
3-49	Me	Me	6-Me	COCH=CH ₂	O	NMR
3-50	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ SMe	O	164-165
3-51	Me	Me	6-Me		O	172-175
3-52	Me	Me	6-Me	COCF ₃	O	NMR
3-53	Me	Me	6-Me	COCH ₂ <i>t</i> -Bu	O	146
3-54	Me	Me	6-Me	COCH=CHCl	O	NMR
3-55	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-56	Me	Me	6-Me	COSPr	O	NMR
3-57	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-58	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	O	NMR
3-59	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ Cl	O	NMR
3-60	Me	Me	6-Me	COO <i>i</i> -Pr	O	NMR

Bảng 3 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
3-61	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-62	Me	Me	6-Me	CSOPh	O	NMR
3-63	Me	Me	6-Me	CSSPh	O	NMR
3-64	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ C≡CH	O	NMR
3-65	Me	Me	6-Me	CON(Me) ₂	O	NMR
3-66	Me	Me	6-Me	CON(Me)Ph	O	166-167
3-67	Me	Me	6-Me	CSN(Me) ₂	O	NMR
3-68	Me	Me	6-Me	SO ₂ Et	O	187-188
3-69	Me	Me	6-Me	SO ₂ CF ₃	O	167-168
3-70	Me	Me	6-Me	SO ₂ c-Pr	O	197-198
3-71	Me	Me	6-Me	SO ₂ (4-Me-Ph)	O	NMR
3-72	Me	Me	6-Me	CH ₂ COMe	O	186-187
3-73	Me	Me	6-Me	CH ₂ COPh	O	168
3-74	Me	Me	6-Me	CH ₂ CH=CH ₂	O	119
3-75	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-76	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOc-Hex	O	NMR
3-77	Me	Me	6-Me	CH ₂ C≡CH	O	162-164
3-78	Me	Me	6-Me	CH ₂ CN	O	165
3-79	Me	Me	6-Me	COCOOEt	O	NMR
3-80	Me	Me	6-Me	COCH ₂ c-Hex	O	NMR
3-81	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	O	NMR
3-82	Me	Me	6-Me	COC≡CH	O	NMR
3-83	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	130-131
3-84	Me	Me	6-Me	COCH ₂ NMe ₂	O	141-142
3-85	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CN	O	
3-86	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	
3-87	Me	Me	6-Me	COOCH(Me)Cl	O	NMR
3-88	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ c-Pr	O	
3-89	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	

Bảng 3 (tiếp theo)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Các đặc tính vật lý
3-90	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ Ph	O	NMR
3-91	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	O	
3-92	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SMe	O	
3-93	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ F	O	
3-94	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	O	
3-95	Me	Me	6-Me		O	
3-96	Et	Me	6-Me	H	O	103
3-97	Et	Me	6-Me	COMe	O	173
3-98	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-99	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH=CH ₂	O	NMR
3-100	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ SMe	O	NMR
3-101	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ c-Pr	O	NMR
3-102	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH(Me) ₂	O	NMR
3-103	Me	Me	6-Me	COOC(Me)=CH ₂	O	122
3-104	Me	Me	6-Me		O	185-186
3-105	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-106	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-107	Me	Me	6-Me		O	217
3-108	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ On-Bu	O	NMR
3-109	Me	Me	6-Me		O	207-208
3-110	Me	Me	6-Me		O	NMR

