

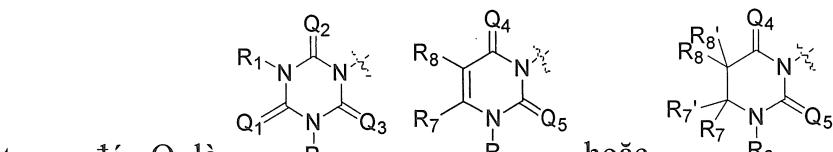
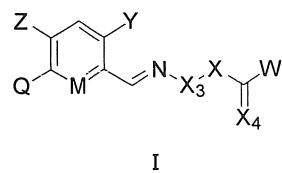


(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11) 
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ
(51)^{2020.01} C07D 239/22; C07D 409/10; C07D 1-0049015
239/54; A01N 43/54 (13) B

-
- (21) 1-2021-03420 (22) 11/12/2020
(86) PCT/CN2020/135784 11/12/2020 (87) WO2021/139482A1 15/07/2021
(30) 202010028477.6 11/01/2020 CN; 202010077193 6 24/01/2020 CN; 202010117877.4
25/02/2020 CN; 202010281666.4 10/04/2020 CN
(45) 25/07/2025 448 (43) 25/10/2021 403A
(73) QINGDAO KINGAGROOT CHEMICAL COMPOUND CO., LTD. (CN)
No.53, Qinglonghe Road, Huangdao District, Qingdao, Shandong 266000, China
(72) LIAN, Lei (CN); HUA, Rongbao (CN); PENG, Xuegang (CN); ZHAO, De (CN);
CUI, Qi (CN).
(74) Công ty TNHH Lê & Lê (LE & LE)
-
- (54) HỢP CHẤT IMINOARYL ĐƯỢC THẾ DẪN XUẤT BỞI AXIT CARBOXYLIC,
PHƯƠNG PHÁP ĐIỀU CHẾ HỢP CHẤT NÀY, CHẾ PHẨM DIỆT CỎ VÀ
PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT THỰC VẬT KHÔNG MONG MUỐN

(21) 1-2021-03420

(57) Sáng chế đề cập đến lĩnh vực công nghệ thuốc trừ sâu, và đặc biệt là một loại hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic, phương pháp điều chế, chế phẩm diệt cỏ và phương pháp kiểm soát thực vật không mong muốn. Hợp chất, như được thể hiện trong công thức tổng quát I:



trong đó, Q là , hoặc ; Y là halogen, haloalkyl hoặc xyano; Z là halogen; M là CH hoặc N; W là OX_5 , SX_5 hoặc $\text{N}(\text{X}_5)_2$; X là $-\text{CX}_1\text{X}_2-(\text{alkyl})_n-$, $-\text{alkyl}-\text{CX}_1\text{X}_2-(\text{alkyl})_n-$ hoặc $-(\text{CH}_2)_r-$; X_3 và X_4 mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-alkyl, v.v.. Hợp chất này có hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời chống lại cỏ dại gramine, cỏ dại lá rộng, cỏ dại họ cyperaceae, v.v. ngay cả với tỷ lệ sử dụng thấp, và có tính chọn lọc cao đối với cây trồng.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế liên quan đến lĩnh vực công nghệ thuốc trừ sâu, và đặc biệt là loại hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic, phương pháp điều chế, chế phẩm diệt cỏ và việc sử dụng chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

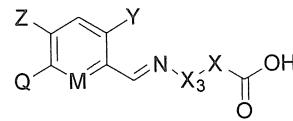
Kiểm soát cỏ dại là một trong những măt xích quan trọng nhất trong quá trình đạt được hiệu quả nông nghiệp cao. Nhiều loại thuốc diệt cỏ có sẵn trên thị trường, ví dụ, các công bố đơn sáng chế số WO00/50409 v.v. bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức tổng quát 1-aryl-4-thiotriazin làm thuốc diệt cỏ, WO95/06641 bộc lộ hợp chất của các 1-amino-3-phenyluracil được thể với hoạt tính diệt cỏ, WO95/25725 mô tả hợp chất pyrimidinyl aryl keton oxim với các hoạt tính diệt cỏ và diệt côn trùng. Tuy nhiên, đặc tính diệt cỏ của các hợp chất đã biết này chống lại thực vật có hại và khả năng chọn lọc của chúng đối với cây trồng là không hoàn toàn thỏa đáng. Và các nhà khoa học vẫn cần liên tục nghiên cứu và phát triển các loại thuốc diệt cỏ mới có hiệu quả cao, an toàn, kinh tế và các phương thức tác động khác nhau do các vấn đề như thị trường ngày càng phát triển, tính kháng cỏ dại, tuổi thọ và tính kinh tế của thuốc trừ sâu cũng như mối quan tâm ngày càng tăng của con người về môi trường.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế liên quan đến lĩnh vực công nghệ thuốc trừ sâu, và đặc biệt là một loại hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic, phương pháp điều chế, chế phẩm diệt cỏ và việc sử dụng chúng. Hợp chất này có hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời chống lại cỏ dại gramine, cỏ dại lá rộng, cỏ dại họ cyperaceae, v.v. ngay cả với tỷ lệ sử dụng thấp, và có tính chọn lọc cao đối với cây trồng.

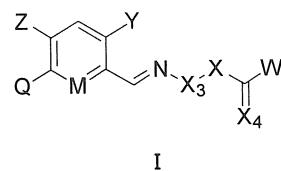
Giải pháp kỹ thuật được áp dụng theo sáng chế như sau:

Hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic, được biểu diễn bởi công thức tổng quát I':

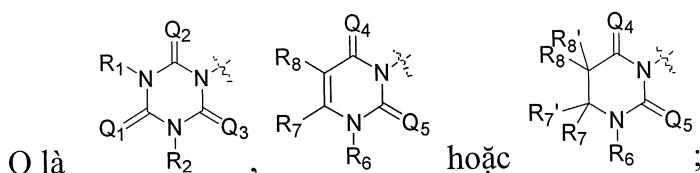


Trong đó, dẫn xuất đề cập đến một dẫn xuất thích hợp cho hóa học nông nghiệp, được sử dụng để mô tả sự thay đổi của nhóm chức axit carboxylic theo sáng chế, và nó đề cập đến este, axylhydrazit, imidat, thioimidat, amidin, amit, orthoester, axyl xyanit, axyl halogenua, thioeste, thionoeste, dithioleste, nitril bất kỳ hoặc dẫn xuất axit carboxylic bất kỳ khác được biết đến trong lĩnh vực kỹ thuật.

Vụ thể, hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic, được biểu diễn bởi công thức tổng quát I:



Trong các công thức tổng quát I' và I nêu trên,



Y là halogen, haloalkyl hoặc xyano;

Z là halogen;

M là CH hoặc N;

W là OX_5 , SX_5 hoặc $\text{N}(\text{X}_5)_2$;

X là $-\text{CX}_1\text{X}_2-(\text{alkyl})_n-$, $-\text{alkyl}-\text{CX}_1\text{X}_2-(\text{alkyl})_n-$ hoặc $-(\text{CH}_2)_r-$;

X_1 , X_2 mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyanoalkyl, hydroxyalkyl, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylamino, haloalkoxy, haloalkylthio, alkyl carbonyl, alkoxy carbonyl, alkoxyalkyl, haloalkoxyalkyl, alkylaminoalkyl, aryl, heteroxycycl, arylalkyl hoặc heteroxyclic alkyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi halogen, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “aryl”, “heteroxycycl”, “arylalkyl” và “heteroxyclic alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi ít nhất một nhóm

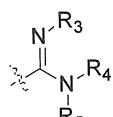
được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X₁, X₂ không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

X₃, X₄ mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-alkyl;

X₅ là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkenyl, heteroxycycll, aryl, ---O---X_{11} , ---S---X_{11} , ---C(=O)---X_{11} , ---S(=O)---X_{12} , $\text{---S(=O)---O---X}_{12}$, $\text{---C(=O)---O---X}_{11}$, $\text{---C(=O)---O---X}_{11}$, ---N---X_{13} , ---N---X_{14} , $\text{---C(=O)---N---X}_{13}$, $\text{---C(=O)---N---X}_{14}$, $\text{---S(=O)---N---X}_{13}$, $\text{---S(=O)---N---X}_{14}$, hoặc $\text{---C(=O)---N---X}_{14}$, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, xycloalkyl, xycloalkenyl, heteroxycycll, aryl, ---O---X_{11} , ---S---X_{11} , ---C(=O)---X_{11} , $\text{---O---C(=O)---X}_{11}$, $\text{---O---C(=O)---O---X}_{11}$, ---N---X_{13} , ---N---X_{14} , $\text{---C(=O)---N---X}_{13}$, $\text{---C(=O)---N---X}_{14}$ và ---O---N---X_{14} , “xycloalkyl”, “xycloalkenyl”, “heteroxycycll” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất; hoặc N(X₅)₂ là ---N---X_{14} hoặc heteroxycycll không được thê hoặc được thê bằng nguyên tử nitơ ở vị trí 1;

Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅ mỗi nhóm độc lập là O hoặc S;

R₁, R₂ mỗi nhóm độc lập là H, xyano, alkyl, alkenyl, alkynyl, formyl alkyl, xyanoalkyl, amino, aminoalkyl, amino carbonyl, amino carbonylalkyl, aminosulfonyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, heteroxycycll, heteroxyclic alkyl, aryl,



arylalkyl, R₄R₅N-(CO)-NR₃- , R₃-S(O)_m-(alkyl)_n- , R₃-O-(alkyl)_n- , R₃-(CO)-(alkyl)_n- , R₃-O-(alkyl)_n-(CO)- , R₃-(CO)-O-(alkyl)_n- , R₃-S-(CO)-(alkyl)_n- , R₃-O-(CO)-alkyl- hoặc R₃-O-(CO)-O-alkyl- , trong đó,

“alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

“amino”, “aminoalkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonylalkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc hai nhóm được chọn từ -R₁₁, -OR₁₁, -(CO)R₁₁, -(CO)OR₁₁, -alkyl-(CO)OR₁₁, -(SO₂)R₁₁, -(SO₂)OR₁₁, -alkyl-(SO₂)R₁₁, -(CO)N(R₁₂)₂ và -(SO₂)N(R₁₂)₂,

“cycloalkyl”, “cycloalkylalkyl”, “cycloalkenyl”, “cycloalkenyl alkyl”, “heteroxycycl”, “heterocyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, heterocycloalkyl, cycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₆ là alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc xyano, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, alkoxy và alkoxy carbonyl;

R₇, R₇', R₈, R₈' mỗi nhóm độc lập là H, alkyl, halogen, haloalkyl, amino, hydroxyalkyl hoặc alkoxy;

X₁₁ độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, cycloalkenyl, cycloalkenyl alkyl, heteroxycycl, heterocyclic

alkyl, aryl, arylalkyl hoặc , trong đó, “cycloalkyl”, “cycloalkylalkyl”, “cycloalkenyl”, “cycloalkenyl alkyl”, “heteroxycycl”, “heterocyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, heterocycloalkyl, cycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề

trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, heteroxycycl, heteroxyclic alkyl, aryl hoặc arylalkyl, trong đó, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₃, X₁₄ mỗi nhom độc lập là H, halogen, xyano, alkoxy, alkoxyalkyl, alkyl carbonyl, alkoxy carbonyl, alkylsulfonyl, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, aryl, arylalkyl, heteroxycycl hoặc heteroxyclic alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành cấu trúc xyclic không được thê hoặc được thê, hoặc N, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành heteroxycycl không được thê hoặc được thê bằng nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, the “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “aryl”, “arylalkyl”, “heteroxycycl” và “heteroxyclic alkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₃, R₄, R₅ mỗi nhom độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenylalkyl, heteroxycycl, heteroxyclic alkyl, aryl hoặc arylalkyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenylalkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R_{11} độc lập là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenylalkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, alkyl, haloalkyl, alkoxy carbonyl, alkylthio, alkylsulfonyl, alkoxy và haloalkoxy;

R_{12} độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxy, alkylsulfonyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl hoặc xycloalkenylalkyl, hoặc $N(R_{12})_2$ in $-(CO)N(R_{12})_2$ hoặc $-(SO_2)N(R_{12})_2$ mỗi nhóm độc lập là heteroxcycll không được thê hoặc được thê bằng nguyên tử nitơ ở vị trí 1;

R_{13} độc lập là H, alkyl, haloalkyl, phenyl hoặc phenyl được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, alkyl, haloalkyl, alkoxy carbonyl, alkylthio, alkylsulfonyl, alkoxy và haloalkoxy;

r là số nguyên bằng 2 hoặc lớn hơn; m là 0, 1 hoặc 2; n độc lập là 0 hoặc 1.

Tốt hơn, Y là halogen, halo C1-C8 alkyl hoặc xyano;

X là $-CX_1X_2-(C1-C8\text{ alkyl})_n-$, $-(C1-C8\text{ alkyl})-CX_1X_2-(C1-C8\text{ alkyl})_n-$ hoặc $-(CH_2)_r-$;

X_1 , X_2 mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C1-C8 alkyl, hydroxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylamino, halo C1-C8 alkoxy, halo C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkyl carbonyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkylamino C1-C8 alkyl, aryl, heteroxcycll, aryl C1-C8 alkyl hoặc heteroxcycll C1-C8 alkyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “aryl”, “heteroxcycll”, “aryl C1-C8 alkyl” và “heteroxcycll C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê bởi C1-C8 alkyl, $-OR_{13}$, $-SR_{13}$, $-(CO)OR_{13}$, $-(SO_2)R_{13}$, $-N(R_{13})_2$ và $-O-(C1-C8\text{ alkyl})-(CO)OR_{13}$, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với $-OCH_2CH_2-$ hoặc $-OCH_2O-$ được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X_1 , X_2 không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

X_3, X_4 mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-(C1-C8)alkyl;

X_5 là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8

xycloalkenyl, heteroxcycll, aryl, $\text{O}-X_{11}$, $\text{S}-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-X_{11}$, $\text{S}(=\text{O})-X_{12}$, $\text{S}(=\text{O})_2-O-X_{12}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$, $\text{N}(X_{13})-$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(X_{13})-$, $\text{S}(=\text{O})-\text{N}(X_{13})-$, $\text{N}(X_{14})=X_{13}$ hoặc $\text{N}(X_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8

xycloalkenyl, heteroxcycll, aryl, $\text{O}-X_{11}$, $\text{S}-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{O}-X_{11}$, $\text{N}(X_{13})-$, $\text{N}(X_{14})=X_{13}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(X_{13})-$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(X_{14})-$ và $\text{O}-\text{N}(X_{14})=X_{13}$, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “heteroxcycll” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhât;

hoặc N(X₅)₂ là $\text{N}(X_{14})=X_{13}$ hoặc heteroxcycll N , ,  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo và C1-C8 alkyl;

R₁, R₂ mỗi nhóm độc lập là H, xyano, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, formyl C1-C8 alkyl, xyano C1-C8 alkyl, amino, amino C1-C8 alkyl, amino carbonyl, amino carbonyl C1-C8 alkyl, aminosulfonyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxcycll, heteroxcycll C1-C8

alkyl, aryl, aryl C1-C8 alkyl, R₄R₅N-(CO)-NR₃- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-S(O)_m-(C1-C8 alkyl)_n- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-O-(C1-C8 alkyl)_n- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-(CO)-(C1-C8 alkyl)_n- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-O-(C1-C8 alkyl)_n-(CO)- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-(CO)-O-(C1-C8 alkyl)_n- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-S-(CO)-(C1-C8 alkyl)_n- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, R₃-O-(CO)-(C1-C8 alkyl)- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$ hoặc R₃-O-(CO)-O-(C1-C8 alkyl)- $\text{N}(\text{R}_3)=\text{N}(\text{R}_4)-\text{R}_5$, trong đó,

“C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

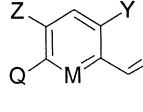
“amino”, “amino C1-C8 alkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonyl C1-C8 alkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc hai nhóm được chọn từ -R₁₁, -OR₁₁, -(CO)R₁₁, -(CO)OR₁₁, -(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₁, -(SO₂)R₁₁, -(SO₂)OR₁₁, -(C1-C8 alkyl)-(SO₂)R₁₁, -(CO)N(R₁₂)₂ và -(SO₂)N(R₁₂)₂,

“C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₆ là C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl hoặc xyano, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, C1-C8 alkoxy và C1-C8 alkoxy carbonyl;

R₇, R_{7'}, R₈, R_{8'} mỗi nhóm độc lập là H, C1-C8 alkyl, halogen, halo C1-C8 alkyl, amino, hydroxy C1-C8 alkyl hoặc C1-C8 alkoxy;

X₁₁ độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C8

alkyl, aryl, aryl C1-C8 alkyl hoặc , trong đó, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃,

hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thế hoặc không được thế bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxcycll, heteroxcycll C1-C8 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C8 alkyl, trong đó, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxcycll”, “heteroxcycll C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thế bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thế hoặc không được thế bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₃, X₁₄ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkyl carbonyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkylalkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, aryl, aryl C1-C8 alkyl, heteroxcycll hoặc heteroxcycll C1-C8 alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành carboxycll có 5~8 cạnh hoặc heteroxcycll chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nito, hoặc N, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành heteroxcycll với nguyên tử nito ở vị trí 1, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi halogen, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “aryl”, “aryl C1-C8 alkyl”, “heteroxcycll” và “heteroxcycll C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thế bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thế hoặc không được thế bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất, “carboxycll có 5~8 cạnh hoặc heteroxcycll chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nito” không được thế hoặc được thế bởi 1-4 nhóm được chọn từ C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc cùng với aryl hoặc heteroxcycll tạo thành một vòng hợp nhất, “heteroxcycll với nguyên tử nito ở vị trí 1” không được thế hoặc được thế bởi ít nhất

một nhóm được chọn từ oxo và C1-C8 alkyl;

R₃, R₄, R₅ mỗi nhóm độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxcycll, heteroxcycll C1-C8 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C8 alkyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi halogen, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxcycll”, “heteroxcycll C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thể bởi C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thể hoặc không được thể bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₁₁ độc lập là C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkoxy và halo C1-C8 alkoxy;

R₁₂ độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkylsulfonyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl hoặc C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, hoặc N(R₁₂)₂ in -(CO)N(R₁₂)₂ hoặc -(SO₂)N(R₁₂)₂ độc lập là heteroxcycll , ,  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 không được thể hoặc được thể bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo và C1-C8 alkyl;

R₁₃ độc lập là H, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, phenyl hoặc phenyl được thể bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkoxy và halo C1-C8 alkoxy;

r là 2, 3, 4, 5 hoặc 6.

Tốt hơn nữa, Y là halogen, halo C1-C6 alkyl hoặc xyano;

X là $-CX_1X_2-(C1-C6\text{ alkyl})_{n-}$, $-(C1-C6\text{ alkyl})-CX_1X_2-(C1-C6\text{ alkyl})_{n-}$ hoặc $-(CH_2)_r-$;

X_1 , X_2 mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C1-C6 alkyl, hydroxy C1-C6 alkyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylamino, halo C1-C6 alkoxy, halo C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl, C1-C6 alkylamino C1-C6 alkyl, aryl, heteroxycycl, aryl C1-C6 alkyl hoặc heteroxycycl C1-C6 alkyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “aryl”, “heteroxycycl”, “aryl C1-C6 alkyl” và “heteroxycycl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, $-OR_{13}$, $-SR_{13}$, $-(CO)OR_{13}$, $-(SO_2)R_{13}$, $-N(R_{13})_2$ và $-O-(C1-C6\text{ alkyl})-(CO)OR_{13}$, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với $-OCH_2CH_2-$ hoặc $-OCH_2O-$ được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X_1 , X_2 không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

X_3 , X_4 mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-(C1-C6)alkyl;

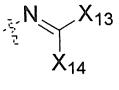
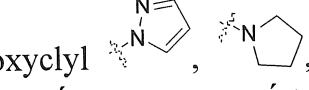
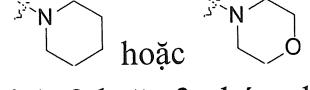
X_5 là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6

xycloalkenyl, heteroxycycl, aryl, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{S} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{S} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{12} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{12} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$,
 $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{13} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{N} \\ | \\ \text{C}-\text{X}_{13} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{N}(\text{X}_{13})-\text{X}_{14} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{N}(\text{X}_{13})-\text{X}_{14} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{N} \\ = \\ \text{C}-\text{X}_{13} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{N} \\ = \\ \text{C}-\text{X}_{14} \end{array}$ hoặc $\begin{array}{c} \text{X}_{13}-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{11} \end{array}$, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6

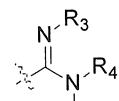
xycloalkenyl, heteroxycycl, aryl, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{S} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$,

$\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{O}-\text{C}-\text{X}_{11} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{N} \\ | \\ \text{C}-\text{X}_{13} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{N} \\ = \\ \text{C}-\text{X}_{13} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{N}(\text{X}_{13})-\text{X}_{14} \end{array}$ và $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C}-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{13} \end{array}$, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “heteroxycycl” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl,

C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, halo C₁-C₆ alkyl, halo C₂-C₆ alkenyl, halo C₂-C₆ alkynyl, halo C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl được thê C₁-C₆ alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C₁-C₆ alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc N(X₅)₂ là  hoặc heteroxcycll  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 that không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C₁-C₆ alkyl;

R₁, R₂ mỗi nhóm độc lập là H, xyano, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, formyl C₁-C₆ alkyl, xyano C₁-C₆ alkyl, amino, amino C₁-C₆ alkyl, amino carbonyl, amino carbonyl C₁-C₆ alkyl, aminosulfonyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkenyl, C₃-C₆ xycloalkenyl C₁-C₆ alkyl, heteroxcycll, heteroxcycll C₁-C₆


alkyl, aryl, aryl C₁-C₆ alkyl, R₄R₅N-(CO)-NR₃-, R₃-S(O)_m-(C₁-C₆ alkyl)_n-, R₃-O-(C₁-C₆ alkyl)_n-, R₃-(CO)-(C₁-C₆ alkyl)_n-, R₃-O-(C₁-C₆ alkyl)_n-(CO)-, R₃-(CO)-O-(C₁-C₆ alkyl)_n-, R₃-S-(CO)-(C₁-C₆ alkyl)_n-, R₃-O-(CO)-(C₁-C₆ alkyl)- hoặc R₃-O-(CO)-O-(C₁-C₆ alkyl)-, trong đó,

“C₁-C₆ alkyl”, “C₂-C₆ alkenyl” và “C₂-C₆ alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

“amino”, “amino C₁-C₆ alkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonyl C₁-C₆ alkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc hai nhóm được chọn từ -R₁₁, -OR₁₁, -(CO)R₁₁, -(CO)OR₁₁, -(C₁-C₆ alkyl)-(CO)OR₁₁, -(SO₂)R₁₁, -(SO₂)OR₁₁, -(C₁-C₆ alkyl)-(SO₂)R₁₁, -(CO)N(R₁₂)₂ và -(SO₂)N(R₁₂)₂,

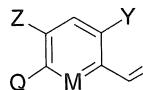
“C₃-C₆ xycloalkyl”, “C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₆ alkyl”, “C₃-C₆ xycloalkenyl”, “C₃-C₆ xycloalkenyl C₁-C₆ alkyl”, “heteroxcycll”, “heteroxcycll C₁-C₆ alkyl”, “aryl” và “aryl C₁-C₆ alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, halo C₁-C₆ alkyl, halo C₂-C₆ alkenyl, halo C₂-C₆ alkynyl, halo C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl được thê C₁-C₆ alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C₁-C₆ alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một

vòng hợp nhất;

R_6 là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl hoặc xyano, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, C1-C6 alkoxy và C1-C6 alkoxy carbonyl;

R_7 , R_7' , R_8 , R_8' mỗi nhóm độc lập là H, C1-C6 alkyl, halogen, halo C1-C6 alkyl, amino, hydroxy C1-C6 alkyl hoặc C1-C6 alkoxy;

X_{11} độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C6

alkyl, aryl, aryl C1-C6 alkyl hoặc , trong đó, the “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X_{12} độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C6 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C6 alkyl, trong đó, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X_{13} , X_{14} mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkoxy C1-C6

alkyl, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkylalkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, aryl, aryl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl hoặc heteroxcyclyl C1-C6 alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành carboxyclyl có 5~8 cạnh hoặc heteroxcyclyl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nito, hoặc N, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau,

tạo thành heteroxcyclyl , ,  hoặc  với nguyên tử nito ở vị trí 1, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “aryl”, “aryl C1-C6 alkyl”, “heteroxcyclyl” và “heteroxcyclyl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất, “carboxyclyl có 5~8 cạnh hoặc heteroxcyclyl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nito” không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc cùng với aryl hoặc

heteroxcyclyl tạo thành một vòng hợp nhất, , ,  và  không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

R₃, R₄, R₅ mỗi nhóm độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C6 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C6 alkyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R_{11} độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkoxy và halo C1-C6 alkoxy;

R_{12} độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkylsulfonyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl hoặc C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, hoặc $N(R_{12})_2$ trong $-(CO)N(R_{12})_2$ hoặc $-(SO_2)N(R_{12})_2$ độc lập là heteroxcyclyl , ,  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

R_{13} độc lập là H, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, phenyl hoặc phenyl được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkoxy và halo C1-C6 alkoxy.