Bảng 4

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
1-27	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,27(3H, s), 3,47(3H, s), 3,73(3H, s), 7,03(1H, d, $J = 2,4\text{Hz}$), 7,13(1H, dd, $J = 2,4\text{Hz}$, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,1\text{Hz}$), 7,95(1H, d, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,23(1H, dd, $J = 0,9\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$).
1-28	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 2,26(3H, s), 2,46-2,65(2H, m), 3,49(3H, s), 3,74(3H, s), 7,00(1H, d, $J = 2,4\text{Hz}$), 7,19(1H, dd, $J = 2,7\text{Hz}$, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,40(1H, d, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,95(1H, dd, $J = 0,6\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,23(1H, dd, $J = 0,9\text{Hz}$, $J = 1,8\text{Hz}$).
1-29	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,96(3H, s), 2,29(3H, s), 3,44(3H, s), 3,68(3H, s), 7,14-7,20(2H, m), 7,32(1H, dd, $J = 0,6\text{Hz}$, $J = 8,1\text{Hz}$), 7,98(1H, dd, $J = 0,3\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,21(1H, dd, $J = 0,9\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$).
1-32	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,24(3H, s), 2,30(3H, s), 3,53(3H, s), 3,73(3H, s), 7,36-7,38(2H, m), 7,48(1H, dd, $J = 2,1\text{Hz}$, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,76(1H, dd, $J = 0,6\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,33(1H, dd, $J = 0,9\text{Hz}$, $J = 1,8\text{Hz}$).
1-40	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,07(3H, s), 2,21(3H, s), 2,25(3H, s), 3,82(3H, s), 6,89(1H, d, $J = 2,4\text{Hz}$), 7,11(1H, dd, $J = 2,7\text{Hz}$, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,96(1H, d, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,21(1H, dd, $J = 0,9\text{Hz}$, $J = 2,1\text{Hz}$).
1-41	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,26(3H, t, $J = 7,2\text{Hz}$), 2,22(3H, s), 2,31(3H, s), 3,82(3H, s), 4,12(2H, q, $J = 7,2\text{Hz}$), 6,95(1H, d, $J = 2,7\text{Hz}$), 7,13(1H, dd, $J = 2,4\text{Hz}$, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,4\text{Hz}$), 7,95(1H, d, $J = 2,1\text{Hz}$), 8,23(1H, dd, $J = 1,2\text{Hz}$, $J = 2,4\text{Hz}$).
1-59	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,33(9H, s), 2,21(3H, s), 2,29(3H, s), 3,80(3H, s), 6,94(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,10(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,31(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,93(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,22(1H, d, $J = 1,0\text{Hz}$).
1-98	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,24(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 2,20(3H, s), 2,68(2H, q, $J = 7,5\text{Hz}$), 3,74(3H, s), 6,68(1H, br.s), 7,00(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,13(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,40(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,97(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,19(1H, s).
1-100	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,21(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 2,23(3H, s), 2,64(3H, s), 3,45(3H, s), 7,03(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,12(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,94(1H, d, $J = 1,5\text{Hz}$), 8,22(1H, s).
1-130	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,27-1,30(3H, m), 2,14-2,25(3H, m), 2,26-2,34(3H, m), 3,60-3,76(6H, m), 5,65-5,83(1H, m), 6,92-7,20(2H, m), 7,35-7,39(1H, m), 7,95(1H, br.s), 8,17-8,22(1H, m).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
1-131	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.22-1.36(6H, m), 2.15-2.25(3H, m), 2.26-2.35(3H, m), 3.74-3.76(3H, m), 4.10-4.19(2H, m), 5.65-5.84(1H, m), 6.92-7.20(2H, m), 7.34-7.39(1H, m), 7.94(1H, br.s), 8.17-8.19(1H, m).
1-132	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.34(3H, s), 3.31(3H, s), 3.75(3H, s), 4.60(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 4.71(1H, d, $J = 6.5\text{Hz}$), 7.01(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.94(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.20(1H, s).
1-133	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.22-1.29(9H, m), 2.15-2.24(3H, m), 2.26-2.36(3H, m), 3.74-3.76(6H, m), 4.71-4.83(1H, m), 5.64-5.86(1H, m), 6.92-7.20(2H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.94(1H, br.s), 8.17 (1H, br.s).
1-135	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.81(3H, t, $J = 7.5\text{Hz}$), 1.11-1.19(2H, m), 1.36-1.45(2H, m), 2.19(3H, s), 2.23(3H, s), 2.25-2.32(2H, m), 3.80(3H, s), 6.88(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.10(1H, m), 7.31(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.94(1H, d, $J = 1.5\text{Hz}$), 8.19(1H, d, $J = 1.0\text{Hz}$).
1-136	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.24-2.26(6H, m), 3.81(3H, s), 3.83(3H, s), 6.91(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.03(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.28(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.74(1H, s), 7.91-7.94(2H, m).
1-137	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.23(3H, t, $J = 7.5\text{Hz}$), 2.04(3H, s), 2.20(3H, s), 2.56(2H, q, $J = 7.5\text{Hz}$), 3.82(3H, s), 6.88(1H, s), 7.09(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.94(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.19(1H, s).
1-138	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.26(3H, m), 2.23(3H, s), 2.71 (2H, m), 3.32(3H, s), 3.76(3H, s), 4.58(1H, d, $J = 5.5\text{Hz}$), 4.69(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 7.02(1H, s), 7.10(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.94(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.21(1H, s).
1-139	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.15-1.29(6H, m), 2.14-2.34(3H, m), 2.53-2.73(2H, m), 3.69-3.72(3H, m), 3.75-3.77(3H, m), 5.66-5.84(1H, m), 6.92-7.21(2H, m), 7.34-7.39(1H, m), 7.94-7.95(1H, m), 8.17-8.20(1H, m).
1-140	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.25(3H, s), 3.51(3H, s), 3.82(3H, s), 7.06(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.18(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.37(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.96(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.22(1H, s).
1-141	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 3.83(3H, s), 7.02(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.17(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.45(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.99-8.00(2H, m), 8.17(1H, d, $J = 1.5\text{Hz}$).
1-142	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.22(3H, s), 3.90(3H, s), 6.93(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.13(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.96(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.19(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
1-147	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.17(3H, s), 2.26(3H, s), 3.44(3H, s), 3.47(3H, s), 3.71(3H, s), 6.87(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 6.99(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.22(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.66(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.45(1H, s).
1-148	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.18(3H, s), 2.29(3H, s), 3.45(3H, s), 3.76(3H, s), 7.20(1H, br.s), 7.25-7.38(2H, m), 7.67-7.74(2H, m), 8.34(1H, d, $J = 1.0\text{Hz}$).
1-162	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 3.74(3H, s), 7.19-7.26(2H, m), 7.42(1H, dd, $J = 1.2\text{Hz}$, $J = 7.5\text{Hz}$), 7.72(1H, s), 8.00(1H, d, $J = 2.1\text{Hz}$), 8.09(1H, dd, $J = 1.2\text{Hz}$, $J = 2.1\text{Hz}$).
1-170	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.55-0.58(4H, m), 1.33-1.41(1H, m), 2.10(3H, s), 2.22(3H, s), 4.03-4.16(2H, m), 6.94(1H, d, $J = 2.7\text{Hz}$), 7.11(1H, dd, $J = 2.1\text{Hz}$, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.76(1H, s), 7.96(1H, d, $J = 2.1\text{Hz}$), 8.22(1H, dd, $J = 1.2\text{Hz}$, $J = 2.1\text{Hz}$).
1-171	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.21(3H, t, $J = 8.4\text{Hz}$), 2.15(3H, s), 2.40-2.60(2H, m), 3.82(3H, s), 6.88(1H, d, $J = 2.7\text{Hz}$), 7.18(1H, dd, $J = 2.1\text{Hz}$, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.40(1H, d, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.75(1H, s), 7.96(1H, d, $J = 2.1\text{Hz}$), 8.23(1H, dd, $J = 1.2\text{Hz}$, $J = 2.1\text{Hz}$).
1-176	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.20(3H, s), 3.50(3H, s), 5.46-5.50(2H, m), 6.90(1H, s), 7.11(1H, dd, $J = 2.1\text{Hz}$, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.79(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s).
1-181	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.40(3H, t, $J = 8.4\text{Hz}$), 2.09(3H, s), 2.20(3H, s), 4.20-4.32(2H, m), 6.91(1H, s), 7.12(1H, dd, $J = 2.1\text{Hz}$, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.75(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s).
1-182	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.20(3H, s), 3.37(3H, s), 3.78-3.81(2H, m), 4.38-4.45(2H, m), 6.90(1H, s), 7.11(1H, dd, $J = 2.1\text{Hz}$, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 8.4\text{Hz}$), 7.77(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s).
1-185	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.18(3H, s), 3.76(3H, s), 3.88(3H, s), 4.83-4.95(2H, m), 7.01(1H, s), 7.11(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.31(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.91(1H, s), 7.95(1H, s), 8.25(1H, s).
1-187	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.10(3H, s), 2.21(3H, s), 2.30(3H, s), 5.20(1H, d, $J = 13.0\text{Hz}$), 5.27(1H, d, $J = 13.0\text{Hz}$), 6.90(1H, s), 7.11(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.78(1H, s), 7.96(1H, s), 8.20(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
2-5	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,32(3H, s), 3,75(3H, s), 6,59(1H, br.s), 7,02(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,17(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,43(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,69(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,12(1H, s).
2-8	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,32(3H, s), 3,74(3H, s), 7,17(1H, br.s), 7,22-7,24(2H, m), 7,31-7,34(2H, m), 7,42-7,45(2H, m).
2-10	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,21(3H, s), 2,31(3H, s), 3,73(3H, s), 7,17(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,25-7,26(2H, m), 7,30-7,33(1H, m), 7,40(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,50(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,64(1H, d, $J = 1,0\text{Hz}$).
2-11	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,18(3H, s), 2,32(3H, s), 3,74(3H, s), 5,54(1H, br.s), 6,90(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,04-7,08(2H, m), 7,36-7,40(2H, m), 7,45(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 10,0\text{Hz}$).
2-13	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,17(3H, s), 2,31(3H, s), 3,72(3H, s), 5,73(1H, br.s), 6,86(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,00-7,04(2H, m), 7,36(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,40-7,44(1H, m), 7,69(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$).
2-14	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,20(3H, s), 2,30(3H, s), 3,74(3H, s), 6,97(1H, s), 7,11(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,18(1H, br.s), 7,39(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,52(1H, dd, $J = 1,5\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,78(1H, s).
2-61	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,06(3H, s), 2,19(3H, s), 2,24(3H, s), 3,80(3H, s), 6,86(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 6,98(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,08(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,31(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,86(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,38(1H, s).
2-86	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,23(3H, s), 2,32(3H, s), 3,76(3H, s), 6,59(1H, br.s), 7,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,16-7,20(1H, m), 7,44(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,23(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,39(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 9,94(1H, s).
2-88	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,16(3H, s), 2,31(3H, s), 3,73(3H, s), 5,76(1H, br.s), 6,87(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,01-7,06(3H, m), 7,35(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,53-7,55(2H, m).
2-89	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,25(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 2,23(3H, s), 2,69(2H, q, $J = 7,5\text{Hz}$), 3,75(3H, s), 7,21-7,24(2H, m), 7,30-7,33(2H, m), 7,43-7,45(2H, m).
2-91	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,21(3H, s), 2,31(3H, s), 3,74(3H, s), 6,57(1H, br.s), 7,01(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,15(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,40(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 8,46(2H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
2-100	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.17(3H, s), 2.29(3H, s), 3.70(3H, s), 6.19(1H, br.s), 6.98(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.05-7.07(1H, m), 7.38(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.87(1H, s), 8.41(1H, s).
2-103	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.30(3H, s), 3.74(3H, s), 7.04(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.13(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.42-7.44(2H, m), 7.84(1H, d, $J = 9.5\text{Hz}$).
2-104	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.28(3H, s), 2.31(3H, s), 3.74(3H, s), 7.19(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.23-7.28(3H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.41-7.44(2H, m).
2-105	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.31(3H, s), 3.74(3H, s), 7.18-7.22(2H, m), 7.25-7.30(1H, m), 7.33-7.37(2H, m), 7.42(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.98(1H, br.s).
2-112	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.38(3H, s), 3.74(3H, s), 6.76(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 6.94(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.00(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.51-7.54(1H, m), 7.61-7.64(1H, m), 7.66-7.69(2H, m), 8.01(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.22(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$).
2-115	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.06(3H, s), 2.20(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.87(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.09(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.11(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.23(1H, s).
2-116	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.20(3H, s), 2.25(3H, s), 3.80(3H, s), 6.89(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.17(1H, d, $J = 1.5\text{Hz}$), 8.47(1H, s).
2-117	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.98(3H, s), 2.18(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.89(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.28-7.32(2H, m), 7.87(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$).
2-118	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.03(3H, s), 2.17(3H, s), 2.37(3H, s), 3.80(3H, s), 6.79(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 6.98-7.05(3H, m), 7.25-7.30(1H, m), 7.52-7.55(2H, m).
2-120	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.02(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.76(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 6.96-7.02(2H, m), 7.29(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.35(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.44(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 10.0\text{Hz}$).
2-125	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.19(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.85(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.08(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.30(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.93(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 8.15(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$).
2-126	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.20(3H, s), 2.25(3H, s), 3.81(3H, s), 6.87(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.08(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.32-7.34(2H, m), 8.53(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
2-129	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 2.29(3H, s), 3.80(3H, s), 6.78(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.03(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.27(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.60(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.92(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$).
2-133	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.06(3H, s), 2.21(3H, s), 2.25(3H, s), 3.81(3H, s), 6.89(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.54(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.81(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$).
2-134	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.04(3H, s), 2.20(3H, s), 2.27(3H, s), 3.80(3H, s), 6.83(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.07(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.35(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.90(1H, s), 8.35(1H, s).
2-135	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.84(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.07(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.29(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.86(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.98(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$).
2-149	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.34(3H, s), 3.31(3H, s), 3.47(3H, s), 3.74(3H, s), 4.58-4.61(1H, m), 4.70-4.73(1H, m), 5.17(2H, s), 6.99-7.03(1H, m), 7.10-7.15(1H, m), 7.30-7.36(1H, m), 7.94(1H, s), 8.08(1H, s), 8.15(1H, m).
2-160	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.21(3H, t, $J = 8.4\text{Hz}$), 2.16(3H, s), 2.62-2.39(2H, m), 3.85(3H, s), 7.11(1H, s), 7.23-7.27(1H, m), 7.35-7.44(4H, m), 7.77(1H, s).
2-164	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.13(3H, s), 2.26(3H, s), 3.85(3H, s), 7.15(1H, s), 7.22-7.26 (1H, m), 7.26-7.37(3H, m), 7.44(1H, d, $J = 2.1\text{Hz}$), 7.77(1H, s).
2-172	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.39-1.43(6H, m), 2.08(3H, s), 2.20(3H, s), 5.32(1H, q, $J = 6.6\text{Hz}$), 7.15(1H, s), 7.22-7.37(4H, m), 7.41(1H, d, $J = 2.1\text{Hz}$), 7.82(1H, s).
2-190	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.15-1.28(9H, m), 2.06(3H, s), 2.24(3H, s), 2.38-2.60(2H, m), 3.36-3.50(4H, m), 3.81(3H, s), 6.84(1H, d, $J = 2.7\text{Hz}$), 7.17(1H, dd, $J = 2.7\text{Hz}$, $J = 8.7\text{Hz}$), 7.38(1H, d, $J = 8.7\text{Hz}$), 7.81(1H, d, $J = 1.8\text{Hz}$), 8.01(1H, d, $J = 2.4\text{Hz}$).
2-193	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.21(3H, s), 2.32(3H, s), 3.73(3H, s), 6.88(1H, d, $J = 10.0\text{Hz}$), 7.01(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.12(1H, dd, $J = 2.3\text{Hz}$, $J = 8.3\text{Hz}$), 7.36(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.54(1H, s), 7.74(1H, d, $J = 10.0\text{Hz}$).
2-194	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.75(3H, s), 6.42(1H, brs), 7.02(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.15(1H, dd, $J = 2.3\text{Hz}$, $J = 8.3\text{Hz}$), 7.44(1H, d, $J = 7.0\text{Hz}$), 8.37(1H, s), 8.53(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
2-195	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,05(3H, s), 2,20(3H, s), 2,20(3H, s), 3,81(3H, s), 6,89(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,10(1H, dd, $J = 2,3\text{Hz}$, $J = 7,5\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 8,38(1H, s), 8,46(1H, s).
2-198	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,25(3H, s), 2,32(3H, s), 3,76(3H, s), 6,26(1H, brs), 7,13(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,46(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$, $J = 8,3\text{Hz}$), 7,70(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,05(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 9,40(1H, s).
3-27	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,26(6H, br.s), 3,55(3H, s), 3,76(3H, s), 7,10(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,18-7,21(1H, m), 7,35-7,37(1H, m), 7,58-7,59(2H, m), 8,04(1H, s), 8,68(1H, s).
3-35	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,14(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 2,23(3H, s), 2,36(3H, s), 3,82(3H, s), 4,11(2H, m), 7,06(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,22(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,73(1H, d, $J = 9,5\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-37	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0,78-0,92(4H, m), 1,59-1,63(1H, m), 2,21(3H, s), 2,25(3H, s), 3,80(3H, s), 7,00(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,21(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 9,5\text{Hz}$), 7,70(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-39	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,30(3H, s), 3,31-3,46(4H, m), 3,81(3H, s), 7,06(1H, br.s), 7,23-7,25(1H, m), 7,34(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,72(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,04(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-40	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,26(3H, s), 2,34(3H, s), 3,34(3H, s), 3,75(3H, s), 4,63(1H, d, $J = 5,5\text{Hz}$), 4,85(1H, d, $J = 5,5\text{Hz}$), 7,09(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,18(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,36(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,57-7,63(2H, m), 8,03(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,68(1H, s).
3-43	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,24(3H, s), 2,26(3H, s), 2,27(3H, s), 3,75(3H, s), 3,83(3H, s), 7,04(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,12(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,29(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,52(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,56-7,59(1H, m), 7,74(1H, s), 8,02(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,58(1H, s).
3-44	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,09-1,31(3H, m), 2,17-2,25(3H, m), 2,26-2,37(3H, m), 3,66-3,77(6H, m), 5,67-5,93(1H, m), 7,02-7,31(2H, m), 7,36-7,42(1H, m), 7,54-7,59(2H, m), 8,04(1H, d, $J = 1,0\text{Hz}$), 8,68(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
3-46	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,21(3H, s), 2,26(3H, s), 2,38-2,49(2H, m), 2,60(2H, br. t, $J = 6,5\text{Hz}$), 3,62(3H, s), 3,81(3H, s), 6,98(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,18-7,21(1H, m), 7,34(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,66(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,04(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,67(1H, s).
3-47	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,13(6H, s), 3,58(1H, d, $J = 15,0\text{Hz}$), 3,64(1H, d, $J = 15,0\text{Hz}$), 3,79(3H, s), 6,99-7,01(3H, m), 7,19-7,30(5H, m), 7,49-7,55(2H, m), 8,03(1H, d, $J = 1,5\text{Hz}$), 8,67(1H, s).
3-48	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,20(3H, s), 2,24(3H, s), 3,82(3H, s), 4,64(2H, s), 6,57-6,59(2H, m), 6,96(1H, t, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,04(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,18-7,25(3H, m), 7,39(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,44-7,48(2H, m), 8,01(1H, d, $J = 1,5\text{Hz}$), 8,68(1H, s).
3-49	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,23(3H, s), 2,24(3H, s), 3,82(3H, s), 5,90(1H, d, $J = 11,0\text{Hz}$), 6,06(1H, dd, $J = 11,0\text{Hz}$, $J = 17,0\text{Hz}$), 6,40(1H, d, $J = 17,0\text{Hz}$), 7,00(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,18(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,32(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,68(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 1,5\text{Hz}$), 8,63(1H, s).
3-52	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,29(3H, s), 3,85(3H, s), 7,00(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,23(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,36(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,67(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,67(1H, s).
3-54	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,23(3H, s), 2,26(3H, s), 3,82(3H, s), 6,15(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 6,75(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,01(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,19(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,68(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,64(1H, s).
3-55	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,30(3H, s), 3,27(3H, s), 3,43-3,47(2H, m), 3,81(3H, s), 4,18-4,22(2H, m), 7,07(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,23(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,74(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-56	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0,84(3H, t, $J = 7,5\text{Hz}$), 1,44-1,51(2H, m), 2,22(3H, s), 2,28(3H, s), 2,66-2,75(2H, m), 3,81(3H, s), 7,04(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,22(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,74(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,65(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	^1H -NMR δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
3-57	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,24(3H, s), 2,38(3H, s), 3,83(3H, s), 6,81-6,84(2H, m), 6,89-6,99(2H, m), 7,13(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,28(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,39(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,48(2H, br.s), 8,02(1H, s), 8,67(1H, s).
3-58	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,22(3H, s), 2,30(3H, s), 3,81(3H, s), 4,49-4,56(2H, m), 5,15-5,18(2H, m), 5,67-5,76(1H, m), 7,06(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,23(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,59(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,72(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-59	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,23(3H, s), 2,32(3H, s), 3,46-3,52(2H, m), 3,82(3H, s), 4,28(2H, t, $J = 5,5\text{Hz}$), 7,07(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 7,23-7,25(1H, m), 7,35(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,73(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,04(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,65(1H, s).
3-60	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1,11(3H, d, $J = 6,0\text{Hz}$), 1,14(3H, d, $J = 6,5\text{Hz}$), 2,23(3H, s), 2,31(3H, s), 3,81(3H, s), 4,70-4,78(1H, m), 7,07(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,22(1H, dd, $J = 3,0\text{Hz}$, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,33(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,59(1H, dd, $J = 2,0\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,73(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 8,64(1H, s).
3-61	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0,59-0,98(13H, m), 1,23-1,39(2H, m), 1,51-1,86(3H, m), 2,22-2,23(3H, m), 2,30(3H, s), 3,82(3H, s), 4,37-4,45(1H, m), 7,07-7,11(1H, m), 7,20-7,25(1H, m), 7,32(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,57-7,61(1H, m), 7,75(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,64(1H, s).
3-62	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,25(3H, s), 2,30(3H, s), 3,84(3H, s), 6,83-6,85(2H, m), 7,15(1H, d, $J = 2,0\text{Hz}$), 7,23-7,30(4H, m), 7,38(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,47(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,53(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 8,02(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,68(1H, s).
3-63	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,04(3H, s), 2,24(3H, s), 3,80(3H, s), 6,96(1H, br.s), 7,26-7,38(6H, m), 7,40-7,44(1H, m), 7,54(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 9,0\text{Hz}$), 7,66(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,04(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,70(1H, s).
3-64	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2,23(3H, s), 2,31(3H, s), 2,50(1H, t, $J = 2,5\text{Hz}$), 3,82(3H, s), 4,57-4,64(2H, m), 7,05(1H, d, $J = 3,0\text{Hz}$), 7,22(1H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,34(1H, d, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,60(1H, dd, $J = 2,5\text{Hz}$, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,74(1H, d, $J = 9,0\text{Hz}$), 8,03(1H, d, $J = 2,5\text{Hz}$), 8,65(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
3-65	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.28(3H, s), 2.76(3H, s), 2.77(3H, s), 3.80(3H, s), 7.05(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.20(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.60(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.68(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.64(1H, s).
3-67	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.20-2.33(6H, m), 2.97-3.03(3H, m), 3.13-3.24(3H, m), 3.81-3.83(3H, m), 6.96-7.33(3H, m), 7.58-7.73(2H, m), 8.04-8.05(1H, m), 8.64-8.65(1H, m).
3-71	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.98(3H, s), 2.40(3H, s), 2.53(3H, s), 3.78(3H, s), 6.98(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.06-7.12(4H, m), 7.50-7.52(2H, m), 7.58(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.69(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.05(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.66(1H, s).
3-75	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.33(3H, s), 3.33(3H, s), 3.47(2H, t, $J = 4.0\text{Hz}$), 3.60-3.67(2H, m), 3.75(3H, s), 4.72(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 4.93(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 7.09(1H, br.s), 7.17-7.19(1H, m), 7.35(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.56-7.59(1H, m), 7.66(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.67(1H, s).
3-76	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.17-1.55(9H, m), 1.67-1.91(4H, m), 2.16-2.23(3H, m), 2.25-2.38(3H, m), 3.74-3.76(3H, m), 4.39-4.57(1H, m), 5.67-5.96(1H, m), 7.01-7.25(2H, m), 7.31-7.41(1H, m), 7.53-7.58(2H, m), 8.03-8.04(1H, m), 8.67-8.68(1H, m).
3-79	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.27(3H, t, $J = 7.0\text{Hz}$), 2.24(3H, s), 2.29(3H, s), 3.83(3H, s), 4.22-4.34(2H, m), 7.05(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.22(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.60(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.75(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.64(1H, s).
3-80	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.70-0.82(2H, m), 0.97-1.17(4H, m), 1.38-1.41(2H, m), 1.52-1.58(3H, m), 2.19(2H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 6.5\text{Hz}$), 2.21(3H, s), 2.23(3H, s), 3.80(3H, s), 7.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.21(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.60(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.70(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.65(1H, s).
3-81	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.33(3H, s), 3.52-3.59(2H, m), 3.73(2H, t, $J = 6.0\text{Hz}$), 3.75(3H, s), 4.73(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 4.96(1H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 7.10(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.20(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.37(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.59(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.65(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.68(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Dung môi: CDCl_3)
3-82	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.28(3H, s), 3.00(1H, s), 3.82(3H, s), 7.02(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.23(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.36(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.59(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.74(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.66(1H, s).
3-87	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.69-1.73(3H, m), 2.22-2.23(3H, m), 2.31-2.32(3H, m), 3.82-3.83(3H, m), 6.18-6.25(1H, m), 7.04-7.06(1H, m), 7.21-7.24(1H, m), 7.33-7.36(1H, m), 7.59-7.62(1H, m), 7.72-7.76(1H, m), 8.03-8.04(1H, m), 8.64-8.54(1H, m).
3-90	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.28(3H, s), 3.48-3.56(2H, m), 3.81(3H, s), 4.18-4.26(2H, m), 4.43(2H, s), 7.08(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.18-7.33(7H, m), 7.55(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.5\text{Hz}$), 7.72(1H, d, $J = 9.5\text{Hz}$), 8.02(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.60(1H, s).
3-98	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.30(3H, s), 3.33(1H, s), 3.45-3.48(2H, m), 3.50-3.53(2H, m), 3.54-3.57(2H, m), 3.81(3H, s), 4.19-4.22(2H, m), 7.07(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.21-7.24(1H, m), 7.34(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.59-7.62(1H, m), 7.74(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.65(1H, s).
3-99	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.31(3H, s), 3.72(2H, t, $J = 4.5\text{Hz}$), 3.81(3H, s), 4.00(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 7.0\text{Hz}$), 4.07-4.11(1H, m), 4.26-4.29(2H, m), 6.34(1H, dd, $J = 7.0\text{Hz}$, $J = 14.0\text{Hz}$), 7.07(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.22(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.59(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.73(1H, d, $J = 9.5\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.65(1H, s).
3-100	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.01(3H, s), 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 2.47-2.59(2H, m), 3.82(3H, s), 4.20(2H, t, $J = 7.0\text{Hz}$), 7.07(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.23-7.25(1H, m), 7.34(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.60(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.5\text{Hz}$), 7.74(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.65(1H, s).
3-101	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = [-0.06]-[-0.03](2H, m), 0.34-0.39(2H, m), 0.47-0.55(1H, m), 1.38(2H, q, $J = 6.5\text{Hz}$), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 3.80(3H, s), 4.10-4.15(2H, m), 7.07(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.22(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.59(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.74(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.64(1H, s).
3-102	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.78(6H, d, $J = 7.5\text{Hz}$), 1.77-1.85(1H, m), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 3.81(3H, s), 3.84(2H, d, $J = 6.0\text{Hz}$), 7.07(1H, d, $J = 3.0\text{Hz}$), 7.21-7.24(1H, m), 7.33(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.59(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.73(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.03(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.64(1H, s).