Vẫn tốt hơn nữa, X là $-CX_1X_2-(C1-C3 \text{ alkyl})_n-$, $-(C1-C3 \text{ alkyl})-CX_1X_2-(C1-C3 \text{ alkyl})_n-$ hoặc $-(CH_2)_r-$;

X_1 , X_2 mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C1-C3 alkyl, hydroxy C1-C3 alkyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylamino, halo C1-C6 alkoxy, halo C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkoxy C1-C3 alkyl, halo C1-C6 alkoxy C1-C3 alkyl, C1-C6 alkylamino C1-C3 alkyl, aryl, heteroxcyclyl, aryl C1-C3 alkyl hoặc heteroxcyclyl C1-C3 alkyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “aryl”, “heteroxcyclyl”, “aryl C1-C3 alkyl” và “heteroxcyclyl C1-C3 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, $-OR_{13}$, $-SR_{13}$, $-(CO)OR_{13}$, $-(SO_2)R_{13}$, $-N(R_{13})_2$ và $-O-(C1-C3 \text{ alkyl})-(CO)OR_{13}$, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với $-OCH_2CH_2-$ hoặc $-OCH_2O-$ được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X_1 , X_2 không cùng là hydro ở cùng một

thời điểm;

X_5 là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6

xycloalkenyl, heteroxcyclyl, aryl, $\text{O}-X_{11}$, $\text{S}-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-X_{11}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{O}-X_{12}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{O}-X_{12}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$, $\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, $\text{N}=\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{13}$ hoặc $\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6

xycloalkenyl, heteroxcyclyl, aryl, $\text{O}-X_{11}$, $\text{S}-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-X_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-X_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-X_{11}$, $\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, $\text{N}=\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$ và $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{N}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6

xycloalkenyl”, “heteroxcyclyl” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl,

C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃,

-(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc N(X₅)₂ là $\text{N}=\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{13}$ hoặc heteroxcyclyl N N hoặc N hoặc N với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 mà không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

X₁₁ độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C3

alkyl, aryl, aryl C1-C3 alkyl hoặc , trong đó, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C3 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C3 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6

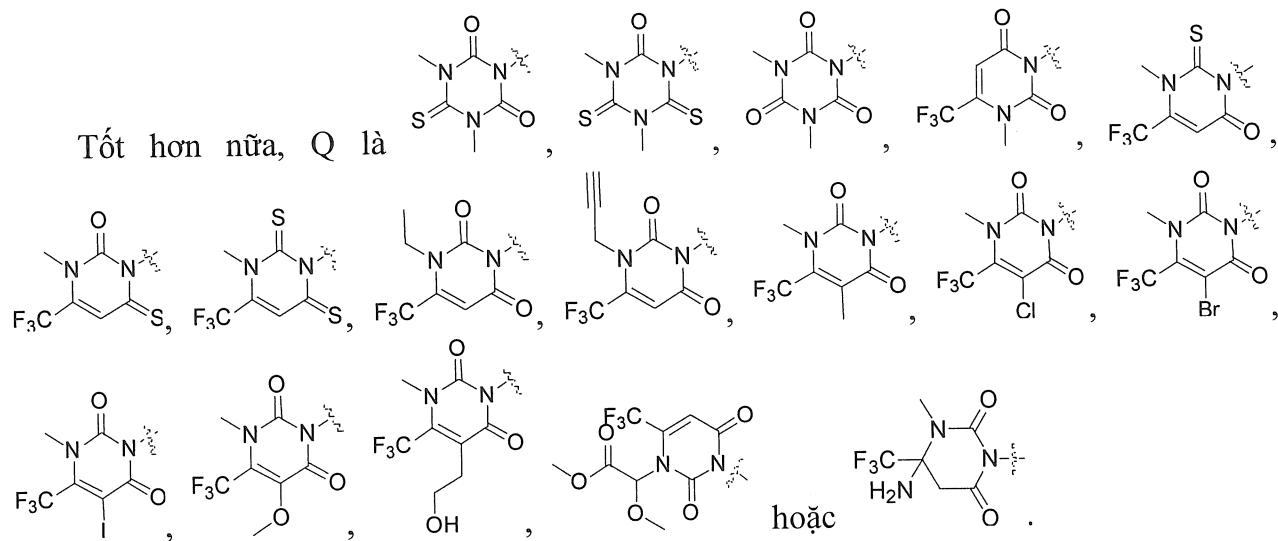
alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, heteroxcycll, heteroxcycll C1-C3 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C3 alkyl, trong đó, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “heteroxcycll”, “heteroxcycll C1-C3 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C3 alkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₃, X₁₄ mỗi nhom độc lập là H, halogen, xyano, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkoxy C1-C3 alkyl, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkylalkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, aryl, aryl C1-C3 alkyl, heteroxcycll hoặc heteroxcycll C1-C3 alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, tạo thành carboxycll bao hòa

có 5~8 cạnh,  hoặc  hoặc N, X₁₃, X₁₄, kết hợp với nhau, form heteroxcycll với nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “aryl”, “aryl C1-C3 alkyl”, “heteroxcycll” và “heteroxcycll C1-C3 alkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- được thê hoặc không được thê bởi halogen tạo

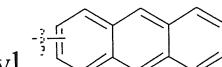
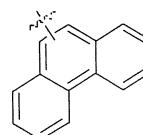
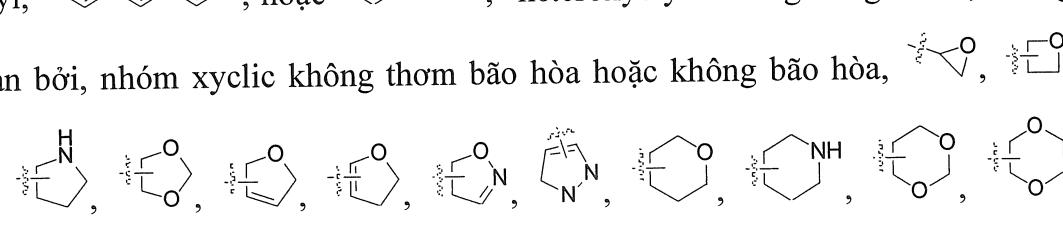
thành một vòng hợp nhất, “carboxycycl bão hòa có 5~8 cạnh,  hoặc ” không được thέ hoặc được thέ bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc cùng với phenyl hoặc thienyl tạo thành một vòng hợp nhất, , ,  và ” không được thέ hoặc được thέ bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl.

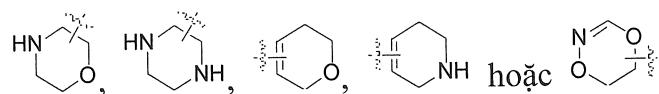
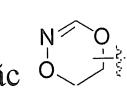


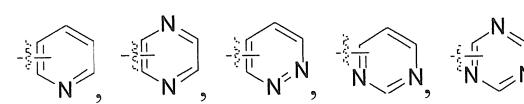
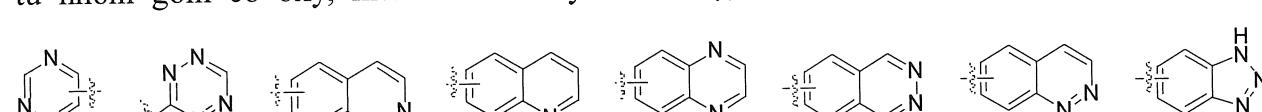
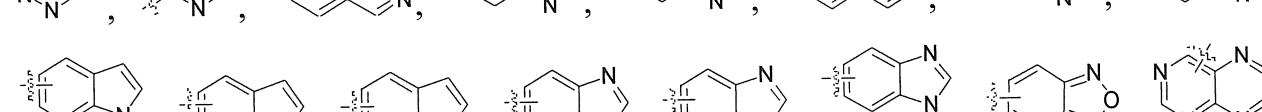
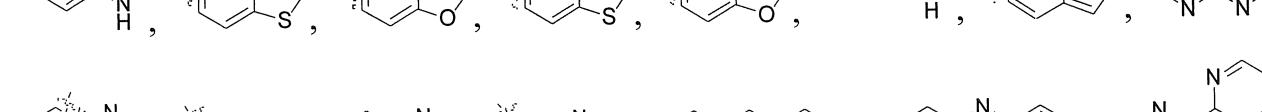
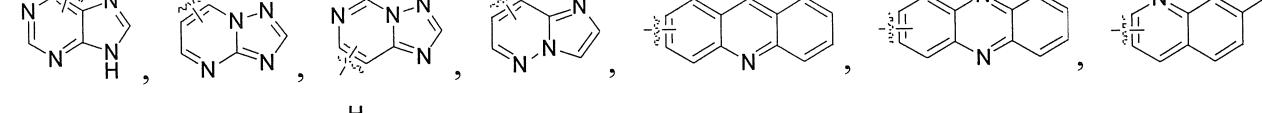
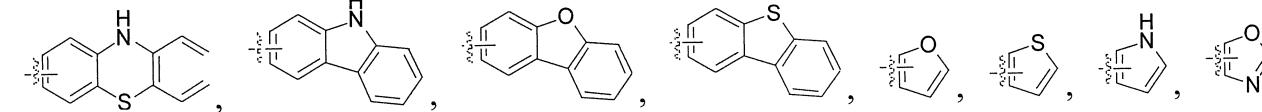
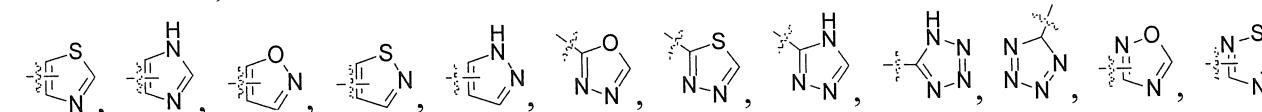
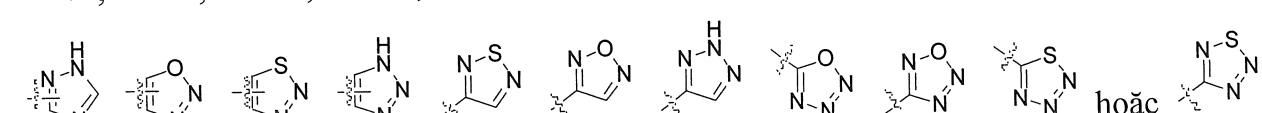
Trong định nghĩa về hợp chất được biểu diễn bởi công thức trên và tất cả các công thức cấu tạo sau đây, các thuật ngữ kỹ thuật được sử dụng, được sử dụng một mình hoặc được sử dụng trong từ ghép, đại diện cho các nhóm thέ sau: alkyl có nhiều hơn hai nguyên tử cacbon có thέ là mạch thẳng hoặc mạch nhánh. Ví dụ, alkyl trong từ ghép "-alkyl-(CO)OR₁₁" có thέ là -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂CH₂CH₂-, -C(CH₃)₂-, và các nhóm tương tự; -(CH₂)_r- có thέ là -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, và các nhóm tương tự. Alkyl là, ví dụ, C₁ alkyl: methyl; C₂ alkyl: ethyl; C₃ alkyl: propyl chẳng hạn n-propyl hoặc isopropyl; C₄ alkyl: butyl chẳng hạn n-butyl, isobutyl, tert-butyl hoặc 2-butyl; C₅ alkyl: pentyl chẳng hạn n-pentyl; C₆ alkyl: hexyl chẳng hạn n-hexyl, isohexyl và 1,3-dimethylbutyl. Tương tự, alkenyl là, ví dụ, vinyl, allyl, 1-metylprop-2-en-1-yl, 2-metylprop-2-en-1-yl, but-2-en-1-yl, butyl-3-en-1-yl, 1-metylbut-3-en-1-yl và 1-metylbut-2-en-1-yl. Alkynyl là, ví dụ, etynyl, propargyl, but-2-yn-1-yl, but-3-yn-1-yl, 1-metylbut-3-yn-1-yl. (Các) đa liên kết có thέ được đặt ở vị trí bất kỳ của mỗi nhóm không no. Xycloalkyl là hệ thống vòng bão hòa carboxylic có, ví dụ, ba đến sáu nguyên tử cacbon, chẳng hạn xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl. Tương tự, xycloalkenyl là monoxycloalkenyl có, ví dụ, ba đến sáu cạnh

vòng cacbon, chẳng hạn xyclopropenyl, xyclobutenyl, xyclopentenyl, và xyclohexenyl, trong đó liên kết đôi có thể ở vị trí bất kỳ. Halogen là flo, clo, brom hoặc iot.

Trừ khi được chỉ định cụ thể, "aryl" của sáng ché gồm có, nhưng không giới hạn bởi,

phenyl, naphthyl, , hoặc ; "heteroxyaryl" không chỉ gồm có, nhưng không giới hạn bởi, nhóm xyclic không thơm bao hòa hoặc không bao hòa, ,

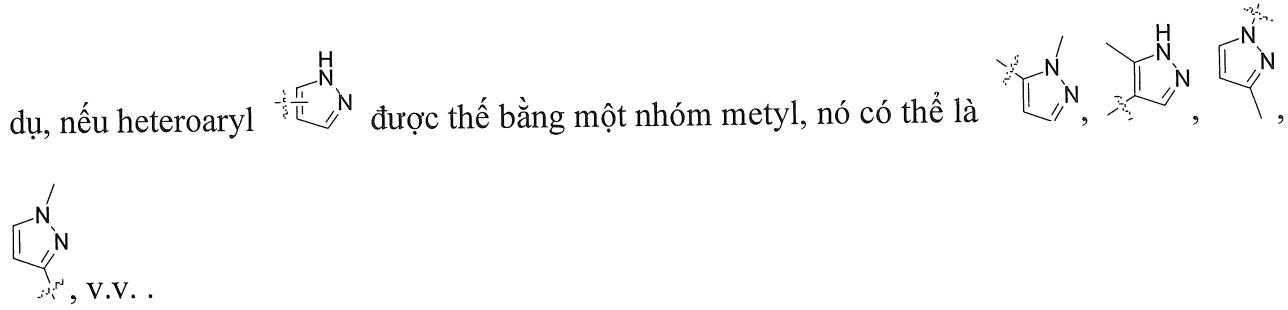
, hoặc , v.v., mà còn bao gồm, nhưng không giới hạn bởi, "heteroaryl", là nhóm xyclic thơm có, ví dụ, 3 đến 6 nguyên tử trên vòng và tùy ý được hợp nhất với vòng benzo, và 1 đến 4 (ví dụ, 1, 2, 3 hoặc 4) dị tố của vòng được chọn

từ nhóm gồm có oxy, nitơ và lưu huỳnh. Ví dụ, , , , , , , , .

Nếu một nhóm được thê bởi một nhóm, cần phải được hiểu là nhóm này được thê bởi một hoặc nhiều nhóm, là các nhóm giống hoặc khác nhau, được chọn từ các nhóm đã được đề cập. Ngoài ra, các ký tự thay thế giống nhau hoặc khác nhau có trong các chất thay thế

giống nhau hoặc khác nhau được chọn độc lập, và có thể giống nhau hoặc khác nhau. Điều này cũng có thể áp dụng cho các hệ thống vòng được tạo thành với các nguyên tử và đơn vị khác nhau. Trong khi đó, phạm vi yêu cầu bảo hộ sẽ loại trừ những hợp chất không ổn định về mặt hóa học trong các điều kiện tiêu chuẩn mà những người có trình độ trung bình trong lĩnh vực này đã biết.

Ngoài ra, trừ khi được định nghĩa cụ thể, thuật ngữ xảy ra trước hoặc sau nhiều nhóm thế xếp cạnh nhau (được phân tách bởi "," hoặc "hoặc") trong sáng chế này có tác dụng giới hạn đối với từng nhóm thế, chẳng hạn cách viết "không được thế hoặc được thế halogen" trong thuật ngữ "-OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thế hoặc được thế halogen" có tác dụng giới hạn trên mỗi nhóm "-OCH₂CH₂" "-OCH₂O-" xảy ra sau đó; "alkylamino" đề cập đến nhóm amino được thế một lần hoặc được thế hai lần bởi alkyl, các nhóm amino được thế khác được định nghĩa tương tự; nhóm (gồm heteroaryl, aryl, v.v.) mà không được chỉ định một vị trí liên kết có thể được gắn ở vị trí bất kỳ, gồm vị trí C hoặc N; nếu nó được thế, nhóm thế có thể được thế ở vị trí bất kỳ miễn là nó tuân theo lý thuyết về liên kết hóa trị. Ví



Cần chỉ rõ rằng, khi nguyên tử cacbon (C*) kiêm kết với X₁ và X₂ trong công thức chung là trung tâm bất đối xứng (tức là, X₁ và X₂ không giống nhau), nó có cấu hình R hoặc cấu hình S, tốt hơn là cấu hình R, và dựa vào hàm lượng của các đồng phân lập thế có cấu hình R và S ở vị trí này, nó có độ tinh khiết hóa học lập thế bằng 60-100% (R), tốt hơn là 70-100% (R), tốt hơn nữa là 80-100% (R), tốt hơn nữa là 90-100% (R), tốt hơn nữa là 95-100% (R). Trong đó, "độ tinh khiết hóa học lập thế" có nghĩa là lượng đồng phân lập thế đã nêu được biểu thị bằng phần trăm của tổng số lượng đồng phân lập thế có tâm bất đối xứng đã cho.

Trong sáng chế này, cấu hình lập thế hóa học tại vị trí được đánh dấu * của công thức I được cố định là (R) chủ yếu theo hệ thống Cahn-Ingold-Prelog, tuy nhiên, đối tượng của sáng chế cũng hướng đến tất cả các đồng phân lập thế ở các vị trí khác được bao gồm bởi công thức I, và hỗn hợp của chúng. Các hợp chất có công thức I này chứa, ví dụ một hoặc nhiều nguyên tử cacbon bất đối xứng bổ sung hoặc các liên kết đối khác không được nêu cụ thể trong công thức I. Điều này sẽ được hiểu rằng sáng chế đề cập đến cả các đồng phân

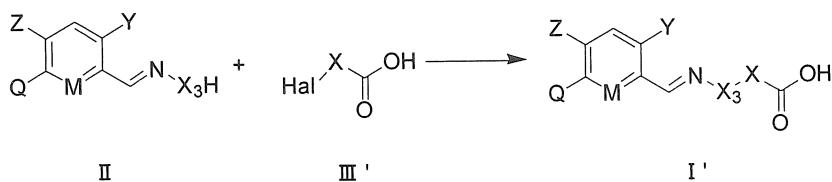
tinh khiết và hỗn hợp được làm giàu nhiều hơn hoặc ít hơn của chúng, trong đó nguyên tử cacbon không đối xứng ở vị trí được đánh dấu * nằm trong cấu hình R hoặc, trong hỗn hợp, hợp chất hoặc các hợp chất có cùng thành phần hóa học có cấu hình R ở vị trí được đánh dấu * hoặc có mặt theo tỷ lệ mà các hợp chất có cấu hình R hiện diện chủ yếu (ít nhất 60% cấu hình R) trong khi (các) nguyên tử cacbon không đối xứng khác có thể có mặt ở dạng raxemic hoặc cũng được phân giải nhiều hơn hoặc ít hơn. Với điều kiện đáp ứng điều kiện cho cấu hình hóa học lập thể tại vị trí được đánh dấu *, các đồng phân lập thể có thể có được xác định theo dạng không gian cụ thể của chúng, chẳng hạn đồng phân đối quang, đồng phân không đối hình, đồng phân Z và E, đều được bao gồm bởi công thức I và có thể thu được bằng các phương pháp thông thường từ hỗn hợp của các chất đồng phân lập thể, hoặc được điều chế bằng các phản ứng chọn lọc lập thể kết hợp với việc sử dụng các nguyên liệu thô tinh khiết về mặt hóa học lập thể.

Sáng chế cũng đề cập đến dạng chất hỗn biến xeto và enol bất kỳ và hỗn hợp và muối của chúng, nếu có mặt các nhóm chức tương ứng.

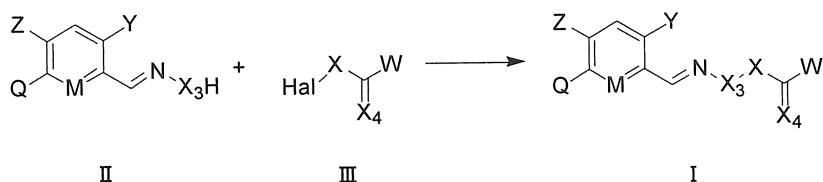
Đồng phân lập thể có thể thu được bằng cách phân giải quang học từ hỗn hợp thu được trong quá trình điều chế. Các chất đồng phân lập thể cũng có thể được điều chế một cách chọn lọc bằng cách sử dụng các phản ứng chọn lọc lập thể và sử dụng các nguyên liệu thô và/hoặc chất trợ có hoạt tính quang học. Nói chung, có thể sử dụng các phương pháp thông thường để phân giải quang học (xem Sách giáo khoa về Hóa lập thể), ví dụ sau các quy trình phân tách hỗn hợp thành các chất đồng phân không đối quang, ví dụ các quy trình vật lý, chẳng hạn quá trình kết tinh, các quy trình sắc ký, cụ thể là sắc ký cột và sắc ký lỏng cao áp, chưng cất, nếu thích hợp trong điều kiện áp suất giảm, chiết xuất và các quy trình khác, có thể tách các hỗn hợp còn lại của các đồng phân đối quang, thông thường bằng cách tách sắc ký trên các pha rắn không đối xứng. Thích hợp cho lượng điều chế hoặc sử dụng ở quy mô công nghiệp là các quá trình như kết tinh các muối đồng phân không đối quang mà có thể thu được từ các hợp chất (I) bằng cách sử dụng các axit hoạt động quang học, và, nếu thích hợp, với điều kiện có mặt các nhóm axit, sử dụng các bazơ hoạt động quang học.