Bảng 4 (tiếp theo)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Dung môi: CDCl ₃)
3-105	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.27(3H, s), 2.29(3H, s), 3.84(3H, s), 7.04-7.06(1H, m), 7.08(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 7.10-7.13(1H, m), 7.28(1H, d, <i>J</i> = 8.5Hz), 7.49(1H, d, <i>J</i> = 9.0Hz), 7.54(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 7.55-7.58(1H, m), 7.77(1H, dd, <i>J</i> = 1.0Hz, <i>J</i> = 4.0Hz), 8.10(1H, d, <i>J</i> = 2.0Hz), 8.58(1H, s).
3-106	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.27(3H, s), 2.29(3H, s), 3.86(3H, s), 7.07(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 7.10(1H, dd, <i>J</i> = 2.5Hz, <i>J</i> = 8.5Hz), 7.28(1H, d, <i>J</i> = 8.5Hz), 7.29-7.33(1H, m), 7.45(1H, d, <i>J</i> = 9.5Hz), 7.55(1H, dd, <i>J</i> = 2.0Hz, <i>J</i> = 9.5Hz), 8.01(1H, d, <i>J</i> = 2.0Hz), 8.13-8.16(1H, m), 8.59(1H, s), 8.76(1H, dd, <i>J</i> = 1.5Hz, <i>J</i> = 5.0Hz), 9.11(1H, d, <i>J</i> = 2.0Hz).
3-108	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 0.88(3H, t, <i>J</i> = 7.0Hz), 1.28-1.33(2H, m), 1.48-1.53(2H, m), 2.22(3H, s), 2.25(3H, s), 3.35-3.49(6H, m), 3.82(3H, s), 4.16(2H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 7.00(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 7.19(1H, dd, <i>J</i> = 2.5Hz, <i>J</i> = 9.0Hz), 7.33(1H, d, <i>J</i> = 9.0Hz), 7.60(1H, dd, <i>J</i> = 2.5Hz, <i>J</i> = 9.0Hz), 7.73(1H, d, <i>J</i> = 9.0Hz), 8.04(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 8.66(1H, s).
3-110	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.28(3H, s), 3.84(3H, s), 7.07(1H, d, <i>J</i> = 2.0Hz), 7.11(1H, dd, <i>J</i> = 2.5Hz, <i>J</i> = 8.5Hz), 7.25-7.29(2H, m), 7.39-7.41(1H, m), 7.49(1H, d, <i>J</i> = 8.5Hz), 7.55(1H, dd, <i>J</i> = 2.5Hz, <i>J</i> = 8.5Hz), 8.02(1H, d, <i>J</i> = 2.5Hz), 8.09-8.10(1H, m), 8.59(1H, s).

Dưới đây, các ví dụ thử nghiệm theo sáng chế được mô tả.

VÍ DỤ THỬ NGHIỆM 1

Đất ruộng ở vùng cao được đưa vào trong chậu 1/300.000 hecta, và hạt của các thực vật khác nhau được gieo. Khi các thực vật tương ứng đã đạt tới giai đoạn lá định trước ((1) cỏ lông vọc nước (*Echinochloa crus-galli* L.): giai đoạn 0,5 đến 2,9 lá, (2) cỏ túc nhỏ (*Digitaria sanguinalis* L.): giai đoạn 0,5 đến 3,0 lá, (3) cỏ đuôi chồn xanh (*Setaria viridis* L.): giai đoạn 0,5 đến 3,2 lá, (4) yến mạch dại (*Avena fatua* L.): giai đoạn 0,4 đến 1,2 lá, (5) cỏ mạch đen của Ý (*Lolium multiflorum* Lam.): giai đoạn 0,4 đến 2,0 lá, (6) rau dền rể đỏ (*Amaranthus retroflexus* L.): giai đoạn lá mầm đến giai đoạn 2,2 lá, (7) cây lúa (*Oryza sativa* L.): giai đoạn 0,2 đến 2,7 lá, (8) cây ngô (*Zea mays* L.): giai đoạn 1,7 đến 3,6 lá, (9) cây lúa mì (*Triticum aestivum* L.): giai đoạn 1,3 đến 2,3 lá, (10) cây đậu tương (*Glycine max* Merr.): giai đoạn lá sơ cấp), bột để thấm ướt hoặc chế phẩm đặc dễ nhũ hóa của các hợp chất theo sáng chế được bào chế theo phương pháp bào chế thông thường, được cân khối lượng sao cho đạt được lượng hoạt chất đã định, và được pha loãng bằng nước với lượng tương ứng với 1.000 lit trên mỗi

1 hecta (chứa 0,1% thể tích của chất phân tán nông nghiệp (chất hoạt động bề mặt WK do MARUWA BIOCHEMICAL Co., Ltd. sản xuất)), và từ đó, các dung dịch phun chuẩn bị được dùng để xử lý lá bằng bình phun nhỏ.

Vào ngày thứ 14 sau khi dùng, tình trạng sinh trưởng của các thực vật tương ứng được quan sát bằng mắt thường, và tác dụng diệt cỏ được đánh giá bằng mức độ ức chế phát triển (%) từ 0 (tương đương với vùng không được xử lý) đến 100 (chết hoàn toàn). Các kết quả được thể hiện trong bảng 5.

Bảng 5

Hợp chất	Lượng hoạt chất	Mức độ ức chế phát triển (%)											
		Cỏ lồng vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc đuôi chồn xanh	Yến mạch dại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rể đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương		
số	g/ha												
1-1	31	100	95	99	98	98	10	80	90	65	0		
1-2	31	100	99	99	95	99	0	10	95	20	0		
1-3	31	100	99	100	98	98	0	75	99	15	15		
1-4	31	99	95	100	99	95	10	20	93	10	35		
1-10	31	70	90	90	20	0	0	0	60	0	20		
1-13	31	100	95	100	75	70	0	40	88	20	0		
1-14	31	98	93	98	95	85	0	80	70	0	0		
1-40	31	100	99	100	98	100	40	80	100	93	10		
1-41	31	100	99	100	99	100	10	80	98	98	0		
1-42	31	100	100	100	100	100	10	88	100	100	10		
1-45	31	100	100	100	100	100	10	99	100	99	10		
1-46	31	100	100	100	100	99	30	80	98	98	0		
1-59	31	100	100	100	99	98	0	40	98	93	0		

1-62	31	100	100	100	100	99	99	98	0	88	100	90	0
1-65	31	99	100	100	100	100	98	98	0	60	98	10	0
1-95	31	100	100	100	100	100	99	95	0	80	100	45	0
1-98	31	88	30	60	60	65	78	78	0	0	80	20	10
1-130	31	100	99	99	99	98	93	93	0	30	95	80	0
1-131	31	100	100	93	93	93	83	83	0	30	80	60	0
1-132	31	100	100	100	100	98	98	98	0	88	99	98	20
1-133	31	88	0	30	30	40	0	0	0	0	0	0	0
1-134	31	98	99	100	100	99	98	98	0	88	93	98	0
1-135	31	100	99	100	100	100	100	100	0	90	98	100	0
1-136	31	100	98	100	100	98	98	98	0	25	99	90	0
1-137	31	100	75	80	80	93	93	93	0	85	95	85	15

Bảng 5 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)									
		Cỏ lồng vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ đuôi chồn xanh	Yến mạch dại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rễ đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
1-138	31	100	85	60	90	70	0	0	83	83	30
1-139	31	100	80	60	88	98	0	20	50	45	15
1-142	31	90	88	40	85	20	20	15	50	20	40
1-144	31	30	10	60	10	0	0	20	10	0	20
1-145	31	93	90	70	40	20	0	0	40	50	35
1-146	31	98	90	93	88	70	0	0	75	85	10
1-149	31	100	98	100	85	83	10	70	50	20	0
1-150	31	100	100	100	100	100	0	88	95	99	0
1-151	31	99	99	95	95	83	30	65	35	10	0
1-152	31	100	99	100	100	99	0	85	90	88	30
1-157	31	100	100	100	100	99	0	80	100	93	20
1-162	31	100	100	100	100	99	0	93	98	99	0
1-163	31	100	100	100	100	99	0	75	100	60	0

1-165	31	100	100	100	100	100	100	100	100	0	83	100	95	0
1-166	31	95	99	100	100	93	30	0	10	0	10	98	10	15
1-167	31	98	99	100	100	98	93	0	35	0	100	100	40	10
1-169	31	90	95	99	99	90	90	20	10	0	98	0	0	0
1-170	31	95	99	98	40	30	10	0	40	0	99	0	0	0
1-171	31	100	100	100	100	100	100	0	85	0	100	83	0	0
1-173	31	100	100	100	100	100	95	0	60	0	99	35	0	0
1-174	31	100	100	100	100	100	93	0	20	0	100	75	0	0
2-2	31	70	70	75	10	10	20	0	0	0	10	0	0	0
2-3	31	85	15	85	35	20	0	0	10	0	10	30	10	0
2-5	31	100	99	100	95	95	20	0	85	0	75	40	0	0
2-7	31	100	99	100	98	100	50	0	100	0	10	98	0	0
2-8	31	100	100	99	65	83	0	0	15	0	10	25	0	0
2-10	31	99	40	99	10	10	0	0	0	0	0	10	30	0
2-59	31	99	83	83	95	90	0	0	90	0	90	40	0	0
2-60	31	88	85	75	50	40	0	0	50	0	50	0	0	0
2-61	31	99	78	95	98	93	0	0	90	0	95	95	0	0
2-63	31	100	98	100	100	100	0	0	90	0	100	95	0	0

Bảng 5 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)									
		Cỏ lồng vực nước	Cỏ nhỏ	túc đuôi chồn xanh	Cỏ Yến mạch dại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rễ đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
2-83	31	99	98	99	88	80	0	0	60	10	0
2-84	31	99	100	100	99	93	0	0	90	0	0
2-89	31	95	65	93	0	20	0	10	30	0	20
2-90	31	90	0	75	0	10	0	0	0	20	0
2-92	31	80	30	10	50	78	20	0	80	0	0
2-93	31	100	99	100	30	88	20	0	95	0	10
2-94	31	100	0	100	40	20	0	0	0	0	0
2-101	31	75	85	88	70	50	0	0	80	0	20
2-104	31	85	60	70	35	30	10	10	10	20	10
2-105	31	90	95	90	75	80	0	35	65	25	25
2-108	500	100	85	95	50	10	0	93	10	50	20
2-112	500	99	98	100	90	90	20	93	93	80	0
2-114	31	98	10	80	83	80	0	10	75	25	0

2-115	31	100	95	98	100	98	100	98	20	78	98	83	0
2-116	31	100	100	100	100	100	100	100	0	90	100	99	10
2-118	31	85	40	60	88	70	0	80	20	50	10	0	10
2-121	31	100	98	100	98	98	20	90	20	78	0	0	0
2-122	31	100	90	95	60	75	0	0	85	60	40	0	0
2-123	31	90	10	83	10	0	0	50	0	90	0	0	0
2-124	31	85	80	80	0	0	30	0	0	0	0	0	0
2-125	31	100	90	50	90	93	0	70	90	50	0	0	0
2-126	31	100	100	100	100	100	0	93	100	99	20	0	0
2-127	31	100	30	100	90	78	0	70	0	100	0	0	0
2-128	31	85	83	75	88	93	0	45	75	60	0	0	0
2-131	31	85	65	98	50	78	10	10	40	45	10	0	0
2-132	31	90	50	80	90	78	-	40	0	70	30	0	0
2-135	31	93	90	95	90	95	0	80	93	88	0	0	0
2-138	31	90	65	65	20	20	0	35	15	10	0	0	0
2-139	31	90	98	90	98	98	0	98	65	95	10	0	0
2-142	500	100	83	90	50	0	0	80	20	50	25	0	0
2-146	500	99	95	95	80	20	0	75	85	50	10	0	0