Phương pháp điều chế hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic được đề xuất, phương pháp này bao gồm các bước sau:

cho hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung II và hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung III' tham gia vào phản ứng khử để thu được hợp chất được biểu diễn theo công thức chung I', với phương trình phản ứng hóa học được thể hiện như sau:



hoặc, cho hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung II và hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung III tham gia vào phản ứng khử để thu được hợp chất được biểu diễn theo công thức chung I, với phương trình phản ứng hóa học được thể hiện như sau:

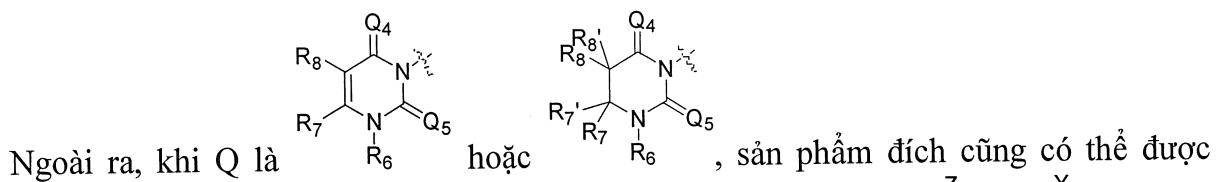


trong đó, Hal là halogen, các nhóm thế khác Q, M, W, Y, Z, X, X₃ và X₄ như được định nghĩa ở trên;

tốt hơn là, phản ứng được thực hiện với sự có mặt của bazơ và dung môi.

Bazơ là ít nhất một chất được chọn từ các bazơ vô cơ (chẳng hạn K₂CO₃, Na₂CO₃, Cs₂CO₃, NaHCO₃, KF, CsF, KOAc, AcONa, K₃PO₄, t-BuONa, EtONa, NaOH, KOH, NaOMe và các chất tương tự) và bazơ hữu cơ (chẳng hạn pyrazol, trietylamin, DIEA và các chất tương tự).

Dung môi là ít nhất một dung môi được chọn từ DMF, metanol, etanol, axetonitril, dicloetan, DMSO, Dioxan, diclometan và etyl axetat.



điều chế bằng cách điều chế sản phẩm trung gian trước tiên

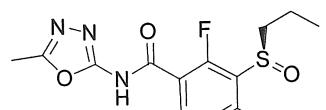
hoặc qua phương pháp trên, và sau đó thực hiện phản ứng thay thế thông thường với R₆-Hal (Hal là halogen, R₆ là alkyl, alkenyl, alkynyl, hoặc haloalkyl).

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm diệt cỏ, bao gồm (i) ít nhất một trong các hợp chất

iminoaryl được thể dễn xuất bởi axit carboxylic với liều lượng diệt cỏ hiệu quả; (thành phần A); tốt hơn là, còn bao gồm (ii) một hoặc nhiều thuốc diệt cỏ khác (thành phần B) với liều lượng diệt cỏ hiệu quả và/hoặc chất an toàn; tốt hơn nữa, còn bao gồm (iii) một chế phẩm phụ trợ được chấp nhận trong hóa nông nghiệp.

Trong một phương án cụ thể, thuốc diệt cỏ khác là một hoặc nhiều thuốc diệt cỏ được chọn từ các hợp chất sau và các axit, muối và este của nó:

(1) chất úc chế HPPD được chọn từ: topramezon(CAS NO.: 210631-68-8), isoxaflutol(CAS NO.: 141112-29-0), tembotrion(CAS NO.: 335104-84-2), tefuryltrion(CAS NO.: 473278-76-1), shuangzuocaotong(CAS NO.: 1622908-18-2), huanbifucaotong(CAS NO.: 1855929-45-1), sanzuohuangcaotong(CAS NO.: 1911613-97-2),



benzuofucaotong(CAS NO.: 1992017-55-6), và

(2) chất úc chế PDS được chọn từ: flurtamон (CAS NO.: 96525-23-4), diflufenican (CAS NO.: 83164-33-4), và picolinafen (CAS NO.: 137641-05-5);

(3) chất úc chế DOXP được chọn từ: clomazon (CAS NO.: 81777-89-1), và bixlozon (CAS NO.: 81777-95-9);

(4) chất úc chế ALS được chọn từ: tribenuron-metyl(CAS NO.: 101200-48-0), thifensulfuron methyl(CAS NO.: 79277-27-3), pyrazosulfuron-etyl(CAS NO.: 93697-74-6), thiencarbazone-metyl(CAS NO.: 317815-83-1), halosulfuron methyl(CAS NO.: 100784-20-1), rimsulfuron(CAS NO.: 122931-48-0), nicosulfuron(CAS NO.: 111991-09-4), và imazamox(CAS NO.: 114311-32-9);

(5) chất úc chế ACCase được chọn từ: clethodim (CAS NO.: 99129-21-2), sethoxydim (CAS NO.: 74051-80-2), và quizalofop-P-metyl (CAS NO.: 100646-51-3);

(6) chất úc chế PPO được chọn từ: oxyfluorfen(CAS NO.: 42874-03-3), oxadiaxon(CAS NO.: 19666-30-9), oxadiargyl(CAS NO.: 39807-15-3), sulfentrazone(CAS NO.: 122836-35-5), pyraclonil(CAS NO.: 158353-15-2), flumioxazin(CAS NO.: 103361-09-7), saflufenacil(CAS NO.: 372137-35-4), carfentrazone-etyl(CAS NO.: 128639-02-1), và trifludimoxazin(CAS NO.: 1258836-72-4);

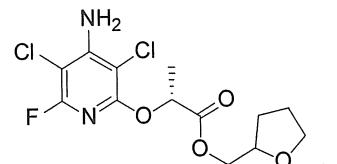
(7) chất úc chế PSII được chọn từ: metribuzin(CAS NO.: 21087-64-9), terbutylazin(CAS NO.: 5915-41-3), amicarbazone(CAS NO.: 129909-90-6),

clotoluron(CAS NO.: 15545-48-9), isoproturon(CAS NO.: 34123-59-6), bromacil(CAS NO.: 314-40-9), propanil(CAS NO.: 709-98-8), desmedipham(CAS NO.: 13684-56-5), phenmedipham(CAS NO.: 13684-63-4), bentazon(CAS NO.: 25057-89-0), và bromoxynil(CAS NO.: 1689-84-5);

(8) chất úc ché tập hợp vi óng được chọn từ: butralin (CAS NO.: 33629-47-9), và pendimethalin (CAS NO.: 40487-42-1);

(9) chất úc ché VLCFA được chọn từ: butaclor (CAS NO.: 23184-66-9), pretilaclor (CAS NO.: 51218-49-6), mefenacet (CAS NO.: 73250-68-7), s-metolaclor (CAS NO.: 87392-12-9), flufenacet (CAS NO.: 142459-58-3), pyroxasulfon (CAS NO.: 447399-55-5), và anilofos (CAS NO.: 764249-01-0);

(10) chất úc ché tống hợp lipid (non-acetyl-CoA carboxylase): prosulfocarb (CAS NO.: 52888-80-9);



(11) chất úc ché tống hợp hormon được chọn từ: floxypyrr(CAS NO.: 69377-81-7), florpyrauxifen benzyl(CAS NO.: 1390661-72-9), halauxifen-metyl(CAS NO.: 943831-98-9), triclopyr(CAS NO.: 55335-06-3), clopyralid(CAS NO.: 1702-17-6), picloram(CAS NO.: 1918-02-1), aminopyralid(CAS NO.: 150114-71-9), dicamba(CAS NO.: 1918-00-9), axit 2-metyl-4-clophenoxyaxetic (CAS NO.: 94-74-6), và axit 2,4-diclophenoxy axetic (CAS NO.: 94-75-7);

(12) chất úc ché EPSPS: glyphosat (CAS NO.: 1071-83-6);

(13) chất úc ché GS được chọn từ: glufosinat amoni (CAS NO.: 77182-82-2), và glufosinat-P-amoni (CAS NO.: 35597-44-5);

(14) chất úc ché PSI được chọn từ: paraquat dicloride (CAS NO.: 1910-42-5), và diquat dibromide monohydrat (CAS NO.: 2764-72-9);

(15) chất úc ché tống hợp xenluloza được chọn từ: triaziflam (CAS NO.: 131475-57-5), và indaziflam (CAS NO.: 950782-86-2);

(16) các chất khác: cinmetylin (CAS NO.: 87818-31-3).

Trong ngữ cảnh của bản mô tả sáng chế, nếu cách viết tắt tên chung của hợp chất hoạt

động được sử dụng, thì trong mỗi trường hợp, nó bao gồm tất cả các dẫn xuất thông thường, chẳng hạn như este và muối, cũng như các đồng phân, đặc biệt là đồng phân quang học, đặc biệt là một hoặc nhiều dạng thương mại có sẵn. Nếu tên chung biểu thị một este hoặc một muối, thì trong mỗi trường hợp, nó cũng bao gồm tất cả các dẫn xuất thông thường khác, chẳng hạn như các este và muối khác, axit tự do và các hợp chất trung tính, cũng như các đồng phân, đặc biệt là các đồng phân quang học, đặc biệt là một hoặc nhiều dạng thương mại có sẵn. Tên hóa học được đặt cho một hợp chất có nghĩa là ít nhất một hợp chất được bao gồm bởi tên chung, và nói chung là hợp chất được ưu tiên. Trong trường hợp các sulfonamit như sulfonylure, các muối cũng bao gồm các muối được tạo thành bằng cách trao đổi các cation với các nguyên tử hydro trong nhóm sulfonamit.

Trong đó, thành phần hoạt tính A so với thành phần hoạt chất B trong chế phẩm diệt cỏ có tỷ lệ khói lượng là 1:1000~1000:1, 1:800~800:1 hoặc 1:600~600:1, tốt hơn là 1:500~500:1, 1:400~400:1 hoặc 1:300~300:1, tốt hơn nữa là 1:200~200:1, 1:100~100:1 hoặc 1:80~80:1, tốt hơn nữa là 1:50~50:1, 1:30~30:1, 1:20~20:1, 1:10~10:1, 1:5~1:1 hoặc 1:1~5:1. Trong một số phương án, các thành phần hoạt tính A và B cùng nhau chiếm 1-95%, tốt hơn là 10-80%, tổng khói lượng của chế phẩm diệt cỏ.

Chất an toàn được chọn từ một hoặc nhiều isoxadifen-etyl (CAS: 163520-33-0), cyprosulfamit (CAS: 221667-31-8), mefenpyr-dietyl (CAS: 135590-91-9), cloquintocet-mexyl (CAS: 99607-70-2), axit gibberellic (CAS: 77-06-5), furilazol (CAS: 121776-33-8), và metcamifen (CAS: 129531-12-0).

Tá dược điều chế bao gồm, ví dụ, chất mang và/hoặc chất hoạt động bì mặt.

Thuật ngữ “chất mang” ở đây đề cập đến chất hữu cơ hoặc vô cơ, tự nhiên hoặc tổng hợp, tạo điều kiện thuận lợi cho việc ứng dụng các thành phần hoạt tính. Nói chung, chất mang là trơ và phải chấp nhận được trong nông nghiệp, đặc biệt là chấp nhận được đối với cây trồng cần xử lý. Chất mang có thể là chất rắn, chẳng hạn như đất sét, silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, silica, nhựa thông, sáp, phân bón rắn và v.v.; hoặc chất lỏng như nước, rượu, xeton, phân đoạn dầu mỏ, hydrocacbon thơm hoặc parafinic, clohydrocacbon, khí hóa lỏng, v.v..

Chất hoạt động bì mặt, có thể là ion hoặc không ion, có thể bao gồm chất nhũ hóa, chất phân tán hoặc chất làm ướt. Các ví dụ có thể được đề cập là muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulfonic, muối của axit phenolsulfonic hoặc của axit naphthalenesulfonic, polymere của etylen oxit với rượu béo hoặc với axit béo hoặc với amin béo hoặc với a phenol được thê (đặc biệt, alkylphenol hoặc arylphenol), sulfosucxinat, dẫn xuất taurin (cụ thể là

alkyl taurat) và este phosphoric của rượu hoặc phenol được polyhydroxyethyl hóa, alkyl sulfonat, alkylaryl sulfonat, alkyl sulfat, laurylate sulfat, sulfat của rượu béo, hexadecanol được sulfat hóa, heptadecanol và octadecanol và polyglycol ete rượu béo được sulfat hóa, và còn gồm chất ngưng tụ của naphtalen hoặc axit naphtalensulfonic với phenol và formaldehyt, polyoxyetylen octylphenyl ete, isoocetylphenol được etoxyl hóa, octylphenol hoặc nonylphenol, polyetylen glycol alkylphenyl ete, polyethylene glycol tributylphenyl ete, polyetylen glycol tristearylphenyl ete, alkylaryl polyete ancol, rượu và chất ngưng tụ của rượu béo/etylen oxit, dầu thầu dầu được etoxyl hóa, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxypropylene được etoxyl hóa, rượu lauryl polyglycol ete acetal, este sorbitol, chất lỏng thải lignin sulfit, protein, protein biến tính, polysaccharit (ví dụ: methylxenluloza), tinh bột biến tính ky nước, rượu polyvinyl, polycarboxylat, polyalkoxylat, polyvinylamin, polyvinylpyrrolidon và copolyme của chúng. Ít nhất một chất hoạt động bề mặt có thể được yêu cầu để tạo điều kiện phân tán thành phần hoạt tính trong nước và ứng dụng thích hợp của chúng cho thực vật.

Chế phẩm cũng có thể bao gồm các thành phần khác nhau, chẳng hạn như chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất làm đặc, chất tạo thixotropic, chất thẩm thấu, chất ổn định, chất tạo chelat, thuốc nhuộm, chất tạo màu hoặc polyme.

Chế phẩm của sáng chế có thể được pha loãng trước khi sử dụng hoặc được sử dụng trực tiếp bởi người sử dụng. Chế phẩm có thể được điều chế thông qua một phương pháp điều chế thông thường, nghĩa là (các) thành phần hoạt tính được trộn với dung môi lỏng hoặc chất mang rắn, và sau đó một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt chẳng hạn chất phân tán, chất ổn định, chất làm ướt, chất kết dính, hoặc chất khử bọt, v.v. được bổ sung vào.

Chế phẩm diệt cỏ có thể ở dạng chế phẩm được lựa chọn từ: hỗn dịch dầu phân tán, huyền phù nước, nhũ tương, bột có thể thẩm ướt, chất cô đặc có thể nhũ hóa, hạt có thể phân tán trong nước (huyền phù khô), dung dịch nước nhũ tương và vi nhũ tương.

Tóm lại, chế phẩm của sáng chế có thể được trộn với các chất phụ gia rắn và lỏng thường được sử dụng trong các chế phẩm của tình trạng kỹ thuật. Khi điều kiện bên ngoài thay đổi, lượng thành phần hoạt tính được sử dụng cũng khác nhau. Các điều kiện bên ngoài là, ví dụ, nhiệt độ, độ ẩm, bản chất của thuốc diệt cỏ được sử dụng, v.v. Nó có thể có một phạm vi thay đổi lớn, ví dụ nằm trong khoảng từ 0,001 đến 1,0 kg/ha, hoặc nhiều chất hoạt tính hơn, nhưng tốt nhất là từ 0,005 đến 750 g/ha, đặc biệt là từ 0,005 đến 500 g/ha.

Phương pháp để kiểm soát một thực vật không mong muốn được đề xuất, bao gồm việc áp dụng ít nhất một trong các hợp chất iminoaryl được dẫn xuất bởi axit cacboxylic hoặc

chế phẩm diệt cỏ với lượng diệt cỏ hiệu quả trên thực vật hoặc trong khu vực của nó hoặc vào đất hoặc nước để kiểm soát sự xuất hiện hoặc phát triển của thực vật không mong muốn.

Sử dụng ít nhất một trong những hợp chất iminoaryl được dẫn xuất bởi axit cacboxylic hoặc chế phẩm diệt cỏ để kiểm soát thực vật không mong muốn; tốt hơn là, hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit cacboxylic được sử dụng để kiểm soát cỏ dại trên cây trồng hữu ích, cây trồng hữu ích là cây trồng biến đổi gen hoặc cây trồng được xử lý bằng kỹ thuật chỉnh sửa bộ gen.

Các hợp chất có công thức I theo sáng chế có hoạt tính diệt cỏ vượt trội đối với một phô rộng các loại cây gây hại một lá mầm và cây hai lá mầm quan trọng về kinh tế (cây không mong muốn). Các hợp chất hoạt tính cũng hoạt động hiệu quả trên cỏ dại lâu năm tạo ra chồi từ thân rễ, gốc rễ hoặc các cơ quan lâu năm khác và rất khó kiểm soát. Trong bối cảnh này, nói chung là không quan trọng cho dù các chất được áp dụng trước khi gieo, trước khi nảy mầm hoặc sau khi nảy mầm. Cụ thể, các ví dụ có thể được đề cập đến một số đại diện của hệ thực vật cỏ dại một lá mầm và cây hai lá mầm có thể được kiểm soát bởi các hợp chất theo sáng chế, mà không hạn chế đối với một số loài nhất định. Ví dụ về các loài cỏ dại mà các hợp chất hoạt động có hiệu quả, từ trong số các loài cây một lá mầm, Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinocloa, Digitaria, Setaria và cả các loài Cyperus từ ngành hàng năm và từ các loài lâu năm Agropyron, Cynodon, Imperata và Sorghum, và cả các loài Cyperus lâu năm.

Trong trường hợp của các loài cỏ dại hai lá mầm, phạm vi tác động mở rộng đến các loài, chẳng hạn như Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Sida, Matricaria và Abutilon trong số các loài hàng năm, và Convolvulus, Cirsium, Rumex và Artemisia trong trường hợp cỏ dại lâu năm. Các hợp chất hoạt động theo sáng chế cũng có tác dụng kiểm soát vượt trội đối với thực vật gây hại xuất hiện trong các điều kiện cụ thể của việc trồng lúa, chẳng hạn như Echinocloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus và Cyperus. Nếu các hợp chất theo sáng chế được áp dụng lên bề mặt đất trước khi nảy mầm, thì cây con cỏ dại hoặc sẽ bị ngăn chặn hoàn toàn khỏi việc mọc lên, hoặc cỏ dại phát triển cho đến khi chúng đạt đến giai đoạn lá mầm nhưng sau đó sự phát triển của chúng ngừng lại, và cuối cùng, sau đó ba đến bốn tuần trôi qua, chúng chết hoàn toàn. Nếu các hợp chất theo sáng chế được áp dụng lên bề mặt đất trước khi nảy mầm, thì cây con cỏ dại hoặc sẽ bị ngăn chặn hoàn toàn khỏi việc mọc lên, hoặc cỏ dại phát triển cho đến khi chúng đạt đến giai đoạn lá mầm nhưng sau đó sự phát triển của chúng ngừng lại, và cuối cùng, sau đó ba đến bốn tuần trôi qua, chúng chết hoàn toàn. Đặc biệt, các hợp chất theo sáng chế thể hiện hoạt tính tuyệt vời chống lại Apera spica venti, Chenopodium album,

Lamium purpureum, Polygonumbtulvulus, Stellaria media, Veronica hederifolia, Veronica persica, Viola tricolor và chông lại các loài Amaranthus, Galium và Kochia.

Các loài thực vật không mong muốn cũng bao gồm các loài cỏ dại kháng hoặc chông lại thuốc diệt cỏ.

Mặc dù các hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời chông lại cỏ dại một lá mầm và cây hai lá mầm, cây trồng của các loại cây trồng quan trọng về kinh tế như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, lúa, ngô, củ cải đường, bông và đậu nành, không bị hư hại tất cả, hoặc chỉ ở một mức độ không đáng kể. Đặc biệt, chúng có khả năng tương thích tuyệt vời với ngũ cốc, chẳng hạn như lúa mì, lúa mạch và ngô, đặc biệt là lúa mì. Vì những lý do này, các hợp chất hiện tại rất thích hợp để kiểm soát một cách có chọn lọc sự phát triển của thực vật không mong muốn trong trồng trọt sử dụng trong nông nghiệp hoặc trong trồng cây cảnh.

Do đặc tính diệt cỏ của chúng, các hợp chất hoạt tính này cũng có thể được sử dụng để kiểm soát thực vật có hại trong các loại cây trồng đã biết hoặc vẫn được phát triển các cây trồng biến đổi gen. Thực vật chuyển gen nói chung có các đặc tính đặc biệt thuận lợi, ví dụ như kháng một số loại thuốc trừ sâu, cụ thể là một số loại thuốc diệt cỏ nhất định, kháng các bệnh thực vật hoặc các sinh vật gây bệnh thực vật, chẳng hạn như một số côn trùng hoặc vi sinh vật như nấm, vi khuẩn hoặc vi rút. Các đặc tính cụ thể khác liên quan đến, ví dụ, số lượng, chất lượng, độ ổn định trong bảo quản, thành phần và các thành phần cụ thể của sản phẩm thu hoạch. Do đó, những thực vật chuyển gen có hàm lượng tinh bột tăng lên hoặc chất lượng tinh bột bị biến đổi hoặc những cây có thành phần axit béo khác của sản phẩm thu hoạch được biết đến.

Việc sử dụng các hợp chất có công thức I theo sáng chế hoặc muối của chúng trong các cây trồng chuyển gen quan trọng về kinh tế của cây trồng hữu ích và cây cảnh, ví dụ như ngũ cốc, chẳng hạn như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, kê, gạo, sắn và ngô, hoặc các loại cây trồng khác như củ cải đường, bông, đậu nành, hạt cải dầu, khoai tây, cà chua, đậu Hà Lan và các loài rau khác được ưu tiên. Các hợp chất có công thức I tốt hơn là có thể được sử dụng làm thuốc diệt cỏ trên cây trồng của những cây có ích có khả năng kháng thuốc hoặc đã được tạo ra khả năng chống chịu bằng kỹ thuật di truyền đối với tác động gây độc của thuốc diệt cỏ.

Các cách thông thường để chuẩn bị các cây mới có các đặc tính thay đổi so với các cây đã biết bao gồm, ví dụ, các phương pháp nhân giống truyền thống và tạo ra các đột biến. Ngoài ra, các cây mới có các đặc tính đã biến đổi có thể được tạo ra với sự hỗ trợ của các phương pháp kỹ thuật di truyền (xem, ví dụ, EP-A 0 221 044, EP-A 0 131 624). Ví dụ, một

số trường hợp đã được mô tả:

- biến đổi gen trong cây trồng để biến đổi tinh bột được tổng hợp trong cây (ví dụ WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
- cây trồng chuyển gen kháng một số loại thuốc diệt cỏ glufosinat- (tham khảo, ví dụ, EP-A 0 242 236, EP-A 0 242 246) hoặc loại glyphosat- (WO 92/00377), hoặc loại sulfonylure- (EP-A 0 257 993, Patnt Mỹ số 5,013,659A),
- cây trồng chuyển gen, ví dụ như bông, có khả năng tạo ra độc tố *Bacillus thuringiensis* (độc tố Bt) giúp cây trồng có khả năng chống lại một số loài gây hại nhất định (EP-A 0 142 924, EP-A 0 193 259),
- cây trồng chuyển gen có thành phần axit béo biến đổi (WO 91/13972).