Bảng 5 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất	Mức độ ức chế phát triển (%)											
		Cỏ lòng vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc đuôi chồn xanh	Yến mạch đại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rể đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương		
số	g/ha												
2-150	31	100	60	98	50	98	0	30	30	75	0		
2-152	31	85	20	85	0	35	0	78	0	75	0		
2-154	31	80	10	60	0	10	0	0	0	0	10		
2-155	31	78	40	60	0	10	0	0	10	25	0		
2-156	31	98	93	98	10	30	0	0	0	0	0		
2-158	31	100	93	98	65	65	0	60	0	93	0		
2-159	31	100	100	100	100	100	0	100	100	99	35		
2-160	31	100	100	100	100	100	0	100	100	99	30		
2-161	31	100	83	100	99	99	40	99	90	85	0		
2-162	31	100	100	99	100	100	10	100	90	99	0		
2-163	31	100	95	100	75	88	0	35	80	10	35		
2-164	31	100	100	100	90	95	0	83	90	10	40		
2-165	31	100	70	88	0	0	0	25	35	0	25		

2-166	31	100	88	100	40	99	20	88	80	10	30
2-167	31	100	99	100	45	80	0	60	90	25	30
2-169	31	100	100	100	88	85	0	83	98	85	40
2-171	31	99	90	93	0	30	0	25	80	0	30
2-172	31	100	98	99	40	35	0	30	98	10	40
2-173	31	99	95	88	35	90	0	85	65	75	0
2-174	31	100	93	93	88	95	-	93	95	93	0
2-175	31	98	98	99	10	50	0	0	95	0	10
2-176	31	100	99	100	25	85	0	10	80	0	0
2-177	31	100	100	99	98	98	0	65	83	90	30
2-178	31	100	100	100	95	98	0	15	83	75	0
2-179	31	88	98	100	0	0	0	0	75	10	0
2-181	31	100	99	100	83	93	0	10	70	35	0
2-183	31	95	98	98	95	98	0	90	50	90	30
2-184	31	95	95	99	30	35	0	60	40	10	30
2-185	31	93	85	88	0	0	0	0	10	0	20
2-186	31	90	99	99	25	0	0	0	98	0	15
2-193	31	70	90	93	0	0	0	0	65	0	0

Bảng 5 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)									
		Cỏ lông vực nước	Cỏ nhỏ	túc đuôi chồn xanh	Cỏ Yến mạch dại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rễ đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
2-194	31	85	90	90	10	35	0	0	60	0	10
2-195	31	93	90	93	90	85	0	40	83	35	30
3-1	31	100	99	100	98	100	50	100	10	98	0
3-33	31	100	99	100	100	98	0	93	10	100	30
3-34	31	100	95	100	95	99	0	90	15	90	30
3-35	31	100	99	99	100	99	10	95	60	100	25
3-36	31	100	99	99	99	99	0	90	40	99	40
3-37	31	100	99	100	98	99	10	95	45	99	30
3-38	31	100	100	100	98	99	20	80	30	98	25
3-39	31	88	0	95	0	0	0	0	15	0	0
3-40	31	99	99	99	98	98	0	85	25	98	10
3-41	31	100	95	99	98	99	20	10	20	99	0
3-42	31	100	20	98	100	95	10	60	30	20	0

3-43	31	100	98	100	98	0	80	40	95	10
3-44	31	100	99	100	100	0	85	20	85	10
3-45	31	100	99	99	100	0	98	45	98	25
3-46	31	100	99	100	100	20	98	50	98	35
3-47	31	100	99	100	99	0	30	40	98	20
3-48	31	100	98	100	75	0	0	25	90	10
3-49	31	99	100	100	98	0	50	45	99	20
3-50	31	100	98	100	98	0	60	15	99	10
3-51	31	99	100	100	99	0	60	60	99	30
3-52	31	100	95	100	20	0	70	35	10	20
3-53	31	100	93	95	60	0	40	0	0	0
3-54	31	100	98	100	78	0	20	30	93	20
3-55	31	98	99	100	99	0	90	50	98	30
3-56	31	98	99	100	99	0	0	40	93	30
3-57	31	100	99	100	99	0	0	25	95	25
3-58	31	100	99	100	95	0	50	55	98	25
3-59	31	99	98	100	93	0	0	0	65	20
3-60	31	99	95	100	98	0	10	20	93	10

Bảng 5 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)									
		Cỏ lông vực nước	Cỏ nhỏ	túc đuôi chồn xanh	Cỏ Yến mạch dại	Cỏ mạch đen của Ý	Rau dền rễ đỏ	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
3-61	31	0	20	60	0	0	0	0	20	0	0
3-62	31	100	99	99	99	93	0	0	60	90	20
3-63	31	100	98	100	98	90	0	0	40	83	0
3-64	31	98	90	100	83	85	0	0	50	60	0
3-65	31	100	83	99	75	85	0	0	40	98	10
3-66	31	10	20	35	50	40	0	0	25	10	0
3-67	31	100	95	100	100	99	0	40	50	99	0
3-68	31	100	95	100	90	83	0	0	20	30	0
3-69	31	100	95	100	99	99	0	30	20	98	0
3-70	31	98	88	98	60	40	0	0	30	0	10
3-71	31	100	90	100	99	98	0	15	0	95	0
3-74	31	93	20	95	25	0	0	0	20	0	0
3-75	31	99	95	99	98	98	0	0	10	95	0

3-76	31	93	30	93	0	10	0	0	0	0	0	0
3-77	31	100	90	100	60	85	0	0	30	25	0	0
3-78	31	99	93	98	40	10	0	0	0	0	0	0
3-79	31	100	98	100	98	99	0	99	50	93	30	0
3-80	31	100	95	99	99	93	0	0	25	90	25	0
3-81	31	99	93	99	95	95	0	0	0	25	0	0
3-82	31	100	98	100	98	98	10	93	35	98	0	0
3-96	31	100	100	100	98	99	0	95	20	95	0	0
3-97	31	100	100	100	100	99	0	75	15	95	0	0

VÍ DỤ THỬ NGHIỆM 2

Đất ruộng ở vùng cao được đưa vào trong chậu 1/300.000 hecta, và hạt của các thực vật khác nhau (có lồng vực nước (*Echinochloa crus-galli* L.), cỏ túc nhỏ (*Digitaria sanguinalis* L.), cỏ đuôi chồn xanh (*Setaria viridis* L.), rau dền rể đỏ (*Amaranthus retroflexus* L.), rau mác gai (*Sida spinosa* L.), cây cối xay Ấn độ (*Abutilon theophrasti* MEDIC.), cây lúa (*Oryza sativa* L.), cây ngô (*Zea mays* L.), cây lúa mì (*Triticum aestivum* L.), cây đậu tương (*Glycine max* Merr.)) được gieo. Vào ngày sau khi gieo, bột dễ thấm ướt hoặc chế phẩm đặc dễ nhũ hóa của các hợp chất theo sáng chế được bào chế theo phương pháp bào chế thông thường, được cân khối lượng sao cho đạt được lượng hoạt chất đã định, và được pha loãng bằng nước với lượng tương ứng với 1.000 lit trên mỗi 1 hecta, tiếp theo dùng cho đất bằng bình phun nhỏ.

Vào ngày thứ 14 sau khi dùng, tình trạng sinh trưởng của các thực vật tương ứng được quan sát bằng mắt thường, và tác dụng diệt cỏ được đánh giá bằng mức độ ức chế phát triển (%) từ 0 (tương đương với vùng không được xử lý) đến 100 (chết hoàn toàn). Các kết quả được thể hiện trong bảng 6.