Về nguyên tắc, nhiều kỹ thuật sinh học phân tử cho phép điều chế các cây chuyển gen mới có đặc tính biến đổi; xem, ví dụ, Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, N.Y.; hoặc Winnacker "Gene und Klon" [Genes và Clons], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, hoặc Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431). Để thực hiện các thao tác kỹ thuật di truyền như vậy, có thể đưa các phân tử axit nucleic vào plasmid cho phép gây đột biến hoặc thay đổi trình tự xảy ra bằng cách tái tổ hợp các trình tự ADN. Bằng cách sử dụng các quy trình tiêu chuẩn nêu trên, có thể, ví dụ, trao đổi bazơ, loại bỏ các trình tự từng phần hoặc bổ sung các trình tự tự nhiên hoặc tổng hợp. Để liên kết các đoạn ADN với nhau, có thể gắn các bộ tiếp hợp hoặc bộ liên kết vào các đoạn.

Các tế bào thực vật có hoạt tính giảm của một sản phẩm gen có thể được điều chế, ví dụ, bằng cách biểu hiện ít nhất một RNA đối kháng thích hợp, một RNA cảm nhận để đạt được hiệu ứng úng úc chế, hoặc bằng cách biểu hiện ít nhất một ribozyme được cấu tạo thích hợp để phân cắt cụ thể các phiên mã của sản phẩm gen nói trên.

Để đạt được mục đích này, có thể sử dụng cả hai phân tử ADN bao gồm toàn bộ trình tự mã hóa của một sản phẩm gen bao gồm bất kỳ trình tự phòng vệ nào có thể có mặt, và các phân tử ADN chỉ bao gồm các phần của trình tự mã hóa, các phần này cần thiết đủ lâu để gây ra hiệu ứng antisense trong tế bào. Cũng có thể sử dụng trình tự ADN có mức độ tương đồng cao với trình tự mã hóa của sản phẩm gen nhưng không hoàn toàn giống nhau.

Khi biểu hiện các phân tử axit nucleic trong thực vật, protein được tổng hợp có thể được định vị trong bất kỳ ngăn màng muốn nào của tế bào thực vật. Tuy nhiên, để đạt được bản địa hóa trong một ngăn nhất định, ví dụ, có thể liên kết vùng mã hóa với các trình tự

ADN đảm bảo bản địa hóa trong một ngăn nhất định. Những trình tự như vậy được biết bởi người có trình độ trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật (xem, ví dụ, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106).

Các tế bào thực vật chuyển gen có thể được tái sinh thành toàn bộ thực vật bằng cách sử dụng các kỹ thuật đã biết. Về nguyên tắc, thực vật chuyển gen có thể là cây của bất kỳ loài thực vật mong muốn nào, tức là cả cây một lá mầm và cây hai lá mầm. Bằng cách này, có thể thu được các cây chuyển gen có đặc tính biến đổi bằng cách biểu hiện quá mức, triệt tiêu hoặc úc chế các gen hoặc trình tự gen tương đồng (= tự nhiên) hoặc bằng cách biểu hiện các gen hoặc trình tự gen dị hợp (= ngoại lai).

Khi sử dụng các hợp chất hoạt động theo sáng chế trong cây trồng chuyển gen, ngoài các tác động chống lại thực vật có hại có thể quan sát thấy ở các cây trồng khác, thường có những ảnh hưởng cụ thể đối với ứng dụng trong cây trồng chuyển gen tương ứng, ví dụ một loại biến đổi hoặc đặc biệt là phổ rộng của cỏ dại có thể được kiểm soát, tỷ lệ ứng dụng được biến đổi có thể được sử dụng cho ứng dụng, tốt nhất là khả năng kết hợp tốt với thuốc diệt cỏ mà cây trồng chuyển gen kháng, và ảnh hưởng đến sự tăng trưởng và năng suất của cây trồng chuyển gen. Do đó, sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng các hợp chất theo sáng chế làm chất diệt cỏ để kiểm soát thực vật có hại ở cây trồng chuyển gen.

Ngoài ra, các chất theo sáng chế có đặc tính điều hòa sinh trưởng vượt trội trong cây trồng. Chúng tham gia vào quá trình trao đổi chất của thực vật một cách điều hòa và điều này có thể được sử dụng để kiểm soát mục tiêu các thành phần của thực vật và để tạo điều kiện thu hoạch, ví dụ như bằng cách kích thích hút ẩm và tăng trưởng kìm hãm. Hơn nữa, chúng cũng thích hợp để điều hòa nói chung và úc chế sự phát triển sinh dưỡng không mong muốn, mà không phá hủy thực vật trong quá trình này. Sự úc chế sự phát triển sinh dưỡng đóng một vai trò quan trọng trong nhiều loại cây một lá mầm và cây hai lá mầm vì nhờ đó mà sự tồn tại có thể giảm, hoặc được ngăn chặn hoàn toàn.

Các hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng trong các chế phẩm thông thường ở dạng bột có thể thẩm ướt, chất cô đặc có thể nhũ hóa, dung dịch có thể phun, bụi hoặc hạt. Do đó, sáng chế cũng đề xuất các chế phẩm diệt cỏ bao gồm các hợp chất có công thức I. Các hợp chất có công thức I có thể được xây dựng theo nhiều cách khác nhau tùy thuộc vào các thông số sinh học và/hoặc hóa - lý phổ biến. Ví dụ về các lựa chọn chế phẩm phù hợp là: bột có thể thẩm ướt (WP), bột có thể hòa tan trong nước (SP), chất cô đặc có thể hòa tan trong nước, chất cô đặc có thể nhũ hóa (EC), nhũ tương (EW), chẳng hạn nhu nhũ tương dầu trong nước và nước trong dầu, dung dịch có thể phun, chất cô đặc huyền phù (SC), chất phân tán dầu (OD), phân tán trên cơ sở dầu hoặc nước, dung dịch có thể trộn lẫn với dầu,

bụi (DP), huyền phù viên nang (CS), chế phẩm ủ hạt, hạt để phát và bón đất, hạt (GR) ở dạng vi hạt, hạt phun, hạt phủ và hạt hấp phụ, hạt phân tán trong nước (WG), hạt hòa tan trong nước (SG), công thức ULV, vi nang và sáp. Các loại chế phẩm riêng lẻ này được biết về nguyên tắc và được mô tả, ví dụ, trong Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th. Edition 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Các chất trợ pha chế cần thiết, chẳng hạn như vật liệu trơ, chất hoạt động bề mặt, dung môi và các chất phụ gia khác, cũng đã được biết đến và được mô tả, ví dụ, trong Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents và Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents và Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley và Wood, "Enyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflüchenaktive Äthylenoxidaddkte" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell. Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986.

Bột thám ướt là các chế phẩm có thể phân tán đồng đều trong nước và chứa, ngoài hợp chất hoạt động và cũng như chất pha loãng hoặc chất trơ, các chất hoạt động bề mặt thuộc loại ion và / hoặc không ion (chất làm ướt, chất phân tán), ví dụ như alkyl phenol được polyetoxyl hóa, rượu béo được polyetoxyl hóa, amin béo được polyetoxyl hóa, rượu béo polyglycol etesulfat, ankansulfonat, alkylbenzen sulfonat, natri ligninsulfonat, natri 2,2'-dinaphthylmetan-6,6'-disulfonat, natri dibutyinaphtalensulfonat hoặc natri oleoylmethyltaurinat khác. Để điều chế bột có thể làm ướt, các hợp chất có hoạt tính diệt cỏ được nghiền mịn, ví dụ như trong các thiết bị thông thường như máy nghiền búa, máy nghiền quạt và máy nghiền khí, và được trộn đồng thời hoặc sau đó với các chất trợ chế phẩm.

Chất cô đặc có thể nhũ hóa được điều chế bằng cách hòa tan hợp chất hoạt động trong dung môi hữu cơ, ví dụ butanol, xyclohexanon, dimetylformamit, xylen hoặc các hợp chất thơm hoặc hydrocacbon hoặc hỗn hợp dung môi có độ sôi tương đối cao khác, với việc bổ sung một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt loại ion và/hoặc không ion (chất nhũ hóa). Ví dụ về chất nhũ hóa có thể được sử dụng là canxi alkylarylsulfonat, chẳng hạn như Ca dodecylbenzensulfonat, hoặc chất nhũ hóa không ion, chẳng hạn như este polyglycol axit béo, este alkylaryl polyglycol, eter rượu béo polyglycol, sản phẩm ngưng tụ oxit propylen-etylen, polyete alkyl, este sorbitan, ví dụ este axit béo sorbitan hoặc este

polyoxyetylen sorbitan, ví dụ este axit béo polyoxyetylen sorbitan.

Bụi thu được bằng cách nghiền hợp chất hoạt tính với các chất rắn đã được phân chia mịn, ví dụ như talc, đất sét tự nhiên, chẳng hạn như cao lanh, bentonit và pyrophyllit, hoặc diatomit. Chất cõ đặc lơ lửng có thể trên cơ sở nước hoặc dầu. Chúng có thể được điều chế, ví dụ, bằng cách xay ướt sử dụng các máy nghiền hạt thông thường trên thị trường, có hoặc không bổ sung các chất hoạt động bề mặt như đã đề cập ở trên, ví dụ, trong trường hợp của các loại chế phẩm khác.

Các nhũ tương, ví dụ nhũ tương dầu trong nước (EW), có thể được điều chế, ví dụ bằng máy khuấy, máy nghiền keo và/hoặc máy trộn tĩnh sử dụng dung môi hữu cơ dạng nước và, nếu muốn, các chất hoạt động bề mặt như đã đề cập ở trên, ví dụ, trong trường hợp của các loại chế phẩm khác.

Hạt có thể được chuẩn bị bằng cách phun hợp chất hoạt tính lên vật liệu tro dạng hạt, hấp phụ hoặc bằng cách áp dụng chất cõ đặc hợp chất hoạt tính lên bề mặt của chất mang như cát, kaolinit hoặc vật liệu tro dạng hạt, bằng chất kết dính, ví dụ rượu polyvinyl, natri polyacrylat hoặc dầu khoáng khác. Các hợp chất hoạt tính thích hợp cũng có thể được tạo hạt theo cách thường dùng để điều chế hạt phân bón, nếu muốn như một hỗn hợp với phân bón. Hạt phân tán trong nước thường được điều chế bằng các quy trình thông thường, chẳng hạn như sấy phun, tạo hạt tầng sôi, tạo hạt dạng đĩa, trộn bằng máy trộn tốc độ cao và dùn ép mà không có vật liệu tro rắn.

Để điều chế các hạt bằng đĩa, tầng sôi, máy dùn và phun, hãy xem các quy trình ví dụ trong "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical và Engineering 1967, pages 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57. Để biết thêm chi tiết về công thức của thuốc bảo vệ thực vật, xem ví dụ G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley và Sons Inc., New York, 1961, pages 81-96 và J. D. Freyer, S. A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103.

Các chế phẩm hóa chất nông nghiệp nói chung chứa từ 0,1 đến 99% khói lượng, đặc biệt từ 0,1 đến 95% khói lượng, hợp chất hoạt động có công thức I. Trong bột có thể làm ướt, nồng độ của hợp chất hoạt động, ví dụ, từ khoảng 10 đến 99%, theo khói lượng, phần còn lại đến 100% khói lượng bao gồm các thành phần chế phẩm thông thường. Trong chất cõ đặc có thể nhũ hóa, nồng độ của hợp chất hoạt động có thể nằm trong khoảng từ 1 đến 90%, tốt nhất là từ 5 đến 80%, tính theo khói lượng. Các chế phẩm ở dạng bụi chứa từ 1 đến 30% khói lượng hợp chất hoạt động, tốt nhất là phô biến nhất từ 5 đến 20% khói lượng hợp chất

hoạt động, trong khi dung dịch dạng xịt chứa từ 0,05 đến 80%, tốt hơn là từ 2 đến 50%, theo khối lượng của hợp chất hoạt động. Trong trường hợp hạt phân tán trong nước, hàm lượng của hợp chất hoạt tính phụ thuộc một phần vào việc hợp chất hoạt động ở dạng lỏng hay dạng rắn và vào các chất trợ tạo hạt, chất độn, v.v. được sử dụng. Trong các hạt phân tán trong nước, hàm lượng của hợp chất hoạt động, ví dụ, nằm trong khoảng từ 1 đến 95% khối lượng, tốt nhất là từ 10 đến 80% khối lượng.

Ngoài ra, các chế phẩm của hợp chất hoạt tính có thể bao gồm chất kết dính, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất thảm thấu, chất bảo quản, chất chống đông, dung môi, chất độn, chất mang, chất tạo màu, chất chống tạo bọt, chất ức chế bay hơi và chất điều chỉnh độ pH và độ nhớt tùy theo từng trường hợp.

Dựa trên những công thức này, người ta cũng có thể tạo ra sự kết hợp với các chất có hoạt tính trừ sâu khác, ví dụ như thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, thuốc diệt cỏ và thuốc diệt nấm, và cũng với chất an toàn, phân bón và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng, ví dụ ở dạng hỗn hợp sẵn sàng hoặc hỗn hợp bé.

Các hợp chất hoạt tính thích hợp có thể được kết hợp với các hợp chất hoạt tính theo sáng chế trong các công thức hỗn hợp hoặc trong hỗn hợp bé trộn, ví dụ, các hợp chất hoạt tính đã biết như được mô tả trong Sổ tay Công nghệ Sản phẩm Mới Thuốc diệt cỏ Thế giới, Nhà xuất bản Khoa học Nông nghiệp và Kỹ thuật Canh tác Trung Quốc, 2010,9 và trong các tài liệu chuyên ngành được nêu trong bản mô tả này. Ví dụ, các hợp chất hoạt tính sau đây có thể được đề cập như là chất diệt cỏ có thể được kết hợp với các hợp chất có công thức I (lưu ý: các hợp chất hoặc được đặt tên bằng "tên chung" theo Tổ chức Quốc tế về Tiêu chuẩn hóa (ISO) hoặc theo tên hóa học, nếu thích hợp, kết hợp với một số mã tùy chỉnh): acetoclor, butaclor, alaclor, propisoclor, metolaclor, s-metolaclor, pretilaclor, propaclor, ethaclor, napropamit, R- napropamit quay trái, propanil, mefenacet, diphenamid, diflufenican, ethaproclor, beflubutamid, bromobutide, dimethenamid, dimethenamid-P, etobenzanid, flufenacet, thenylclor, metazaclor, isoxaben, flamprop-M-metyl, flamprop-M-propyl, allidoclor, pethoxamid, cloranocryl, cyprazine, mefluidide, monalide, delaclor, prynaclor, terbuclor, xylaclor, dimethaclor, cisnilide, trimexaclor, clomeprop, propyzamit, pentanoclor, carbetamit, benzoylprop-etyl, cyprazole, butenaclor, tebutam, benzipram, mogrton, diclofluanid, naproanilide, diethyl-etyl, naptalam, flufenacet, EL-177, benzadox, clorthiamid, clophthalimide, isocarbamit, picolinafen, atrazine, simazine, prometryn, cyanatrym, simetryn, ametryn, propazin, dipropetryn, SSH-108, terbutrym, terbutylazine, triaziflam, cyprazine, progliazine, trietazine, prometon, simeton, aziprotryne, desmetrym, dimethametryn, procyclazine, mesoprazine, sebutylazine, secbumeton, terbumeton, methoprottryne, cyanatrym, ipazine, clorazine, atraton,

pendimethalin, eglinazine, axit cyanuric, indaziflam, clorsulfuron, metsulfuron-metyl, bensulfuron methyl, clorimuron-etil, tribenuron-metyl, thifensulfuron-metyl, pyrazosulfuron-etil, mesosulfuron, iodosulfuron-metyl natri, foramsulfuron, cinosulfuron, triasulfuron, sulfometuron methyl, nicosulfuron, ethametsulfuron-metyl, amidosulfuron, ethoxysulfuron, xyclosulfamuron, rimsulfuron, azimsulfuron, flazasulfuron, monosulfuron, monosulfuron-ester, flucarbazone-natri, flupyrifluron-metyl, halosulfuron-metyl, oxasulfuron, imazosulfuron, primisulfuron, propoxycarbazon, prosulfuron, sulfosulfuron, trifloxysulfuron, triflusulfuron-metyl, tritosulfuron, natri metsulfuron methyl, flucetosulfuron, HNPC-C, orthosulfamuron, propyrisulfuron, metazosulfuron, acifluorfen, fomesafen, lactofen, fluoroglycofen, oxyfluorfen, clornitrofen, aclonifen, ethoxyfen-etil, bifenoxy, nitrofluorfen, clometoxyfen, fluorodifen, fluoronitrofen, furyloxyfen, nitrofen, TOPE, DMNP, PPG1013, AKH-7088, halosafen, clortoluron, isoproturon, linuron, diuron, dymron, fluometuron, benzthiazuron, methabenzthiazuron, cumyluron, ethidimuron, isouron, tebuthiuron, buturon, clorbromuron, metyldymron, phenobenzuron, SK-85, metobromuron, metoxuron, afesin, monuron, siduron, fenuron, fluothiuron, neburon, cloxuron, noruron, isonoruron, 3-xyclooctyl-1, thiazflon, tebuthiuron, difenoxuron, paraflon, methylamine tribunil, karbutilat, trimeturon, dimefuron, monisuron, anisuron, methiuron, cloreturon, tetraflon, phenmedipham, phenmedipham-etil, desmedipham, asulam, terbucarb, barban, prophan, clorprophan, rowmat, swep, clorbufam, carboxazole, clorprocarb, fenasulam, BCPC, CPPC, carbasulam, butylat, benthiocarb, vernolat, molinat, triallat, dimepiperat, esprocarb, pyributicarb, xycloate, avadex, EPTC, ethiolat, orbencarb, pebulat, prosulfocarb, tiocarbazil, CDEC, dimexano, isopolinat, methiobencarb, este 2,4-D butyl, este MCPA-Na, 2,4-D iso-octyl, este MCPA iso-octyl, muoi natri 2,4-D, muoi 2,4-D dimethylamin, MCPA-thioethyl, MCPA, axit 2,4-D propionic, muoi axit 2,4-D propionic cao, axit 2,4-D butyric, axit MCPA propionic, muoi axit MCPA propionic, axit MCPA butyric, axit 2,4,5-D, 2,4,5-D propionic, axit 2,4,5-D butyric, muoi amin MCPA, dicamba, erbon, clorfenac, saison, TBA, cloramphen, metoxy-TBA, diclofop-metyl, fluazifop-butyl, fluazifop-p-butyl, haloxyfop-metyl, haloxyfop-P, quizalofop-etil, quizalofop-p-etil, fenoxaprop-ety, fenoxaprop-p-etil, propaquizafop, cyhalofop-butyl, metamifop, clodinafop-propargyl, fenthiaprop-etyl, cloazifop-propynyl, poppenat-metyl, trifopsime, isoxapryifop, paraquat, diquat, oryzalin, ethalfluralin, isopropalin, nitrinalin, profluralin, prodinamin, benfluralin, flucloralin, dinitramina, dipropalin, clornidin, metalpropalin, dinoprop, glyphosate, anilofos, glufosinat amoni, amiprotophos-metyl, sulphosate, piperophos, bialaphos-natri, bensulide, butamifos, phocarb, 2,4-DEP, H-9201, zytron, imazapyr, imazethapyr, imazaquin, imazamox, muoi imazamox amoni, imazapic, imazamethabenz-metyl, floxypyrr, este floxypyrr iso-octyl, clopyralid, picloram, triclopyr, dithiopyr, haloxydin, 3,5,6-triclo-2-pyridinol, thiazopyr, fluridone, aminopyralid, diflufenzopyr, triclopyr-butotyl,

Cliodinat, sethoxydim, clethodim, xycloxydim, alloxydim, clefoxydim, butroxydim, tralkoxydim, tepraloxoxydim, buthidazole, metribuzin, hexazinon, metamitron, ethiozin, ametridion, amibuzin, bromoxynil, bromoxynil octanoat, ioxynil octanoat, ioxynil, diclobenil, diphenatrile, pyraclonil, cloxynil, iodobonil, flumetsulam, florasulam, penoxsulam, metosulam, cloransulam-metyl, diclosulam, pyroxsulam, benfuresat, bispyribac-natri, pyribenzoxim, pyriftalid, pyriminobac-metyl, pyrithiobac-natri, benzobicylon, mesotrión, sulcotrión, tembotrión, tefuryltrion, bixyclopyron, ketodpiradox, isoxaflutol, clamazon, fenoxasulfon, methiozolin, fluazolat, pyraflufen-etyl, pyrazolynat, difenoquat, pyrazoxyfen, benzofenap, nipyraclofen, pyrasulfotol, topramezon, pyroxasulfon, cafenstrol, flupoxam, aminotriazol, amicarbazon, azafenidin, carfentrazon-etyl, sulfentrazon, bencarbazon, benzfendizon, butafenacil, bromacil, isocil, lenacil, terbacil, flupropacil, cinidon-etyl, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, propyzamit, MK-129, flumezin, pentaclophenol, dinoseb, dinoterb, dinoterb axetat, dinosam, DNOC, clonitrophen, medinoterb axetat, dinofenat, oxadiargyl, oxadiazon, pentoazon, Flufenacet, fluthiacet-metyl, fentrazamit, flufenpyr-etyl, pyrazon, brompyrazon, metflurazon, kusakira, dimidazon, oxapyrazon, norflurazon, pyridafol, quinclorac, quinmerac, bentazon, pyridat, oxaziclolomefon, benazolin, clamazon, cinmetylin, ZJ0702, pyribambenz-propyl, indanofan, natri clorat, dalapon, axit tricloacetic, axit monocloacetic, hexacloaceton, flupropanat, cyperquat, bromofenoxim, epronaz, methazol, flurtamon, benfuresat, ethofumesat, tioclorim, clorthal, fluoroclordon, tavron, acrolein, bentranil, tridiphan, clorfenpropmetyl, thidiarizoneamin, phenisopham, busoxinon, metoxyphenon, saflufenacil, clacyfos, clopon, alorac, diethamquat, etnipromid, iprymidam, ipfencarbazon, thiencarbazon-metyl, pyrimisulfan, clorflurazole, tripropindan, sulglycapin, prosulfalin, cambendiclor, aminoxycclopyraclor, rodethanil, benoxacor, fenclorim, flurazol, fenclorazol-etyl, cloquintocet-mexyl, oxabetrinil, MG/91, cyometrinil, DKA-24, mefenpyr-dietyl, furilazol, fluxofenim, isoxadifen-etyl, diclormid, halauxifen-metyl, DOW florpyrauxifen, UBH-509, D489, LS 82-556, KPP-300, NC-324, NC-330, KH-218, DPX-N8189, SC-0744, DOWCO535, DK-8910, V-53482, PP-600, MBH-001, KIH-9201, ET-751, KIH-6127 và KIH-2023.