Bảng 6

Hợp chất	Lượng hoạt chất	Mức độ ức chế phát triển (%)										
		Cỏ lồng vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc chồn xanh	Rau dền rễ đỏ	Rau mác gai	Cây xay độ	Cây cối Ấn	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
số												
	1-1	31	85	100	0	0	0	0	20	50	0	0
	1-2	31	98	99	-	30	0	0	20	20	10	0
	1-3	31	100	100	0	0	0	0	80	90	35	0
	1-4	31	100	99	0	0	0	0	40	0	0	0
	1-14	31	99	83	93	0	0	0	0	0	0	0
	1-40	31	100	100	100	0	0	0	60	30	0	0
	1-41	31	100	100	100	0	0	0	0	20	0	0
	1-42	31	100	100	100	0	0	0	80	40	0	0
	1-45	31	100	100	100	0	0	0	30	88	20	0
	1-46	31	80	90	99	0	0	0	30	0	30	0
	1-59	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0
	1-62	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0
	1-65	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0

1-95	31	100	100	100	100	0	0	0	0	0	50	80	0	0
1-98	31	95		20	30	0	0	0	0	35	0	0	0	0
1-132	31	99		93	98	0	0	0	0	0	10	0	0	0
1-149	31	98		99	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-150	31	99		98	98	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-152	31	80		35	85	0	0	0	0	0	10	0	10	0
1-157	31	100		99	100	0	0	0	0	40	0	0	0	30
1-162	31	100		100	100	0	0	0	0	95	40	0	0	0
1-163	31	100		100	100	0	0	0	0	40	80	0	0	0
1-165	31	99		100	95	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-166	31	80		95	80	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-167	31	85		100	95	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-170	31	75		93	98	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-171	31	100		100	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-173	31	100		100	100	0	0	0	0	60	50	0	0	0

Bảng 6 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)											
		Cỏ lông vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc	Cỏ đuôi chồn xanh	Rau dền rễ đỏ	Rau mác gai	Cây xay độ	Cây cối Án	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
1-174	31	100	100		100	0	0	0		0	0	0	0
2-3	31	50	80		98	0	0	0		20	0	0	0
2-5	31	100	100		100	0	0	0		80	65	30	0
2-7	31	99	99		100	0	0	0		40	20	25	0
2-8	31	100	95		100	0	0	0		20	0	0	0
2-10	31	95	50		85	0	0	0		40	30	0	0
2-59	31	75	70		40	0	0	0		0	0	0	0
2-61	31	65	50		98	0	0	0		0	0	0	0
2-63	31	100	100		98	0	0	0		15	0	0	0
2-83	31	99	100		100	100	75	0		30	0	0	0
2-84	31	100	100		100	0	0	0		60	0	0	0
2-89	31	95	30		50	0	0	0		30	0	0	0
2-93	31	100	99		99	0	0	0		0	0	0	0

[illegible]

Bảng 6 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)											
		Cỏ lồng vực nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc	Cỏ đuôi chồn xanh	Rau dền rể đỏ	Rau mác gai	Cây xay độ	cối Ân	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
số													
2-162	31	90	20		20	-	-	0		0	0	20	0
2-163	31	98	98		99	0	0	0		20	15	20	0
2-164	31	50	98		90	0	0	0		0	0	0	0
2-165	31	99	98		99	0	0	0		70	0	0	0
2-166	31	99	95		100	0	0	0		70	0	0	0
2-167	31	40	99		100	-	0	0		0	0	0	0
2-169	31	70	98		98	0	0	0		0	0	0	0
2-171	31	65	30		75	0	0	0		0	0	0	0
2-172	31	60	30		20	0	0	0		0	0	0	0
2-173	31	65	80		10	0	0	0		20	10	0	0
2-174	31	20	80		0	0	0	0		0	20	0	0
2-175	31	100	95		99	0	0	0		90	30	0	0
2-176	31	100	98		99	0	0	0		60	0	0	0

2-177	31	90	98	90	0	0	0	0	30	0	0	0
2-181	31	90	0	40	0	0	0	20	0	0	0	0
2-194	31	95	83	99	0	0	0	30	40	0	0	0
2-195	31	98	98	99	0	0	0	20	0	0	0	0
3-1	31	99	99	100	0	0	0	40	20	25	0	0
3-33	31	100	99	100	0	0	0	60	20	40	0	0
3-34	31	99	65	98	0	0	0	20	20	0	0	0
3-40	31	90	10	40	0	0	0	10	10	0	0	0
3-45	31	95	20	85	0	0	0	25	0	0	0	0
3-48	31	98	60	100	0	0	0	0	0	20	0	0
3-49	31	95	20	85	0	0	0	0	0	10	0	0
3-50	31	99	80	98	0	0	0	0	0	0	0	0
3-51	31	99	95	100	0	0	0	0	0	0	0	0
3-52	31	99	95	100	0	0	0	0	0	0	0	0
3-54	31	99	30	98	0	0	0	0	0	0	0	0
3-55	31	80	30	60	0	0	0	0	0	0	0	0
3-57	31	90	30	95	0	0	0	0	40	0	30	0
3-58	31	85	10	75	0	0	0	0	0	0	0	0

Bảng 6 (tiếp theo)

Hợp chất	Lượng hoạt chất g/ha	Mức độ ức chế phát triển (%)											
		Cỏ lông nước	Cỏ nhỏ	Cỏ túc	Cỏ đuôi chồn xanh	Rau dền rễ đỏ	Rau mác gai	Cây xay độ	Cây cối Án	Cây lúa	Cây ngô	Cây lúa mì	Cây đậu tương
3-59	31	85	0		80	0	0	0		0	0	0	0
3-64	31	98	50		93	0	0	0		0	0	0	0
3-69	31	93	30		95	0	0	0		0	0	0	0
3-79	31	100	95		100	0	0	0		0	0	0	0
3-82	31	99	85		99	0	0	0		0	0	0	0
3-96	31	99	98		85	0	0	0		75	0	0	0
3-97	31	95	93		99	0	0	0		20	0	20	0

Dưới đây, các ví dụ chế phẩm theo sáng chế sẽ được mô tả.

Ví dụ chế phẩm 1

- | | |
|--|----------------------|
| (1) Hợp chất theo sáng chế | 75 phần khối lượng |
| (2) Geropon T-77 (tên thương mại, do Rhone-Poulenc sản xuất) | 14,5 phần khối lượng |
| (3) NaCl | 10 phần khối lượng |
| (4) Dextrin | 0,5 phần khối lượng |

Các thành phần (1) đến (4) nêu trên được đưa vào máy tạo hạt trộn tốc độ cao, và nước với lượng 20% được bổ sung thêm vào đó, tiếp theo tạo hạt và làm khô để thu được hạt được phân tán bởi nước.

Ví dụ chế phẩm 2

- | | |
|---|--------------------|
| (1) Kaolin | 78 phần khối lượng |
| (2) Laveline FAN (tên thương mại, do DAI-ICHI KOGYO SEIYAKU CO., LTD. sản xuất) | 2 phần khối lượng |
| (3) Sorpol 5039 (tên thương mại, do TOHO Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) | 5 phần khối lượng |
| (4) Carplex (tên thương mại, do DSL. Japan Co., Ltd. sản xuất) | 15 phần khối lượng |

Hỗn hợp gồm các thành phần (1) đến (4) nêu trên và hợp chất theo sáng chế được trộn theo tỷ lệ khối lượng là 9:1 để thu được bột dễ thấm ướt.

Ví dụ chế phẩm 3

- | | |
|--|--------------------|
| (1) Hi-Filler No. 10 (tên thương mại, do Matsumura Sangyo Co., Ltd. sản xuất) | 33 phần khối lượng |
| (2) Sorpol 5050 (tên thương mại, do TOHO Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) | 3 phần khối lượng |
| (3) Sorpol 5073 (tên thương mại, do TOHO Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) | 4 phần khối lượng |
| (4) Hợp chất theo sáng chế | 60 phần khối lượng |

Các thành phần (1) đến (4) nêu trên được trộn để thu được bột dễ thấm ướt.

Ví dụ chế phẩm 4

- | | |
|----------------------------|--------------------|
| (1) Hợp chất theo sáng chế | 4 phần khối lượng |
| (2) Bentonit | 30 phần khối lượng |

- | | |
|--|----------------------|
| (3) Canxi cacbonat | 61,5 phần khối lượng |
| (4) Toxanon GR-31A (tên thương mại, do Sanyo Chemical Industries Co., Ltd. sản xuất) | 3 phần khối lượng |
| (5) Canxi lignin sulfonat | 1,5 phần khối lượng |

Thành phần (1) đã được nghiền thành bột và các thành phần (2) và (3) được trộn một cách sơ bộ, và sau đó, các thành phần (4) và (5) và nước được bổ sung vào đó và được trộn. Hỗn hợp này được ép đùn và được tạo hạt, tiếp theo làm khô và rây để thu được hạt.

Ví dụ chế phẩm 5

- | | |
|--|--------------------|
| (1) Hợp chất theo sáng chế | 30 phần khối lượng |
| (2) Zeeklite (tên thương mại, do Zeeklite Co., Ltd. sản xuất) | 60 phần khối lượng |
| (3) New Kalgen WG-1 (tên thương mại, do TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD. sản xuất) | 5 phần khối lượng |
| (4) New Kalgen FS-7 (tên thương mại, do TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD. sản xuất) | 5 phần khối lượng |

Các thành phần (1), (2) và (3) được trộn và được cho đi qua máy nghiền, và sau đó, thành phần (4) được bổ sung vào đó. Hỗn hợp này được nhào và sau đó, được ép đùn và tạo hạt, tiếp theo làm khô và rây để thu được hạt để phân tán trong nước.

Ví dụ chế phẩm 6

- | | |
|--|--------------------|
| (1) Hợp chất theo sáng chế | 28 phần khối lượng |
| (2) Sôpropyl FL (tên thương mại, do Rhone-Poulenc sản xuất) | 2 phần khối lượng |
| (3) Sorpol 335 (tên thương mại, do TOHO Chemical Industry Co., Ltd. sản xuất) | 1 phần khối lượng |
| (4) IP solvent 1620 (tên thương mại, do Idemitsu Petrochemical Co., Ltd. sản xuất) | 32 phần khối lượng |
| (5) Etylen glycol | 6 phần khối lượng |
| (6) Nước | 31 phần khối lượng |

Các thành phần (1) đến (6) nêu trên được trộn và được nghiền thành bột bằng máy nghiền ướt (Dyno-mill) để thu được huyền phù đặc trên cơ sở nước.

Sáng chế không bị giới hạn ở các phương án được mô tả trên đây theo cách bắt

kỹ, và các cái biến khác nhau là có thể thực hiện trong phạm vi bảo hộ của sáng chế. Ngoài ra, các phương án có thể thu được bằng cách kết hợp một cách thích hợp các biện pháp kỹ thuật được bộc lộ lần lượt trong các phương án khác nhau sẽ thuộc phạm vi của sáng chế. Hơn nữa, bằng cách kết hợp các biện pháp kỹ thuật được bộc lộ lần lượt trong các phương án tương ứng, có thể tạo ra dấu hiệu kỹ thuật mới.

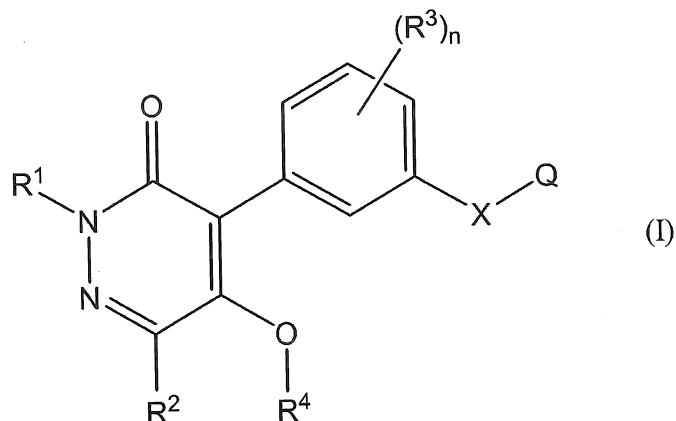
Khả năng áp dụng công nghiệp

Hợp chất theo sáng chế thể hiện sự cải thiện rõ rệt về hoạt tính diệt cỏ đối với các thực vật không mong muốn, so với các hợp chất thông thường tương tự. Hơn nữa, nó có độ an toàn cao đối với cây trồng. Do đó, hợp chất pyridazinon theo sáng chế hoặc muối của nó, có tác dụng diệt cỏ tuyệt vời, khi được sử dụng làm hoạt chất của thuốc diệt cỏ. Phạm vi ứng dụng của nó bao trùm các lĩnh vực khác nhau bao gồm lĩnh vực nông nghiệp như ruộng lúa, ruộng khô, ruộng vườn, ruộng dâu tằm, v.v. và lĩnh vực phi nông nghiệp như rừng núi, đường nông nghiệp, sân, nơi trồng cây, v.v.. Phương pháp dùng của nó cũng có thể được chọn một cách thích hợp để sử dụng, trong số các biện pháp xử lý đất, xử lý lá, xử lý việc tưới, v.v..

Toàn bộ nội dung của đơn sáng chế Nhật Bản số 2016-067797 được nộp vào ngày 30 tháng ba năm 2016 bao gồm bản mô tả, yêu cầu bảo hộ, hình vẽ và tóm tắt được đưa vào bản mô tả này bằng cách viện dẫn.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất pyridazinon được biểu thị bằng công thức (I) hoặc muối của nó:



trong đó X là -O-, -S-, -SO-, -SO₂- hoặc -N(Y)-;

Q là aryl một vòng mà có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, aryl hai vòng có thể được thế bởi Z, hoặc heteroaryl hai vòng có thể được thế bởi Z;

Y là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

R¹ là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, haloalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkylthioalkyl, alkylsulfinylalkyl, alkylsulfonylalkyl, dialkylaminoalkyl, alkoxyalkyl, amino, nitro, alkylcarbonylalkyl, alkoxyalkyl hoặc hydroxycarbonylalkyl;

R² là nguyên tử hydro, alkyl, haloalkyl, xycloalkyl, halogen, alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl hoặc xyano;

R³ là halogen, hydroxy, alkyl, haloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, alkoxy, haloalkoxy, nitro, amino, alkylcarbonyl hoặc xycloalkyl;

R⁴ là nguyên tử hydro, alkyl, -C(O)R⁶, -C(S)R⁶, -SR⁷, -SOR⁷, -SO₂R⁷, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkoxyalkyl, -CH(J¹)OCOOJ², alkylcarbonylalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylcarbonylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkenyl, alkoxyalkoxyalkyl, alkoxyalkyl, alkynyl, xyanoalkyl, haloalkoxyalkyl hoặc dialkylaminoalkyl;

R⁶ là alkyl, alkoxy, morpholino, dialkylamino, (aryl một vòng có thể được thế bởi Z)(alkyl)amino, xycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, haloalkyl, alkylthio, alkenyl, alkynyl, alkoxyalkyl, xycloalkylalkyl, xyanoalkyl,

alkoxyalkoxyalkyl, aryl một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, arylalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxy một vòng có thể được thế bởi Z, arylthio một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxyalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, arylthioalkyl một vòng có thể được thế bởi Z, alkoxycarbonyl, alkoxyalkoxy, haloalkoxy, haloalkoxyalkoxy, alkylthioalkoxy, xycloalkoxyalkoxy, arylalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, aryloxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryloxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, alkenyloxyalkoxy, alkoxyalkoxyalkoxy, alkynyloxy, alkenyloxy, haloalkenyl, dialkylaminoalkyl, alkylthioalkoxyalkoxy, xycloalkylalkoxy, xycloalkylalkoxyalkoxy, arylalkoxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z, heteroarylalkoxyalkoxy một vòng có thể được thế bởi Z hoặc xycloalkoxy có thể được thế bởi Z;

R^7 là alkyl, haloalkyl, xycloalkyl hoặc aryl một vòng có thể được thế bởi Z;

Z là halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, xycloalkyl, xyano, nitro, $-C(O)OR^5$, formyl, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, $-CH=NOJ^3$ hoặc dialkylaminocarbonyl;

R^5 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

J^1 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

J^2 là alkyl hoặc xycloalkyl;

J^3 là nguyên tử hydro, alkylcarbonyl hoặc alkoxyalkyl; và

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

2. Hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó theo điểm 1, trong đó trong công thức (I),

X là $-O-$, $-S-$, $-SO-$, $-SO_2-$ hoặc $-N(Y)-$;

Q là aryl một vòng có thể được thế bởi Z, heteroaryl một vòng có thể được thế bởi Z, aryl hai vòng có thể được thế bởi Z hoặc heteroaryl hai vòng có thể được thế bởi Z;

Y là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

Z là halogen, alkyl, haloalkyl, xyano, nitro hoặc $-C(O)OR^5$;

R^1 là alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc xycloalkyl;

R^2 là nguyên tử hydro, alkyl, haloalkyl hoặc xycloalkyl;

R^3 là halogen, alkyl, haloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, alkoxy, haloalkoxy hoặc xycloalkyl;

R^4 là nguyên tử hydro, alkyl, $-C(O)R^6$ hoặc $-SO_2R^7$;

R^5 là nguyên tử hydro hoặc alkyl;

R^6 là alkyl, alkoxy hoặc morpholino;

R^7 là alkyl; và

n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 4.

3. Thuốc diệt cỏ chứa hoạt chất là hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó như được xác định ở điểm 1 hoặc 2.
4. Phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn hoặc ức chế sự sinh trưởng của chúng bao gồm việc đưa hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó như được xác định ở điểm 1 hoặc 2 với lượng có tác dụng diệt cỏ vào thực vật không mong muốn hoặc nơi mà chúng phát triển.
5. Phương pháp theo điểm 4, trong đó lượng dùng của hợp chất pyridazinon hoặc muối của nó nằm trong khoảng từ 0,1 đến 5.000 g/ha.