Để sử dụng, các chế phẩm có mặt ở dạng bán sẵn, nếu thích hợp, được pha loãng theo cách thông thường, ví dụ sử dụng nước trong trường hợp bột có thể thẩm ướt, chất cô đặc có thể nhũ hóa, chất phân tán và hạt phân tán trong nước. Các sản phẩm ở dạng bụi, hạt dùng cho đất hoặc dung dịch phát tán và phun thường không được pha loãng thêm với các chất trợ khác trước khi sử dụng. Tỷ lệ áp dụng của các hợp chất theo công thức I yêu cầu thay đổi theo các điều kiện bên ngoài, chẳng hạn như nhiệt độ, độ ẩm, bản chất của thuốc diệt cỏ được sử dụng và những thứ tương tự. Nó có thể thay đổi trong các giới hạn rộng, ví dụ giữa

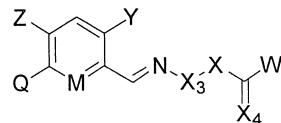
0,001 và 1,0 kg/ha hoạt chất hoặc nhiều hơn, nhưng tốt nhất là từ 0,005 đến 750 g/ha, đặc biệt là từ 0,005 đến 250g/ha.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các phương án sau được sử dụng để minh họa chi tiết cho sáng chế và không nên được coi là bất kỳ giới hạn nào đối với sáng chế. Phạm vi của sáng chế sẽ được giải thích thông qua các yêu cầu bảo hộ.

Theo quan điểm kinh tế và sự đa dạng của một hợp chất, chúng tôi ưu tiên tổng hợp một số hợp chất, một phần được liệt kê trong Bảng 1 và Bảng A. Sau đây, cấu trúc và thông tin của một hợp chất nhất định được nêu trong Bảng 1 và Bảng A. Các hợp chất trong Bảng 1 và Bảng A được liệt kê để tiếp tục giải thích sáng chế, trừ bất kỳ giới hạn nào của sáng chế. Đối tượng của sáng chế không nên được những người có trình độ trung bình trong lĩnh vực này hiểu là chỉ giới hạn trong các hợp chất sau.

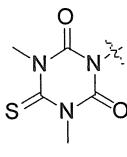
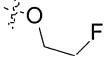
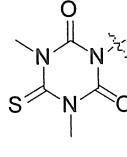
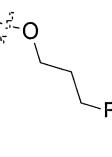
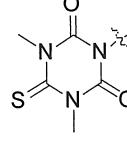
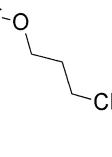
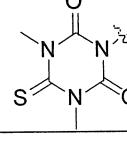
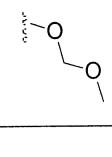
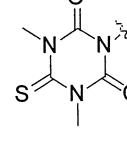
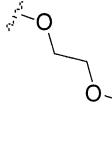
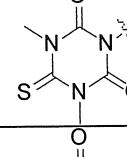
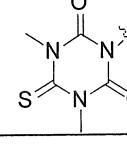
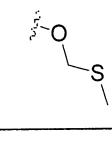
Bảng 1: Cấu trúc và dữ liệu ^1H NMR của các hợp chất

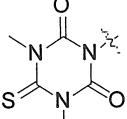
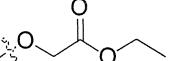
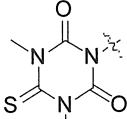
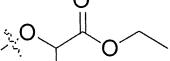
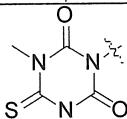
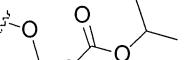
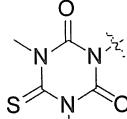
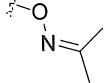
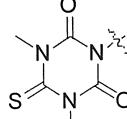
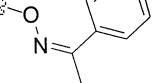
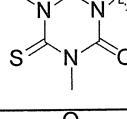
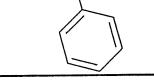
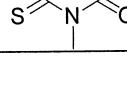
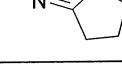
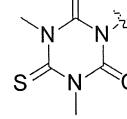
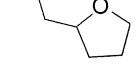


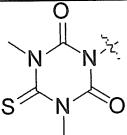
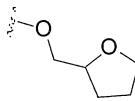
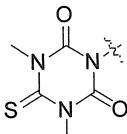
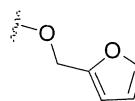
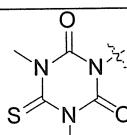
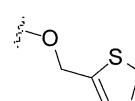
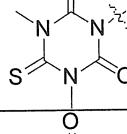
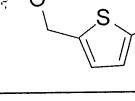
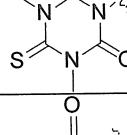
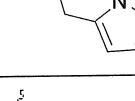
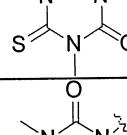
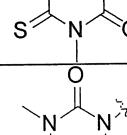
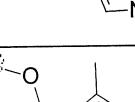
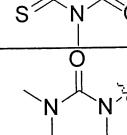
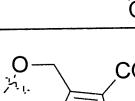
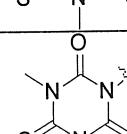
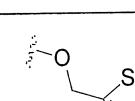
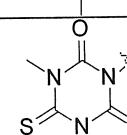
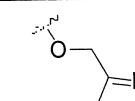
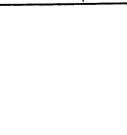
I

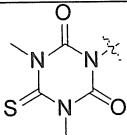
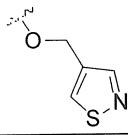
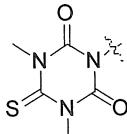
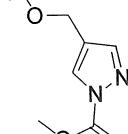
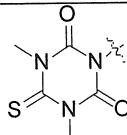
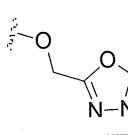
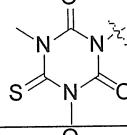
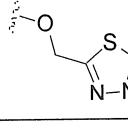
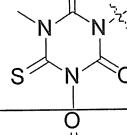
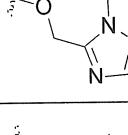
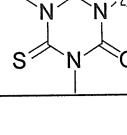
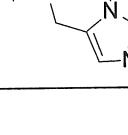
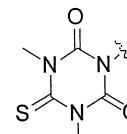
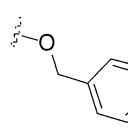
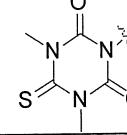
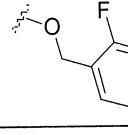
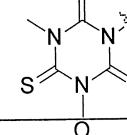
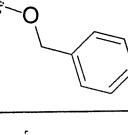
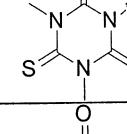
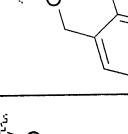
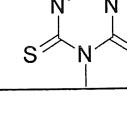
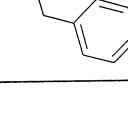
| NO. | Q | X | X ₃ | X ₄ | W | Y | Z | M | ^1H NMR |
|-----|---|--------|----------------|----------------|-----|----|---|----|---|
| 1 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,49 (s, 1H), 8,01 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,89-4,87 (m, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,62 (s, 6H), 1,47-1,45 (m, 3H). |
| 2 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | ^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,49 (s, 1H), 8,01 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,87-4,85 (m, 1H), 4,15-4,13 (m, 2H), 3,61 (s, 6H), 1,46-1,44 (m, 3H), 1,18 (t, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 3 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH | ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 (s, 1H), 8,00 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 5,08 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 4,57 (q, |

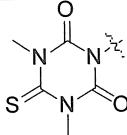
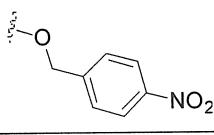
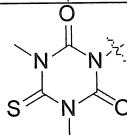
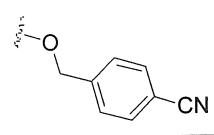
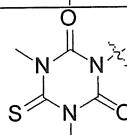
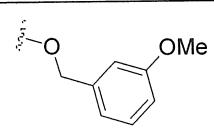
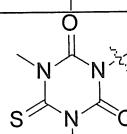
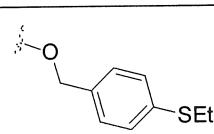
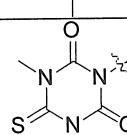
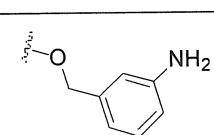
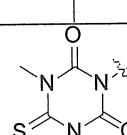
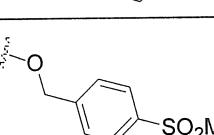
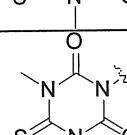
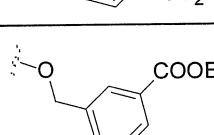
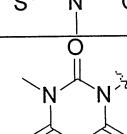
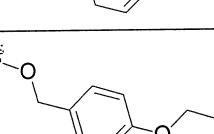
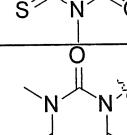
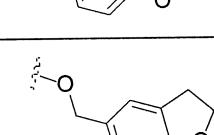
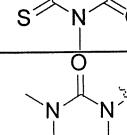
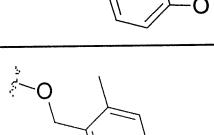
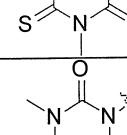
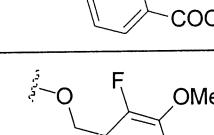
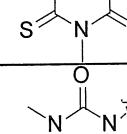
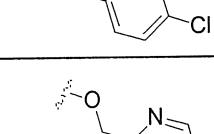
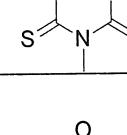
| | | | | | | | | |
|---|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| | | | | | | | | |
| 4 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 5 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 6 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 7 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 8 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 9 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

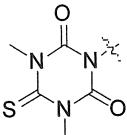
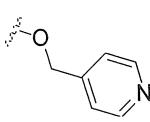
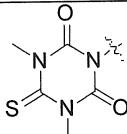
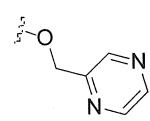
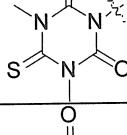
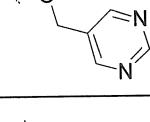
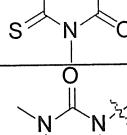
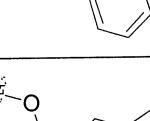
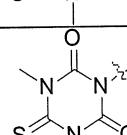
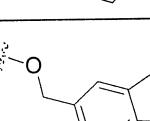
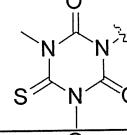
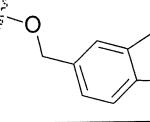
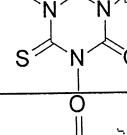
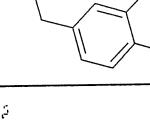
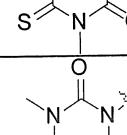
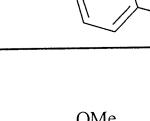
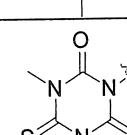
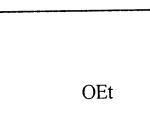
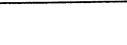
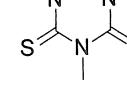
| | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 10 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 8,03 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,94 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,68 (t, J = 4,0 Hz, 1H), 4,59 (t, J = 4,0 Hz, 1H), 4,50 – 4,29 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 1,50 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 11 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 8,02 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,90 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,54 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 4,44 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 4,29-4,16 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 2,04-1,96 (m, 2H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 12 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 8,02 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,91 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,23-4,13 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 2,33 – 2,27 (m, 2H), 1,84-1,82 (m, 2H), 1,49 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 13 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 14 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,55 (s, 1H), 7,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,88 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,45 – 4,28 (m, 2H), 3,82 (s, 6H), 3,65 (t, J = 4,5 Hz, 2H), 3,40 (s, 3H), 1,62 – 1,58 (m, 3H). |
| 15 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 16 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

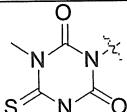
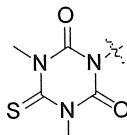
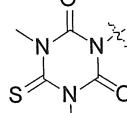
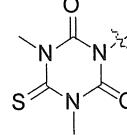
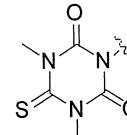
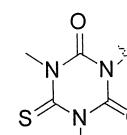
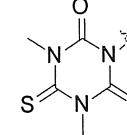
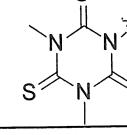
| | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | |
| 17 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,55 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,36 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,34 – 4,20 (m, 4H), 3,81 (s, 6H), 1,62 – 1,58 (m, 3H), 1,33 – 1,31 (m, 3H). |
| 18 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 19 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 20 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,54 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> = 9,5Hz, 1H), 5,01 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,63 (s, 6H), 1,99-1,96 (m, 6H), 1,53 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 21 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 22 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 23 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 24 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,50 (s, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 4,83 (q, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 4,26 – 4,19 (m, 1H), 4,16 – 4,02 (m, 2H), 3,87 – 3,80 (m, 1H), 3,78-3,74 (m, 7H), 1,97-1,94(m, 1H), 1,91-1,82 (m, 2H), 1,65 – 1,57 (m, 1H), 1,54 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 3H). |

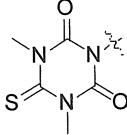
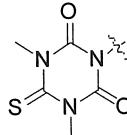
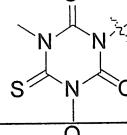
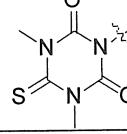
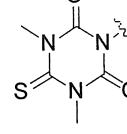
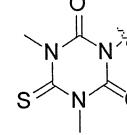
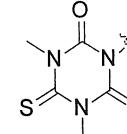
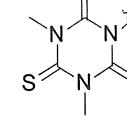
| | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 25 |  | CH(Me) | O | S |  | Cl | F | CH | |
| 26 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 8,02 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), 6,54 (d, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), 6,45-6,42 (m, 1H), 5,18-5,16 (m, 2H), 4,92-4,91 (m, 1H), 3,64 (s, 6H), 1,46 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 27 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 28 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 29 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 30 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 31 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 32 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 33 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 34 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 35 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

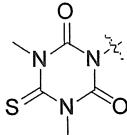
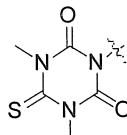
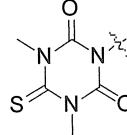
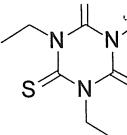
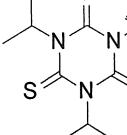
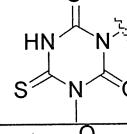
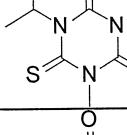
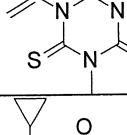
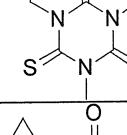
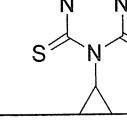
| | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 36 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 37 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 38 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 39 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 40 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 41 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 42 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 8,04 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,5Hz, 1H), 7,37 – 7,27 (m, 5H), 5,25 (d, J = 12,5 Hz, 1H), 5,16 (d, J = 12,5 Hz, 1H), 4,96 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,64 (d, J = 6,0Hz, 6H), 1,50 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 43 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 44 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 45 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 46 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 47 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 48 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 49 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 50 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 51 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 52 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 53 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 54 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 55 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 56 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 57 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 58 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 59 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | 1H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,65 (s, 1H), 8,53-8,48 (m, 2H), 7,86 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,70 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,37 (d, J = 9,0 Hz, 1H), |

| | | | | | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|--|--|--|--|
| | | | | | | | | | | | | | |
| 60 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform- <i>d</i>) δ 7,28-7,30 (m, 1H), 5,26 (s, 2H), 4,92 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 6H), 1,62 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 61 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 62 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 63 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 64 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 65 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 66 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 67 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 68 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | | | |
| 69 |  | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | | | |
| 70 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,75 (s, 1H), 8,08 (d, <i>J</i> = 7,5Hz, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 9,5Hz, 1H), 6,49 (d, <i>J</i> = |

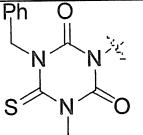
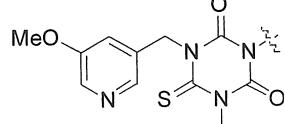
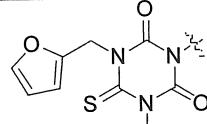
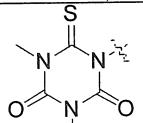
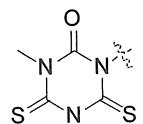
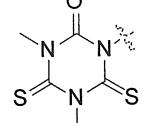
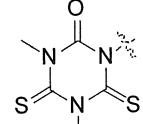
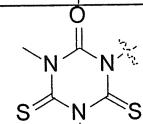
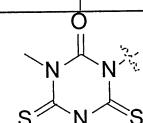
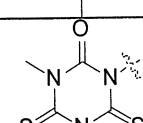
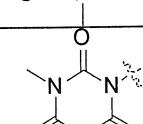
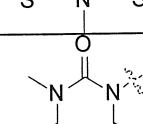
| | | | | | | | | | |
|----|---|----------------------|---|---|-----|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | 56,5 Hz, 1H), 4,30-4,28 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 1,27-1,25 (m, 3H). |
| 71 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 72 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,76 (t, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,64 (s, 6H), 1,94 – 1,79 (m, 2H), 0,98 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 3H). |
| 73 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 74 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,75 (t, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 4,25 – 4,09 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 1,84 – 1,78 (m, 2H), 1,48 – 1,42 (m, 2H), 1,21 (t, <i>J</i> = 5,5 Hz, 3H), 0,94 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 3H). |
| 75 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,54 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,58 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,64 (s, 6H), 2,19 – 2,14 (m, 1H), 1,00 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 6H). |
| 76 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,54 (s, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,27 – 4,19 (m, 1H), 4,18 – 4,12 (m, 2H), 3,63 (s, 6H), 1,25 – 1,18 (m, 4H), 0,68 – 0,63 (m, 2H), 0,55 – 0,52 (m, 2H). |
| 77 |  | CH(CF ₃) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 78 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |

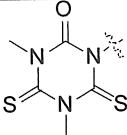
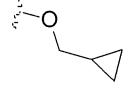
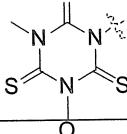
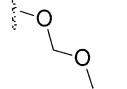
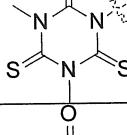
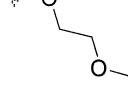
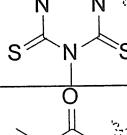
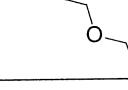
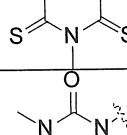
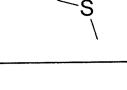
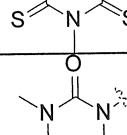
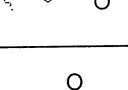
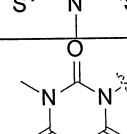
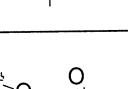
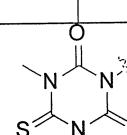
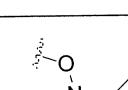
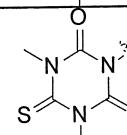
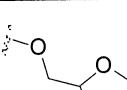
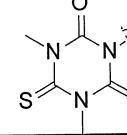
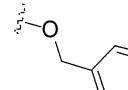
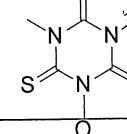
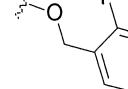
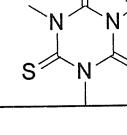
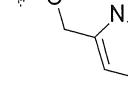
| | | | | | | | | | | | |
|----|---|---|---|---|--|-----|-----------------|---|----|--|--|
| | | | | | | | | | | | |
| 79 |  |  | O | O | | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,60 (s, 1H), 8,05 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 5,67 (s, 1H), 4,20 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 3,83 – 3,78 (m, 1H), 3,76 – 3,70 (m, 1H), 3,64 (s, 6H), 1,25 – 2,16 (m, 6H). | |
| 80 |  |  | O | O | | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,56 (s, 1H), 8,04 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 5,06 – 4,99 (m, 1H), 3,83 – 3,80 (m, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,64 (s, 6H), 3,35 (s, 3H). | |
| 81 |  | CH(COOMe) | O | O | | OMe | Cl | F | CH | | |
| 82 |  | CH(Ph) | O | O | | OMe | Cl | F | CH | | |
| 83 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | Br | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,46 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,65 – 3,62 (m, 6H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 84 |  | CH(Me) | O | O | | OEt | Br | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,46 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 4,86 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,23 – 4,09 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,21 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 85 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | CF ₃ | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,45 (s, 1H), 8,21 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,94 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,64 (s, 6H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 86 |  | CH(Me) | O | O | | OEt | CF ₃ | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,45 (s, 1H), 8,21 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 8,10 (d, <i>J</i> = 10,0 Hz, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,22 – 4,10 (m, 2H), 3,65 (s, 6H), | |

| | | | | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|-----|----|---|----|--|--|---|
| | | | | | | | | | | | |
| 87 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | CH | | | 1,48 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,20 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H). |
| 88 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,29 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 8,13 (d, $J = 7,0$ Hz, 1H), 4,94 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,65 – 3,63 (m, 6H), 1,50 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H). |
| 89 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | N | | | |
| 90 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 91 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 92 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 93 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 94 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 95 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |
| 96 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 97 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 98 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 99 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 100 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 101 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 102 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 103 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 104 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 105 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 106 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 107 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 108 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 109 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 110 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 111 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 112 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 113 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 114 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 115 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 116 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 117 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 118 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 119 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 120 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 121 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 122 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 123 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 124 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 8,00 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,89 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,14 (s, 3H), 3,70 (s, 3H), 3,62 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 125 |  | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH | |
| 126 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 127 |  | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH | |
| 128 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 129 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 130 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 131 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 132 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 133 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 134 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 135 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 136 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 137 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 138 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 139 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 140 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 141 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 142 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 143 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 144 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|----------------------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 145 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 146 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 147 | | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 148 | | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 149 | | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 150 | | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 151 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 152 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 153 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 154 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 155 | | CH(CF ₃) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 156 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 157 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------------------------------|---|---|-----|-----------------|---|----|--|
| 158 | | <chem>OCCO</chem> | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 159 | | <chem>CC(=O)OC</chem> | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 160 | | <chem>CC1=CC=C(C=C1)COC</chem> | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 161 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OEt | Br | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,45 (s, 1H), 8,01 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 4,87–4,85 (m, 1H), 4,29–4,00 (m, 5H), 3,62 (s, 3H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 162 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OEt | CF ₃ | F | CH | |
| 163 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OEt | CN | F | CH | |
| 164 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,40 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 165 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 166 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 167 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | SMe | Cl | F | CH | |
| 168 | | <chem>CC(C)O</chem> | O | O | SEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,58 (s, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,94 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,63 (s, 6H), 2,89–2,83 |

| | | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|------|----|---|----|--|---|
| | | | | | | | | | | (m, 2H), 1,46 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,18 (t, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 169 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 170 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 171 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 172 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 173 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 174 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 175 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 176 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 177 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 178 | | CH(Me) | O | O | SEt | CN | F | CH | | |
| 179 | | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH | | |
| 180 | | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH | | |
| 181 | | CH(Me) | O | O | NHET | Cl | F | CH | | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------------------|---|---|-----|----|---|----|---|
| 182 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 183 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 11,82 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,08 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,50 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 3,64 (s, 6H), 3,62 (s, 3H), 3,35 – 3,28 (m, 2H), 2,53 – 2,49 (m, 2H), 1,66 (d, J = 6,5 Hz, 3H). |
| 184 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 185 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 186 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 187 | | CH(Me) | O | O | | CN | F | CH | |
| 188 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 189 | | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,46 (s, 1H), 8,00 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,64 (s, 6H), 1,54 (s, 6H). |
| 190 | | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 191 | | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 192 | | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |

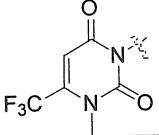
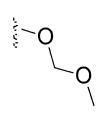
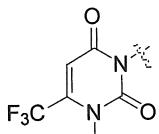
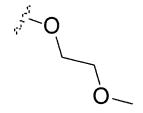
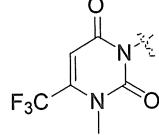
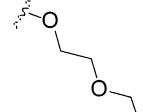
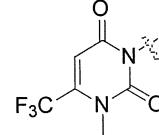
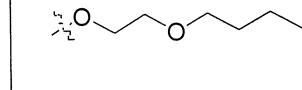
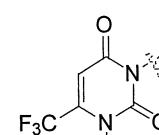
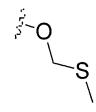
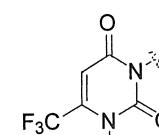
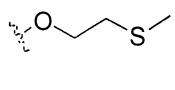
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|---|
| 193 | | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 12,89 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,92–7,90 (m, 2H), 6,60 (s, 1H), 4,76 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,46 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 194 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,93 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,89–4,87 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 195 | | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH | |
| 196 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,94–7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,86 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,16 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 197 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH | |
| 198 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,95–7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,88 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,17–3,98 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,63–1,56 (m, 2H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,87 (t, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 199 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,55 (s, 1H), 7,84 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,35 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,41 (s, 1H), 5,13–5,10 (m, 1H), 4,79–4,76 (m, 1H), 3,60 (s, 3H), 1,53 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,36–1,24 (m, 6H). |
| 200 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|---|---|
| | | | | | | | | 4,87 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 4,18 – 4,05 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,59 – 1,53 (m, 2H), 1,47 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,35 – 1,25 (m, 3H), 0,84 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H) | |
| 201 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 – 7,90 (m, 1H), 7,87 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 4,89 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 3,98 – 3,95 (m, 1H), 3,88 – 3,84 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,91 – 1,86 (m, 1H), 1,49 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 0,93 – 0,81 (m, 6H). |
| 202 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 7,90–7,89 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,72–4,71 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,45 – 1,37 (m, 12H). |
| 203 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,91 – 7,87 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,89–4,84 (m, 1H), 4,17 – 4,04 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,58 – 1,55 (m, 2H), 1,47 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,27–1,23 (m, 4H), 0,85–0,79 (m, 3H). |
| 204 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,50 (s, 1H), 7,89 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,86 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 6,58 (s, 1H), 4,88 – 4,81 (m, 1H), 3,41 (s, 3H), 3,38 – 3,36 (m, 2H), 1,57 – 1,51 (m, 2H), 1,45 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,42 – 1,37 (m, 2H), 1,22 – 1,18 (m, 2H), 0,86 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H). |
| 205 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,92 – 7,86 (m, 2H), 6,60 (s, 1H), 4,89 – 4,84 (m, 1H), 4,17 – 4,04 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,59 – 1,53 (m, 2H), 1,47 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,26 – 1,19 (m, 8H), 0,84 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H). |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 206 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,96 – 7,83 (m, 2H), 6,60 (s, 1H), 4,88-4,86 (m, 1H), 4,21 – 4,11 (m, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,24-1,22 (m, 14H). |
| 207 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,90-7,88 (m, 2H), 6,60 (s, 1H), 4,86 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,46 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,17 -1,06(m, 13H), 0,84-0,82 (m, 3H). |
| 208 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,98 – 7,86 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 5,92-5,90 (m, 1H), 5,28-5,26 (m, 2H), 4,93-4,91 (m, 1H), 4,68-4,66 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,49 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 209 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,49 (s, 1H), 8,00 – 7,84 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 5,77 – 5,68 (m, 1H), 5,08-5,02 (m, 1H), 5,00 – 4,97 (m, 1H), 4,86-4,80 (m, 1H), 4,23 – 4,08 (m, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,35-2,31 (m, 2H), 1,44 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 210 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 211 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 212 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,97 – 7,84 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,98 – 4,89 (m, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,60 – 3,56 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,49 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |

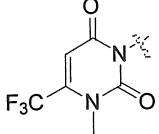
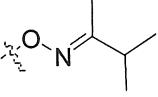
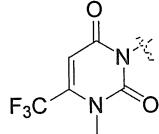
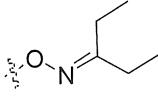
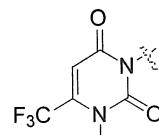
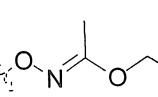
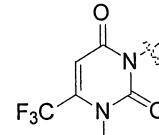
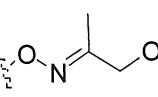
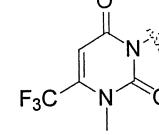
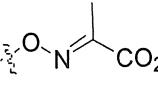
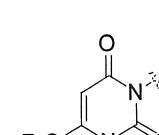
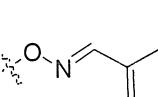
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 213 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 214 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,16 (d, J = 6,5 Hz, 1H), 4,82 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,88 – 1,77 (m, 2H), 1,68 – 1,49 (m, 6H), 1,45 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 215 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 216 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,92 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,93 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 4,68 – 4,58 (m, 2H), 4,42 – 4,34 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,50 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 217 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,94 – 7,82 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,99 – 4,97 (m, 1H), 4,47 – 4,45 (m, 2H), 3,44 – 3,42 (m, 4H), 1,50 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 218 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,92 – 7,87 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,11 – 4,68 (m, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,45 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 219 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 220 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,55 (s, 1H), 7,93 – 7,87 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 4,99 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,54 – 4,35 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,69 – 1,59 (m, 3H), 1,51 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |

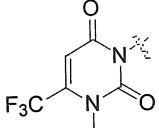
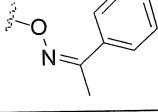
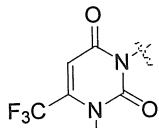
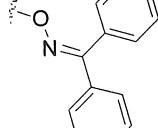
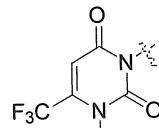
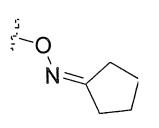
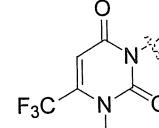
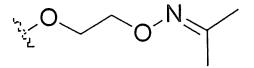
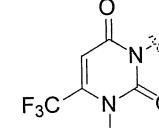
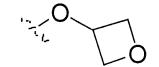
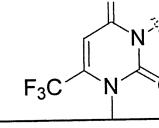
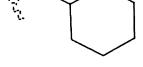
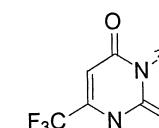
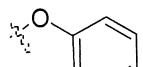
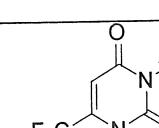
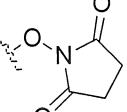
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 221 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,94 – 7,85 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 4,89 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,42 – 4,27 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,77 – 2,65 (m, 2H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 222 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 223 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 224 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 225 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 6,58 – 6,52 (m, 1H), 6,13–6,06 (m, 1H), 4,96 – 4,87 (m, 1H), 4,87 – 4,73 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 226 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,91 – 7,85 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 5,09 (s, 2H), 5,02 – 4,99 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 227 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> = 8,0, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,93 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,36 – 4,26 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,94–2,90 (m, 2H), 1,50 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 228 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,95 – 7,86 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,87–4,85 (m, 1H), 4,14–4,12 (m, 2H), 3,60–3,58 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |

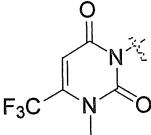
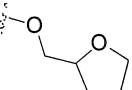
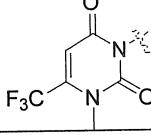
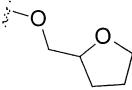
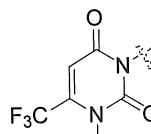
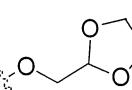
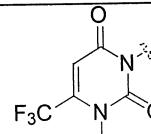
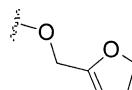
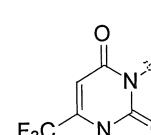
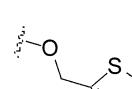
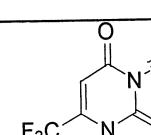
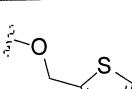
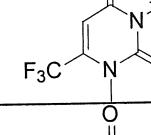
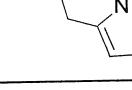
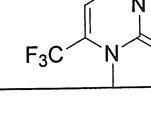
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 229 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 230 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,93 – 4,86 (m, 1H), 4,32 – 4,15 (m, 2H), 3,55 – 3,51 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 231 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,50 (s, 1H), 7,92 – 7,84 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 4,89 – 4,85 (m, 1H), 4,28 – 4,24 (m, 1H), 4,18 – 4,15 (m, 1H), 3,55 – 3,53 (m, 2H), 3,42 – 3,38 (m, 5H), 1,46 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,03 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 232 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 4,88 (q, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 4,33 – 4,12 (m, 2H), 3,59 – 3,52 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 3,36 – 3,33 (m, 2H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,45 – 1,38 (m, 2H), 1,34 – 1,22 (m, 2H), 0,85 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 3H). |
| 233 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,93 – 7,87 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,33 – 5,30 (m, 1H), 5,24 – 5,21 (m, 1H), 4,94 – 4,91 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 234 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,00 – 4,83 (m, 1H), 4,41 – 4,16 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 2,74 – 2,71 (m, 2H), 2,08 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |

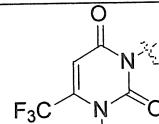
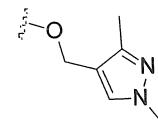
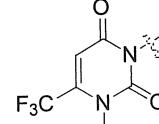
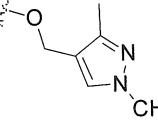
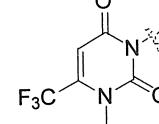
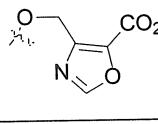
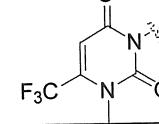
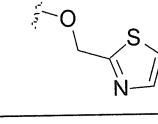
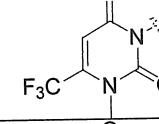
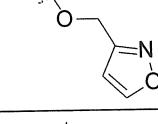
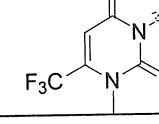
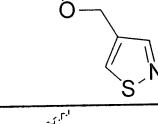
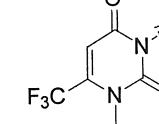
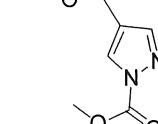
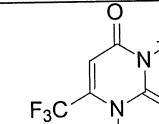
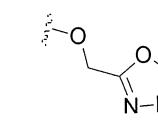
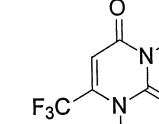
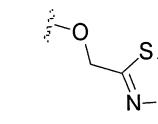
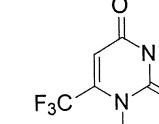
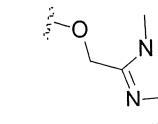
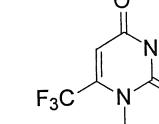
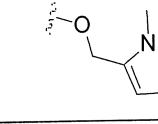
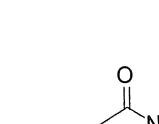
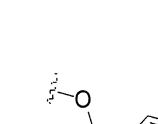
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 235 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 236 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,49 (s, 1H), 7,95–7,87 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,76 (q, <i>J</i> =7,0 Hz, 1H), 3,95 (t, <i>J</i> =7,0 Hz, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,65–1,55 (m, 2H), 1,46 (d, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H). |
| 237 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 238 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> =9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 5,01–4,79 (m, 3H), 3,42 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,54 (d, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H). |
| 239 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> =9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 5,01 (q, <i>J</i> =7,0 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 4,19–4,09 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,53 (d, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H), 1,19 (t, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H). |
| 240 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,48 (s, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,0 Hz, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> =9,5 Hz, 1H), 6,59 (s, 1H), 4,89–4,79 (m, 1H), 4,37–4,32 (m, 1H), 4,27–4,22 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 3,40 (s, 3H), 2,69–2,63 (m, 2H), 1,42 (d, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H). |
| 241 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,95–7,83 (m, 2H), 6,60 (s, 1H), 5,18–5,08 (m, 1H), 4,96–4,89 (m, 1H), 3,64 (s, 3H), 3,40 (s, 3H), 1,49 (t, <i>J</i> =7,0 Hz, 3H), 1,41 (t, <i>J</i> =7,5 Hz, 3H). |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 242 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 243 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,92-7,90 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 4,87-4,85 (m, 1H), 3,60 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,52 – 1,42 (m, 9H). |
| 244 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 245 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,55 (s, 1H), 7,95-7,88(m, 2H), 6,62 (s, 1H), 6,03 (s, 1H), 5,02-4,97 (m, 1H), 3,73 (s, 3H), 3,42 – 3,40 (m, 6H), 1,54-1,52(m, 3H). |
| 246 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,91-7,89 (m, 2H), 6,69 (s, 1H), 6,61 -6,56(m, 1H), 4,92-4,90 (m, 1H), 4,10-4,08 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,52 – 1,40 (m, 6H), 1,20-1,18 (m, 3H). |
| 247 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 248 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,01 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,94 (s, 3H), 1,53 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 249 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,01 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,35 – 2,30 (m, 2H), 1,92 (s, 3H), 1,54 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,07 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |

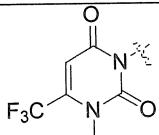
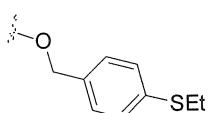
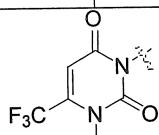
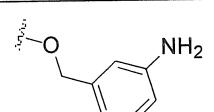
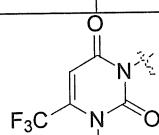
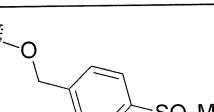
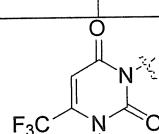
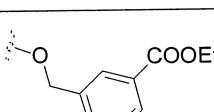
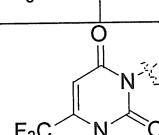
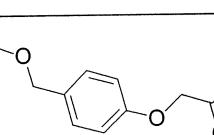
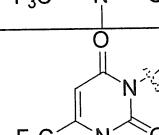
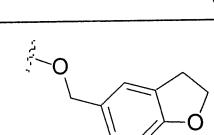
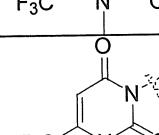
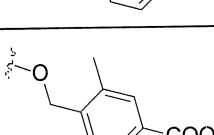
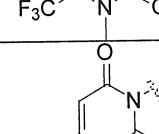
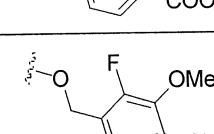
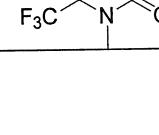
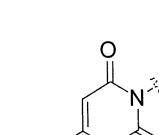
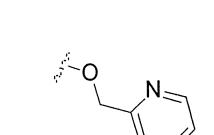
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 250 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,55 (s, 1H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,01 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,65–2,58 (m, 1H), 1,89 (s, 3H), 1,54 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,09 (d, J = 7,0 Hz, 6H). |
| 251 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,55 (s, 1H), 7,94 – 7,92 (m, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,02 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,40 – 2,27 (m, 4H), 1,54 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,07 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 252 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,94 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,05 – 4,98 (m, 1H), 4,10 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,54 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,27 (t, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 253 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,56 (s, 1H), 7,93 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,01 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,05 (s, 2H), 3,42 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 1,95 (s, 3H), 1,55 (d, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 254 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 7,93 – 7,88 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,13 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,28 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,58 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,28 (t, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 255 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,78 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 7,60 – 7,50 (m, 3H), 6,59 (s, 1H), |

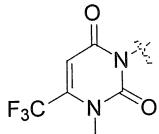
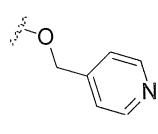
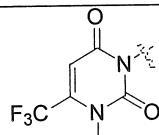
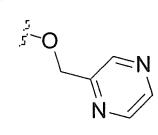
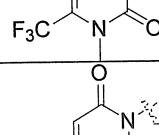
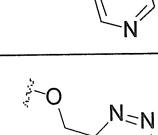
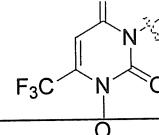
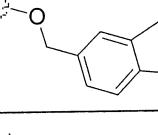
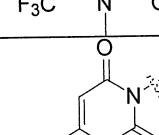
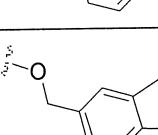
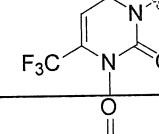
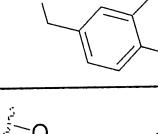
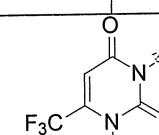
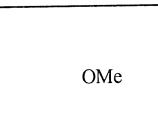
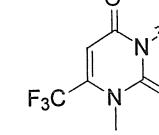
| | | | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|--|---|
| | | | | | | | | | | | |
| 256 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | 5,09 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,40 (s, 3H), 1,59 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 257 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 258 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,54 (s, 1H), 7,93 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 4,98 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,49 – 2,42 (m, 4H), 2,31 – 2,21 (m, 4H), 1,53 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 259 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,89 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,38 – 4,33 (m, 1H), 4,27 – 4,23 (m, 1H), 4,14 – 4,11 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,71 (s, 3H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 260 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 261 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 262 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,59 (s, 1H), 8,01 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,48 – 7,43 (m, 2H), 7,33 – 7,29 (m, 1H), 7,16 – 7,14 (m, 2H), 6,63 (s, 1H), 5,17 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,44 (s, 3H), 1,65 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 263 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 7,98 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,5 Hz, 1H), |

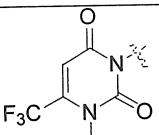
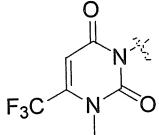
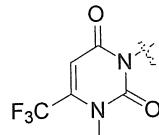
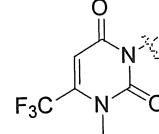
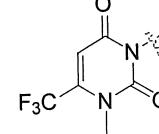
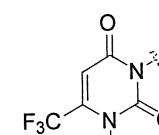
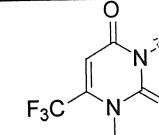
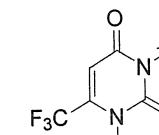
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | 6,62 (s, 1H), 5,35 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 3,43 (s, 3H), 2,80–2,84 (m, 4H), 1,64 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H). |
| 264 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,96 – 7,82 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,97 – 4,82 (m, 1H), 4,19 – 3,98 (m, 3H), 3,76 – 3,55 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,98 – 1,71 (m, 3H), 1,61 – 1,41 (m, 4H). |
| 265 |  | CH(Me) | O | S |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,94 – 7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,08–5,06 (m, 1H), 4,91 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 4,14 – 4,02 (m, 2H), 3,88–3,86 (m, 2H), 3,81–3,79(m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,48 (d, $J =$ 7,0 Hz, 3H). |
| 266 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,94 – 7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,08–5,06 (m, 1H), 4,91 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 4,14 – 4,02 (m, 2H), 3,88–3,86 (m, 2H), 3,81–3,79(m, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,48 (d, $J =$ 7,0 Hz, 3H). |
| 267 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 7,88–7,84 (m, 2H), 7,52 (t, $J =$ 5,0 Hz, 1H), 7,17–7,15 (m, 1H), 6,99 (d, $J =$ 4,5 Hz, 1H), 6,63 (s, 1H), 5,40 – 5,32 (m, 2H), 4,96 – 4,86 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,46 (d, $J =$ 7,0 Hz, 3H). |
| 268 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 7,88–7,84 (m, 2H), 7,52 (t, $J =$ 5,0 Hz, 1H), 7,17–7,15 (m, 1H), 6,99 (d, $J =$ 4,5 Hz, 1H), 6,63 (s, 1H), 5,40 – 5,32 (m, 2H), 4,96 – 4,86 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,46 (d, $J =$ 7,0 Hz, 3H). |
| 269 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 270 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 271 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

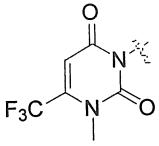
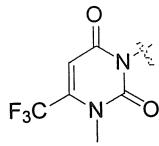
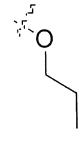
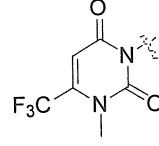
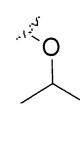
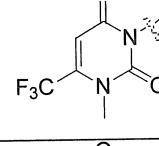
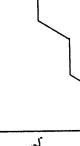
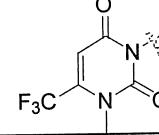
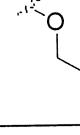
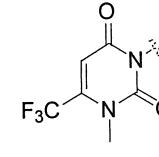
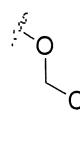
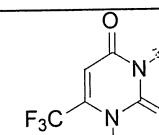
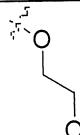
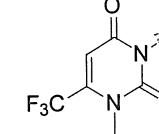
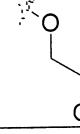
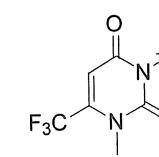
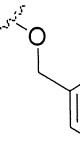
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 272 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 273 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 274 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 275 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 276 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 277 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 278 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 279 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 280 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 281 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 282 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 283 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,95-7,90 (m, 2H), 7,39 - 7,24 (m, 5H), 6,63 (s, 1H), 5,26-5,22 (m, 1H), 5,19-5,14 (m, 1H), 4,97-4,92 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,49 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |

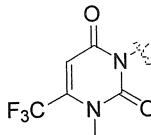
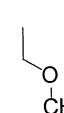
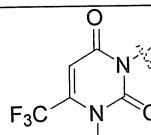
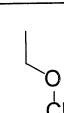
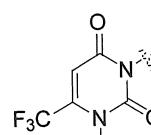
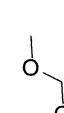
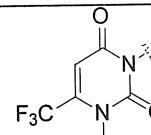
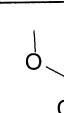
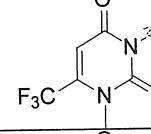
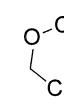
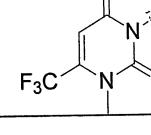
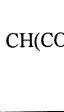
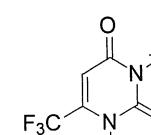
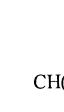
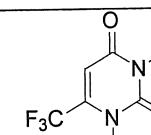
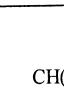
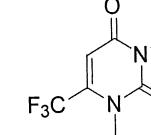
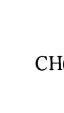
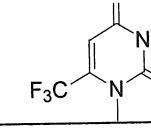
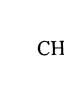
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 284 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.50 (s, 1H), 7.94 – 7.85 (m, 2H), 7.46 – 7.40 (m, 2H), 7.23 – 7.15 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 5.32 – 5.27 (m, 1H), 5.24 – 5.18 (m, 1H), 4.94 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.43 (s, 3H), 1.48 (d, J = 7.0 Hz, 3H). |
| 285 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.52 (s, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 2H), 7.41 – 7.35 (m, 1H), 7.22 – 7.17 (m, 2H), 7.17 – 7.10 (m, 1H), 6.63 (s, 1H), 5.29 – 5.15 (m, 2H), 5.00 – 4.95 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 1.51 (d, J = 7.0 Hz, 3H). |
| 286 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.50 (s, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 2H), 7.41 – 7.38 (m, 2H), 7.17 – 7.12 (m, 2H), 6.62 (s, 1H), 5.23 – 5.14 (m, 2H), 4.94 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.44 (s, 3H), 1.49 (d, J = 7.0 Hz, 3H). |
| 287 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 288 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 289 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 290 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 291 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 292 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |

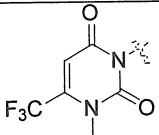
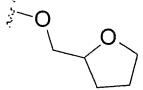
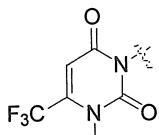
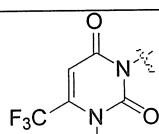
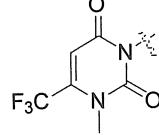
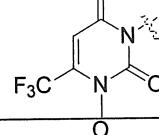
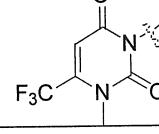
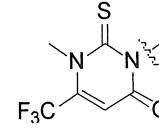
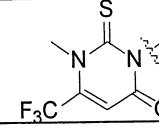
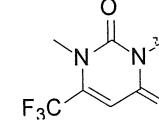
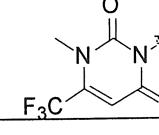
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 293 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 294 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 295 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 296 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 297 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 298 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 299 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 300 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 301 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | 1H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,63 - 8,56 (m, 2H), 7,85 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,68 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,21 - 7,25 (m, 2H), 6,41 (s, 1H), 5,27 (s, 2H), 4,87 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 4,0 Hz, 3H), 1,57 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 302 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | 1H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 8,62 - 8,59 (m, 2H), 8,54 (s, 1H), 7,81 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 4,5 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,30 - 7,28 (m, 1H), 6,42 (s, 1H), 5,27 (s, 2H), 4,87 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,61 (d, J = 4,0 Hz, 3H), 1,57 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |

| | | | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|--|--|
| | | | | | | | | | | | |
| 303 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,58 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 2H), 8,17 (s, 1H), 7,63 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 2H), 7,30 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 7,25 – 7,19 (m, 1H), 6,43 (s, 1H), 5,28 (s, 2H), 4,87 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 1,56 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 304 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 305 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 306 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 307 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 308 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 309 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 310 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 311 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | | | |
| 312 | | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | |
| 313 | | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,95–7,83 (m, 2H), 6,61 (d, <i>J</i> = 2,0 Hz, 1H), 5,37 – 5,32 (m, 1H), 4,19 (q, <i>J</i> = 6,0 Hz, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,24 (t, <i>J</i> = 6,0 Hz, 3H). |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|----------------------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 314 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 315 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,54 (s, 1H), 7,95 – 7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,74 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,93 – 1,79 (m, 2H), 0,98 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 3H). |
| 316 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,78 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,81-1,78 (m, 2H), 1,46-1,42 (m, 2H), 0,94 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 317 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 318 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,54 (s, 1H), 7,94-7,87 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,57 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 2,20-2,13 (m, 1H), 1,00 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 6H). |
| 319 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,54 (s, 1H), 7,97 – 7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,23 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 4,19 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 1,29 – 1,21 (m, 4H), 0,66-0,63 (m, 2H), 0,58 – 0,49 (m, 2H). |
| 320 |  | CH(CF ₃) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 321 |  | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, Chloroform- <i>d</i>) δ 8,64 (s, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,37 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 6,41 (s, 1H), 5,48 (s, 1H), 3,87 (s, 3H), 3,61-3,56 (m, 6H). |

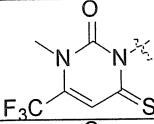
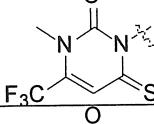
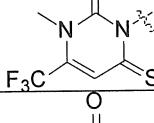
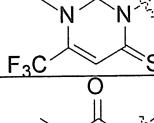
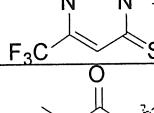
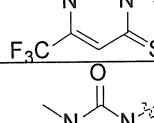
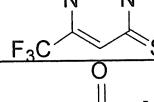
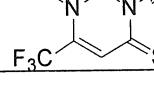
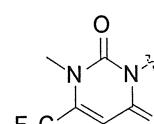
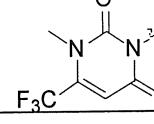
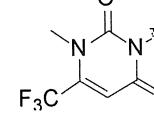
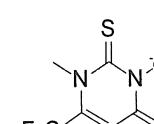
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---------|---|---|--|----|---|----|--|
| 322 |  | CH(OMe) | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,63 (s, 1H), 7,96-7,89 (m, 2H), 7,62 (s, 1H), 5,60 (s, 1H), 4,23-4,18 (m, 2H), 3,47 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,24-1,21 (m, 3H). |
| 323 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,63 (s, 1H), 7,95-7,89 (m, 2H), 7,62 (s, 1H), 5,62 (s, 1H), 4,15-4,09 (m, 2H), 3,47 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,64 - 1,59 (m, 2H), 0,98 - 0,73 (m, 3H). |
| 324 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,62 (s, 1H), 7,95-7,89 (m, 2H), 7,61 (s, 1H), 5,56 (s, 1H), 5,08 - 4,85 (m, 1H), 3,46-3,43 (m, 6H), 1,25 - 1,18 (m, 6H). |
| 325 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 326 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 327 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,02 (s, 1H), 7,34 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 6,26 (s, 1H), 6,24 (s, 1H), 5,34-5,26(m, 1H), 4,12 - 4,00 (m, 1H), 4,10-4,02 (m, 3H), 3,34 (s, 3H). |
| 328 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 329 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 330 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,61 (s, 1H), 7,96 - 7,87 (m, 2H), 7,41 - 7,29 (m, 5H), 6,63 (s, 1H), 5,68 (s, 1H), 5,29-5,18 (m, 2H), 3,47 (s, |

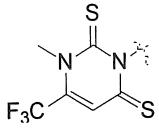
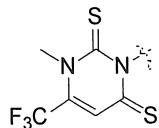
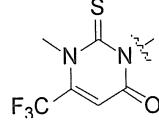
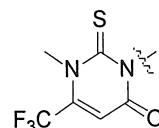
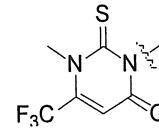
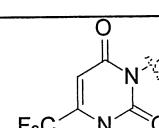
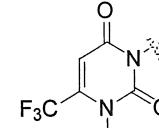
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|-----------|---|-----|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | 3H), 3,43 (s, 3H). |
| 331 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,62 (s, 1H), 7,94–7,86 (m, 2H), 6,61 (d, <i>J</i> =2,0 Hz, 1H), 5,36 (s, 1H), 3,48 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 3,31 – 3,21 (m, 2H), 1,53 – 1,42 (m, 3H). |
| 332 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 333 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,56 (s, 1H), 7,97 – 7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 5,03–4,99 (m, 1H), 3,87 – 3,74 (m, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 3,36 (s, 3H). |
| 334 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 335 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 336 |  |  | CH(COOMe) | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 337 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,61 (s, 1H), 7,95 (t, <i>J</i> =7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> =9,5 Hz, 1H), 7,47–7,32 (m, 5H) 6,62 (s, 1H), 5,17 (s, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H). |
| 338 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 339 |  |  | O | O | OMe | Br | F | CH | |
| 340 |  |  | O | O | OEt | Br | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|-----------------|---|----|--|
| 341 |  | CH(Me) | O | O |  | Br | F | CH | |
| 342 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,45 (s, 1H), 8,19 – 8,05 (m, 2H), 6,65 (s, 1H), 4,93 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,44 (s, 3H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 343 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CF ₃ | F | CH | |
| 344 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,27 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 8,05–8,03 (m, 1H), 6,65 (s, 1H), 4,93 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,50 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 345 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | CH | |
| 346 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 347 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,54 (s, 1H), 8,18 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 8,04 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,95 (s, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 348 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,95 – 7,86 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 4,89 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 349 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 350 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |

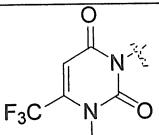
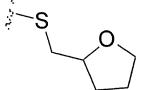
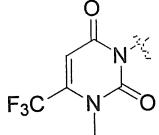
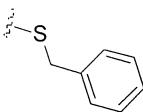
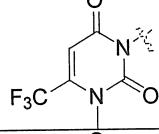
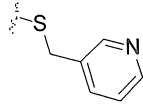
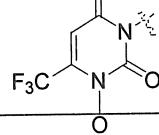
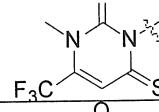
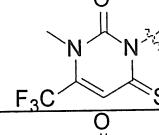
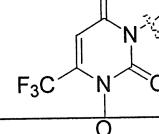
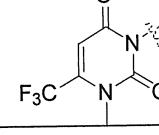
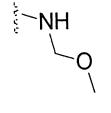
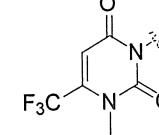
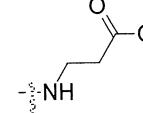
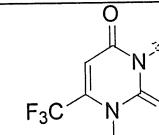
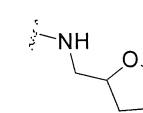
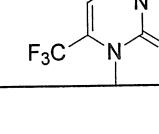
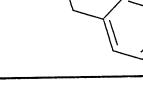
| | | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|--|--|
| | | | | | | | | | | |
| 351 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,54 (s, 1H), 8,18 (t, J = 7,0 Hz, 1H), 8,06 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,62 (s, 1H), 4,91 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). | |
| 352 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH | | |
| 353 | | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH | | |
| 354 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH | | |
| 355 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 356 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 357 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 358 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 359 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 360 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 361 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 362 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 363 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |
| 364 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 365 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 366 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 367 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 368 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 369 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 370 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 371 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 372 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 373 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 374 | | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 375 | | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 376 | | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 377 | | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 378 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 379 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH | |

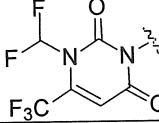
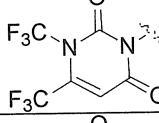
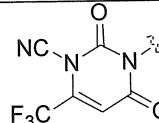
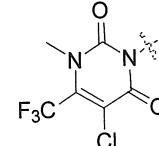
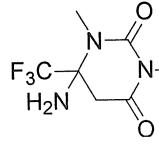
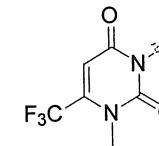
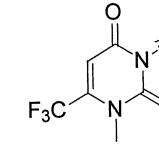
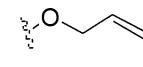
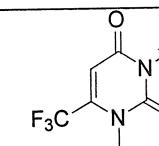
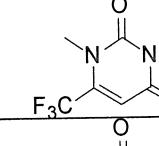
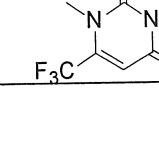
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--|---|---|-----|-----------------|---|----|--|
| 380 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 381 |  | | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 382 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 383 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 384 |  | | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 385 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 386 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 387 |  | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 388 |  | | O | O | OMe | Br | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,46 (s, 1H), 8,02 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 7,5Hz, 1H), 7,09 (s, 1H), 4,89 (q, J = 7,0Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 389 |  | | O | O | OMe | CF ₃ | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,29 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 8,05-8,03 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 4,94 (q, J = 7,0Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,49 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 390 |  | | O | O | OMe | CN | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,19 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 8,15-8,12 (m, 1H), 7,62 (s, 1H), 4,91 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 391 |  | | O | O | OMe | Br | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,19 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 8,15-8,12 (m, 1H), 7,62 (s, 1H), 4,91 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 1,48 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |

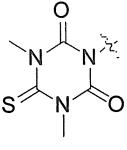
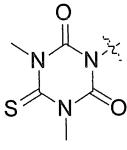
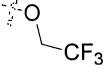
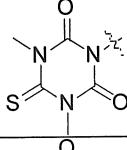
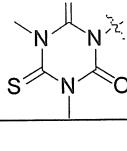
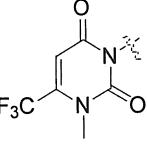
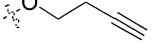
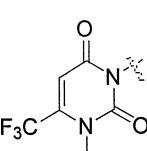
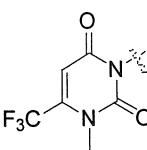
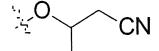
| 392 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | | CF ₃ | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,44 (s, 1H), 8,38-8,35 (m, 1H), 8,24 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 4,92 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,68 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 1,46 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
|-----|---|--------|---|---|--|-----|--|-----------------|---|----|--|--|--|---|--|
| 393 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | | CN | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 11,22 (s, 1H), 8,92 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 8,66 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 8,46 (s, 1H), 5,01 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,74 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 1,53 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 394 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | | Br | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,48 (s, 1H), 8,17-8,15 (m, 2H), 6,95 (s, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,36 (s, 3H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 395 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | | CF ₃ | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,47 (s, 1H), 8,40-8,38 (m, 1H), 8,23 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,99 (s, 1H), 4,94 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,54 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 396 |  | CH(Me) | O | O | | OMe | | CN | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,49 (s, 1H), 8,42 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 8,32 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 6,99 (s, 1H), 4,94 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 1,51 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 397 |  | CH(Me) | O | O | | SMe | | Cl | F | CH | | | | | |
| 398 |  | CH(Me) | O | O | | SEt | | Cl | F | CH | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,94 – 7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,97 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,81 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,45 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,20 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 399 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,93 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,87 – 2,81 (m, 2H), 1,56 – 1,51 (m, 2H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,93 – 0,88 (m, 3H). |
| 400 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,57 (s, 1H), 7,97 – 7,95 (m, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,92 – 4,88 (m, 1H), 3,58 – 3,51 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,45 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,26 (d, J = 6,5 Hz, 6H). |
| 401 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 402 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 403 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 404 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 405 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 406 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,63 (s, 1H), 8,00 – 7,94 (m, 1H), 7,90 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,00 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 3,82 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 407 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |

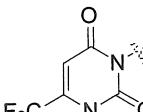
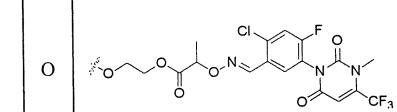
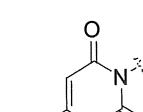
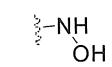
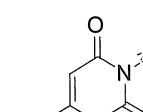
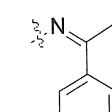
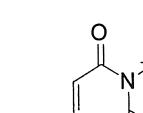
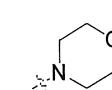
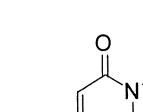
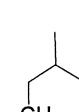
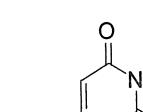
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 408 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 409 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 7,94 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,30 – 7,28 (m, 5H), 6,62 (s, 1H), 4,99 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 4,14 (s, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 410 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 411 |  | CH(Me) | O | O | SEt | CN | F | CH | |
| 412 |  | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH | |
| 413 |  | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 414 |  | CH(Me) | O | O | NHEt | Cl | F | CH | |
| 415 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 416 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,63 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 3,54 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 3,34 – 3,29 (m, 2H), 2,48–2,45 (m, 2H), 1,38 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 417 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |
| 418 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|---|
| 419 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,49 (s, 1H), 7,94 – 7,80 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 5,19 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 3,14 (s, 3H), 1,41 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 420 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 421 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,48 (s, 1H), 7,95 – 7,83 (m, 2H), 6,62 (s, 1H), 5,22-5,20 (m, 1H), 3,95-3,93 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 3,04 (s, 3H), 1,38 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,06 (d, J = 7,0 Hz, 6H). |
| 422 | | CH(Me) | O | O | | CN | F | CH | |
| 423 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 424 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,57 (s, 1H), 7,90-7,88 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 6,26 (s, 1H), 5,96-5,94(m, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,57 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 425 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | |
| 426 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,98-7,95 (m, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 4,90 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,89 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 3,70 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,26 (t, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 427 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,99 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,96 – 4,88 (m, |

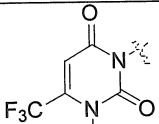
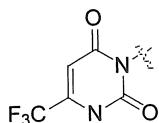
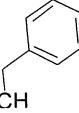
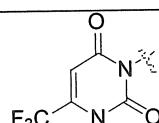
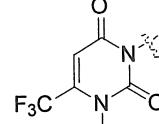
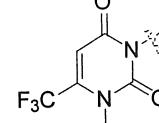
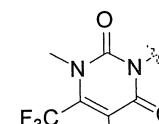
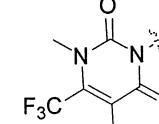
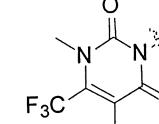
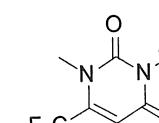
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------------------|---|---|--|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | IH), 4,74 – 4,54 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,53 – 3,41 (m, 1H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 428 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 429 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 430 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 431 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,98 – 7,86 (m, 2H), 4,90-4,88 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,47 (s, 3H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 432 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,49 (s, 1H), 7,86-7,56 (m, 2H), 4,89 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,55 (s, 3H), 3,03 (s, 2H), 2,97-2,66 (m, 2H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 3H). |
| 433 |  | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,46 (s, 1H), 7,90-7,88 (m, 2H), 6,63 (s, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,54 (s, 6H). |
| 434 |  | C(Me) ₂ | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,47 (s, 1H), 7,91 – 7,84 (m, 2H), 6,64 (s, 1H), 5,88-5,87 (m, 1H), 5,24-5,22 (m, 2H), 4,63 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 2H), 3,43 (s, 3H), 1,55 (s, 6H). |
| 435 |  | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 436 |  | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 437 |  | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |

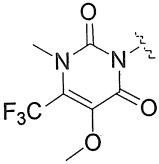
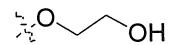
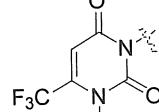
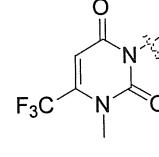
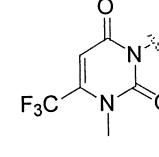
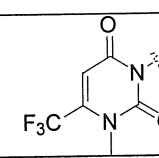
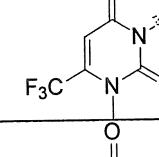
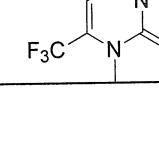
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---------------------------------|---|---|--|----|---|----|---|
| 438 |  | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 12,84 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,05 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 4,76 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,64 (s, 6H), 1,46 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 439 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 8,02-8,01 (m, 1H), 7,91-7,90 (m, 1H), 5,05-5,04 (m, 1H), 4,99 - 4,77 (m, 2H), 3,64 (s, 6H), 1,52 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 440 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 441 |  | CH(Me)CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 442 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,27 - 4,12 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,83 - 2,81 (m, 1H), 2,15 - 2,02 (m, 2H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 443 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,59 (s, 1H), 5,60 (q, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 5,02 - 4,94 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), 1,57 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 3H). |
| 444 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 5,18 - 5,02 (m, 1H), 4,97 - 4,80 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,96 - 2,90 (m, 2H), 1,49 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 3H), 1,28 (d, <i>J</i> = 6,0 Hz, 3H). |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|---|
| 445 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,53 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,95 (q, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 4,36 – 4,15 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 3,30 – 3,22 (m, 1H), 1,51 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,28 – 1,20 (m, 3H). |
| 446 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,96 – 7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,26 – 4,13 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 2,57 – 2,54 (m, 2H), 1,96 – 1,88 (m, 2H), 1,50 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 447 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,54 (s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,96 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 4,27 – 4,13 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,52 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,34 – 1,26 (m, 2H), 1,16 – 1,12 (m, 2H). |
| 448 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,88 (q, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 4,29 – 4,23 (m, 1H), 4,22 – 4,12 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 2,59 – 2,55 (m, 2H), 2,20 (s, 6H), 1,48 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 449 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,55 (s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,03 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,54 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,14 (s, 9H). |
| 450 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,03 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,28 – 2,15 (m, 1H), 1,63 (s, |

| | | | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|----|---|--|--|
| | | | | | | | | | | | |
| 451 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 7,0 Hz, 3H), 0,95 – 0,85 (m, 2H), 0,86 – 0,80 (m, 2H). | | |
| 452 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,49 (s, 1H), 7,94 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,62 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,45 – 3,40 (m, 4H), 1,40 (d, J = 7,0 Hz, 3H). | | |
| 453 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,59 (s, 1H), 8,00 – 7,85 (m, 2H), 7,78 – 7,76 (m, 2H), 7,53 – 7,51 (m, 3H), 6,59 (s, 1H), 5,14 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,41 (s, 3H), 2,38 s, 3H), 1,61 (d, J = 7,0 Hz, 3H). | | |
| 454 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 7,92 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 5,20 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 3,59 – 3,52 (m, 6H), 3,53 – 3,48 (m, 1H), 3,47 – 3,44 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,41 (d, J = 6,5 Hz, 3H). | | |
| 455 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,53 (s, 1H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 4,80 – 4,77 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,80 – 1,70 (m, 2H), 1,66 – 1,60 (m, 1H), 0,95 (d, J = 6,5 Hz, 6H). | | |
| 456 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,54 (s, 1H), 7,97 – 7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,18 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 1,26 – 1,21 (m, 1H), 0,66 – 0,63 (m, 2H), 0,58 – 0,49 (m, 2H). | | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--|---|---|-----|----|---|----|---|
| 457 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 458 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 459 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 460 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 461 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 462 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,54 (s, 1H), 8,03 – 7,83 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,85-4,82 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,88-1,82 (m, 1H), 1,70-1,65 (m, 1H), 0,93 – 0,80 (m, 1H), 0,47-0,43 (m, 2H), 0,16-0,11 (m, 2H). |
| 463 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,94-7,86 (m, 2H), 6,61 (d, J=2,0 Hz, 1H), 4,98-4,88 (m, 1H), 4,76-4,48 (m, 2H), 3,48 (s, 3H), 3,43 (s, 3H). |
| 464 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 465 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 466 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 467 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | |

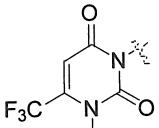
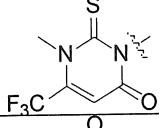
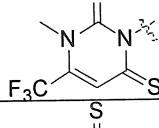
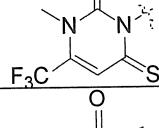
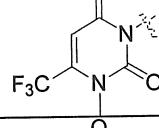
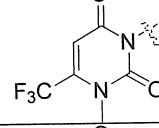
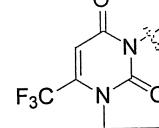
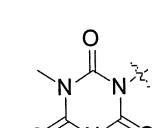
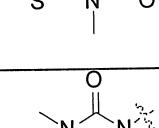
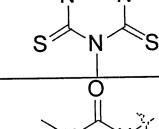
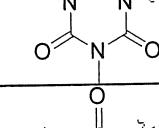
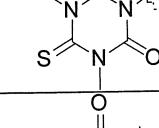
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|-----|----|---|----|--|
| 468 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 469 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,55 (s, 1H), 7,95–7,83 (m, 2H), 7,36 – 7,30 (m, 3H), 7,28 – 7,22 (m, 2H), 6,61 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 4,29 – 4,23 (m, 1H), 3,48 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 2,76 – 2,73 (m, 2H). |
| 470 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 471 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,48 (s, 1H), 7,89–7,87 (m, 2H), 6,63 (s, 1H), 3,69 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 1,89–1,87 (m, 2H), 1,53 – 1,49 (m, 3H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 472 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 473 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,98 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,89 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 474 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 475 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 8,20 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,96 – 7,91 (m, 1H), 4,89 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,49 (s, 3H), 1,47 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 476 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,91 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 5 Hz, 1H), 4,89 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,46 (s, 3H), 1,48 (d, J = |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|---------------------------------------|---|---|--|----|---|----|--|
| | | | | | | | | | 7,0 Hz, 3H). |
| 477 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,91–7,89 (m, 2H), 4,90 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,72–3,70 (m, 6H), 3,39 (s, 3H), 1,47 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 478 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,51 (s, 1H), 7,85–7,83 (m, 2H), 4,94 – 4,81 (m, 3H), 4,29 – 4,21 (m, 2H), 4,20 – 4,06 (m, 2H), 3,62–3,60 (m, 2H), 2,99 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 3H). |
| 479 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,42 (s, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 4,39 (t, <i>J</i> = 6,0 Hz, 2H), 3,63 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 2,77 (t, <i>J</i> = 6,0 Hz, 2H). |
| 480 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,42 (s, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 4,39 (t, <i>J</i> = 6,0 Hz, 2H), 4,10 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 3,44 (s, 3H), 2,75 (t, <i>J</i> = 6,0 Hz, 2H), 1,19 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 481 |  | CH(Me)CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,39 (s, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,62 (s, 1H), 4,67 (q, <i>J</i> = 6,5 Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 3,44 (s, 3H), 2,78 – 2,63 (m, 2H), 1,33 (d, <i>J</i> = 6,5 Hz, 3H). |
| 482 |  | CH ₂ CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 483 |  | CH(Me)CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 484 |  | CH(Me)CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|---|---|---|-----|----|---|----|---|
| 485 | | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,40 (s, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,59 (s, 1H), 4,16 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 3,58 (s, 3H), 3,41 (s, 3H), 2,41 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 1,95-1,89 (m, 2H). |
| 486 | | | O | O | OEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 8,02 – 7,88 (m, 2H), 6,63 (s, 1H), 5,26-5,20 (m, 1H), 4,13 (d, <i>J</i> = 7,0, 2H), 3,43 (s, 3H), 3,06 - 2,88 (m, 2H), 1,19 (d, <i>J</i> = 7,0, 3H). |
| 487 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,59 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 7,97 – 7,87 (m, 3H), 6,61 (d, <i>J</i> = 2,5 Hz, 2H), 5,01-4,98 (m, 1H), 4,49 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 1H), 4,24-4,20 (m, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,40 (s, 3H). |
| 488 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,54 (s, 1H), 7,96 – 7,85 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,73 (d, <i>J</i> = 7,5Hz, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 2,78-2,74 (m, 1H), 2,11-2,01 (m, 4H), 1,95 – 1,80 (m, 2H). |
| 489 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,98 – 7,82 (m, 2H), 6,61 (s, 1H), 4,61 (dd, <i>J</i> = 7,5, 3,0 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 2,33-2,29 (m, 1H), 1,87 – 1,30 (m, 8H). |
| 490 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,98 – 7,78 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 4,56-4,54 (m, 1H), 3,67 (a, 3H), 3,40 (s, 3H), 1,90 – 1,53 (m, 6H), 1,25-1,14 (m, 5H) |
| 491 | | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,58 (s, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 4,94 (q, <i>J</i> = 6,5 |

| | | | | | | | | | | | | | |
|-----|--|---------------------|---|---|-----|----|---|----|--|--|--|--|--|
| | | | | | | | | | | | | | |
| 492 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,63 (s, 6H), 2,89 – 2,82 (m, 2H), 1,46 (d, J = 6,5 Hz, 3H), 1,18 (t, J = 7,5 Hz, 3H). |
| 493 | | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,63 (s, 1H), 8,02 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,03 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,54 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,14 (s, 9H). |
| 494 | | C(OMe) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,57 (s, 1H), 7,92 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,82-4,81 (m, 1H), 4,71 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 3,72-3,71 (m, 3H), 3,43 (s, 3H), 3,39 (s, 3H), 3,38 (s, 3H). |
| 495 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,56 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,84 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 7,46-7,25 (m, 3H), 6,43 (s, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,53 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 3,43 (s, 3H), 1,45 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 496 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,52 (s, 1H), 7,96-7,87 (m, 2H), 6,61 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 4,29 – 4,23 (m, 1H), 3,48 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), 3,29 – 3,28 (m, 2H), 1,89 – 1,82 (m, 2H). |
| 497 | | | O | O | OMe | Cl | F | CH | | | | | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,50 (s, 1H), 7,91-7,84 (m, 2H), 6,61 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 4,29 – 4,23 (m, 1H), 3,48 (s, 3H), 3,43 (s, 3H), |

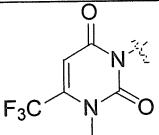
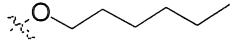
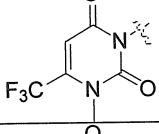
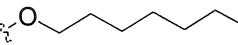
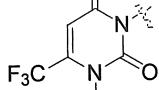
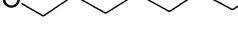
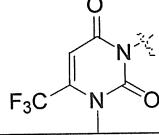
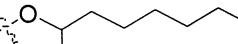
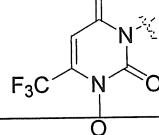
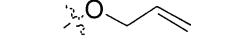
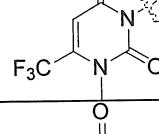
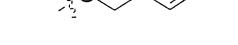
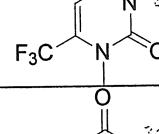
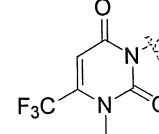
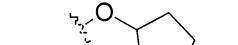
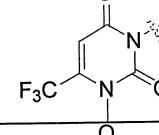
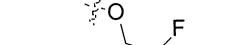
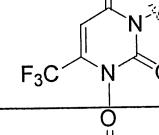
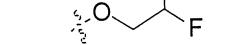
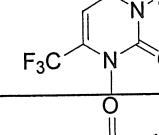
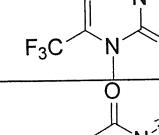
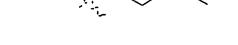
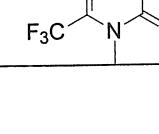
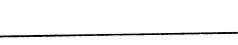
| | | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----------------|----|---|----|--|--|
| | | | | | | | | | | |
| 498 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | 3,09 – 2,96 (m, 2H), 1,84 – 1,77 (m, 2H). | |
| 499 | | CH(Me) | O | O | NH ₂ | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,52 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,58 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,42 (s, 3H), 1,40 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 500 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,50 (s, 1H), 7,94 – 7,79 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 5,90 – 5,73 (m, 1H), 4,94 – 4,82 (m, 1H), 4,76 – 4,62 (m, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,45 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 501 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,51 (s, 1H), 7,94 – 7,84 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 5,64–5,63 (m, 1H), 5,48–4,45 (m, 1H), 4,95 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 2H), 4,84–4,73 (m, 1H), 3,97–3,96 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), 1,49 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 502 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,46 (s, 1H), 7,98 – 7,79 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 5,12 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,41 (s, 3H), 3,40 – 3,34 (m, 2H), 3,21 (m, 2H), 1,37 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,12 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H), 1,00 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). | |
| 503 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,38 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 1H), 6,57 (s, 1H), 4,61–4,58 (m, 2H), 4,49–4,45 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), | |

| | | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|-----|-----------------|---|---|--|---|
| | | | | | | | | | | |
| 504 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | 1,33 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H), ^1H NMR (500 MHz, DMSO) δ 8,59-8,57 (m, 2H), 6,65 (s, 1H), 4,96-4,92 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,44 (s, 3H), 1,28 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H) |
| 505 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | |
| 506 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | |
| 507 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | |
| 508 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N | | |
| 509 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | N | | |
| 510 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N | | |
| 511 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | ^1H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,85 (s, 1H), 7,70 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 4,53 (q, $J = 7,0$ Hz, 1H), 3,73 (d, $J = 6,0$ Hz, 9H), 1,41 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H). |
| 512 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | |
| 513 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | | |
| 514 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N | | |
| 515 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | N | | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|---|--|
| 516 | | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N | |
| 517 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | N | |
| 518 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 519 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 520 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 521 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 522 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 523 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 524 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 525 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 526 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 527 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 528 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |

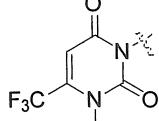
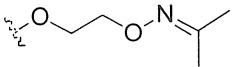
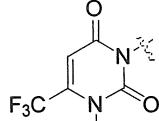
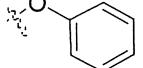
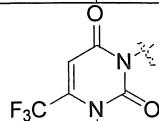
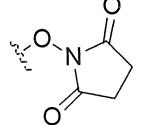
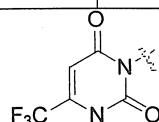
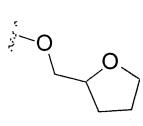
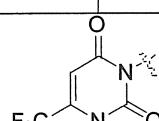
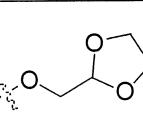
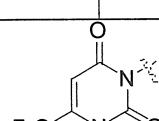
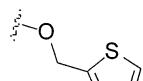
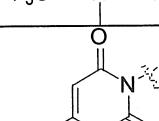
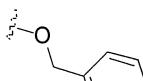
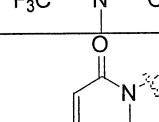
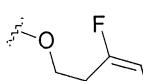
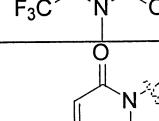
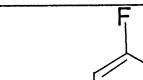
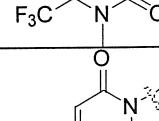
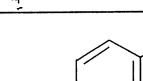
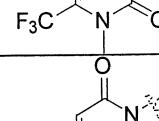
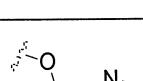
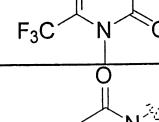
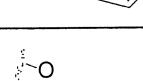
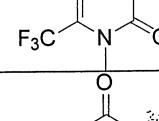
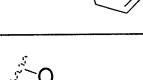
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|-----------------|---|---|--|
| 529 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 530 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 531 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 532 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 533 | | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 534 | | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 535 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 536 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 537 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 538 | | CH | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 539 | | CH | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 540 | | CH(Me) | O | O | OEt | Br | F | N | |
| 541 | | CH(Me) | O | O | OEt | CF ₃ | F | N | |

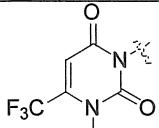
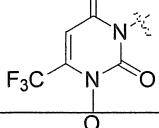
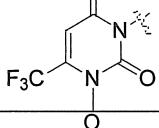
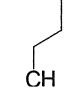
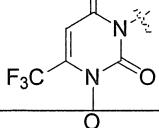
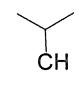
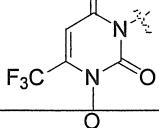
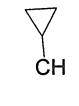
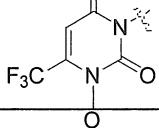
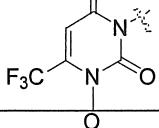
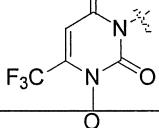
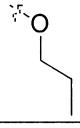
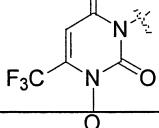
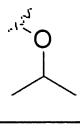
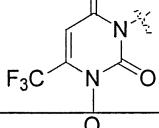
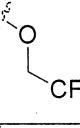
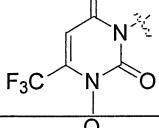
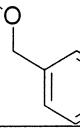
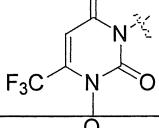
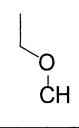
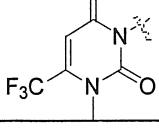
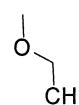
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------------------|---|---|-----|----|---|---|--|
| 542 | | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | N | |
| 543 | | CH(Me) | O | O | OEt | Br | F | N | |
| 544 | | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | N | |
| 545 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 546 | | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 547 | | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | N | |
| 548 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 549 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 550 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 551 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 552 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 553 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 554 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |

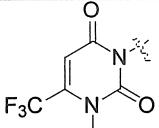
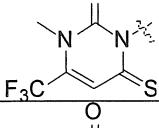
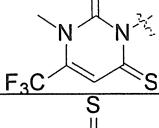
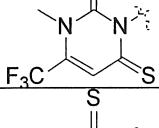
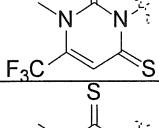
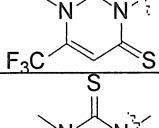
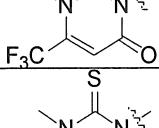
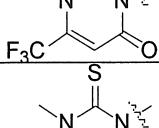
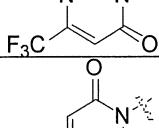
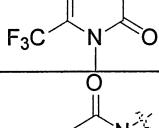
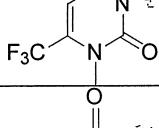
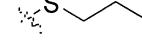
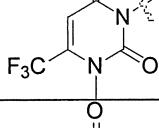
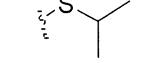
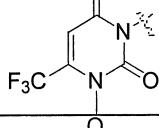
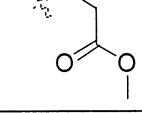
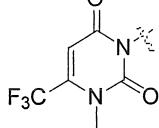
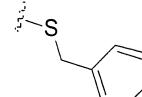
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|---|--|
| 555 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 556 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 557 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 558 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 559 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 560 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 561 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 562 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 563 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 564 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 565 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 566 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 567 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|---|--|
| 568 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 569 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 570 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 571 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 572 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 573 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 574 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 575 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 576 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 577 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 578 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 579 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 580 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |

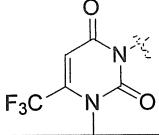
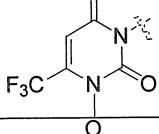
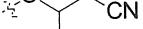
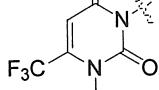
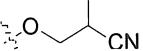
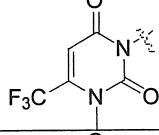
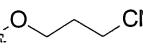
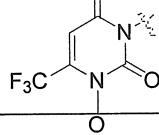
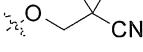
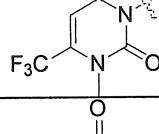
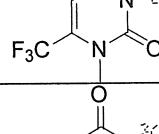
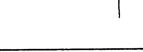
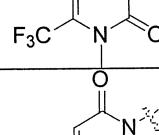
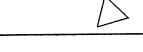
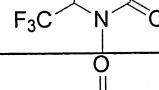
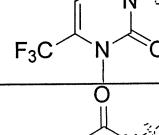
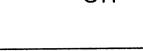
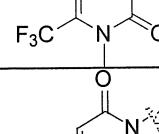
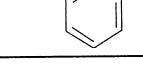
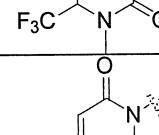
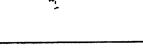
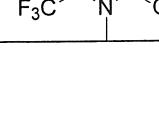
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|---|--|
| 581 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 582 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 583 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 584 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 585 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 586 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 587 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 588 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 589 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 590 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 591 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 592 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 593 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |

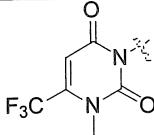
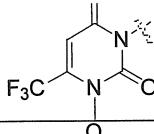
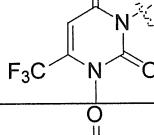
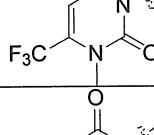
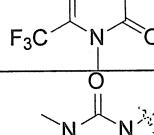
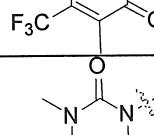
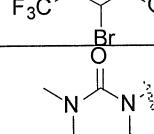
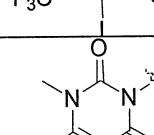
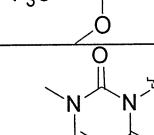
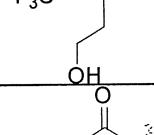
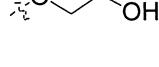
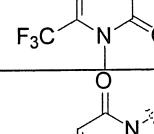
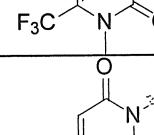
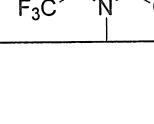
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|---|--|
| 594 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 595 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 596 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 597 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 598 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 599 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 600 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 601 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 602 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 603 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 604 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 605 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 606 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|---|--|
| 607 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 608 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 609 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 610 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 611 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 612 |  | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 613 |  | CH(OMe) | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 614 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 615 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 616 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 617 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 618 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 619 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|-----------------|---|---|--|
| 620 |  | CH(Ph) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 621 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N | |
| 622 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N | |
| 623 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N | |
| 624 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | N | |
| 625 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N | |
| 626 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N | |
| 627 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | N | |
| 628 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N | |
| 629 |  | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | N | |
| 630 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 631 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 632 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 633 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |

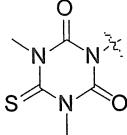
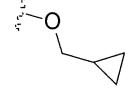
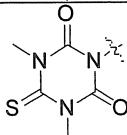
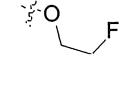
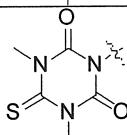
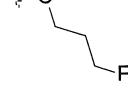
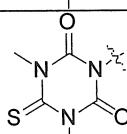
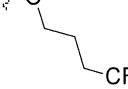
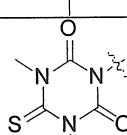
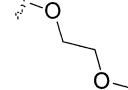
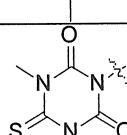
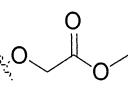
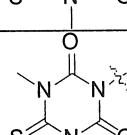
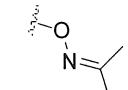
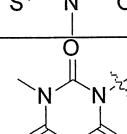
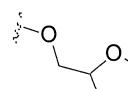
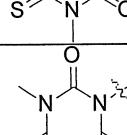
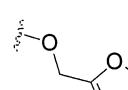
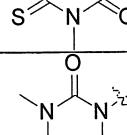
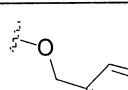
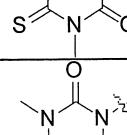
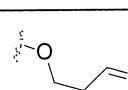
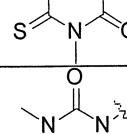
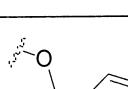
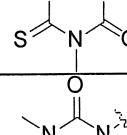
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|---|--|
| 634 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 635 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 636 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 637 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 638 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 639 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 640 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 641 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 642 | | C(Me)2 | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 643 | | C(Me)2 | O | O | | Cl | F | N | |
| 644 | | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | N | |
| 645 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 646 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |

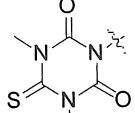
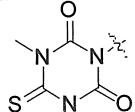
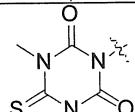
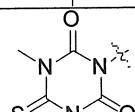
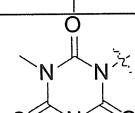
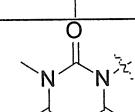
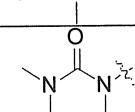
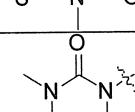
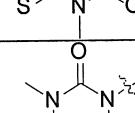
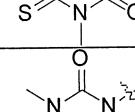
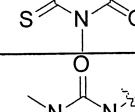
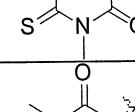
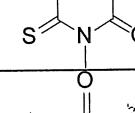
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|---|--|
| 647 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 648 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 649 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 650 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 651 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 652 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 653 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 654 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 655 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 656 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 657 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 658 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N | |
| 659 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | N | |

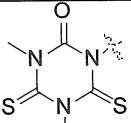
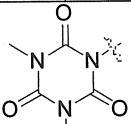
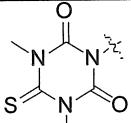
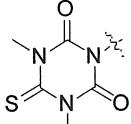
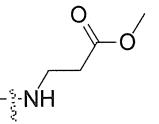
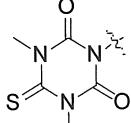
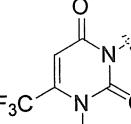
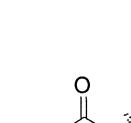
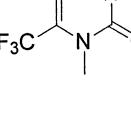
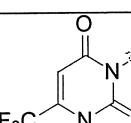
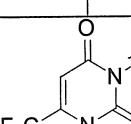
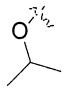
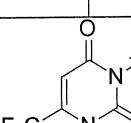
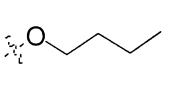
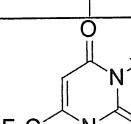
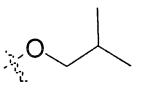
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|---|--|
| 660 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 661 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 662 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 663 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 664 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 665 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 666 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 667 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 668 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 669 |  |  | O | O |  | Cl | F | N | |
| 670 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 671 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 672 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|---|---|---|-----|----|---|---|--|
| 673 | | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 674 | | | O | O | OEt | Cl | F | N | |
| 675 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 676 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 677 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 678 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 679 | | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | N | |
| 680 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 681 | | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 682 | | C(OMe) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 683 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 684 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |
| 685 | | | O | O | OMe | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----------------|----|---|----|--|
| 686 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 687 | | CH(Me) | O | O | NH ₂ | Cl | F | N | |
| 688 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 689 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 690 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 691 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N | |
| 692 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 7,96 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,12 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,66 (s, 3H), 3,47 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 1,56 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 693 | | CH(Me) | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 694 | | CH(Me) | S | S | OEt | Cl | F | CH | |
| 695 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 696 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 697 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |

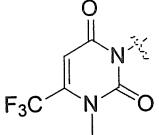
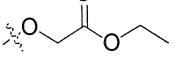
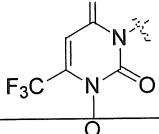
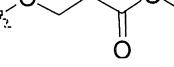
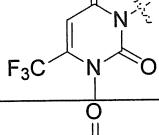
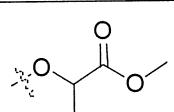
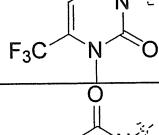
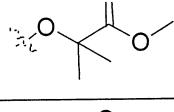
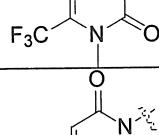
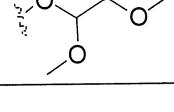
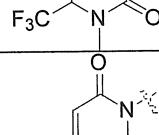
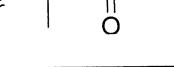
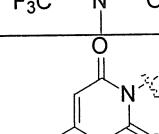
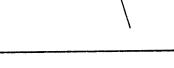
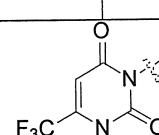
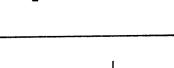
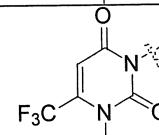
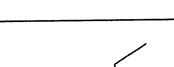
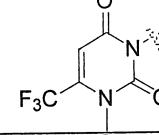
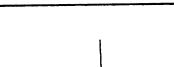
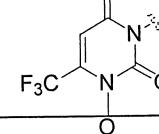
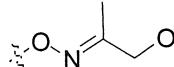
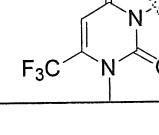
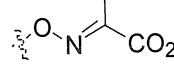
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 698 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 699 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 700 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 701 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 702 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 703 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 704 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 705 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 706 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 707 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 708 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 709 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 710 |  | CH(F) | S | O | OEt | Cl | F | CH | |

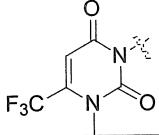
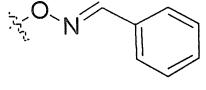
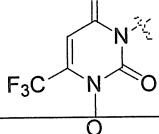
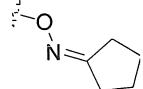
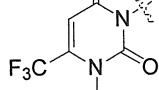
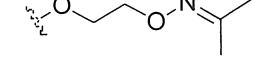
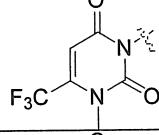
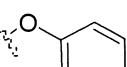
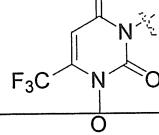
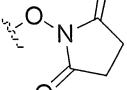
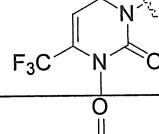
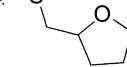
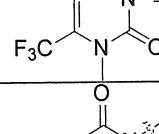
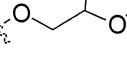
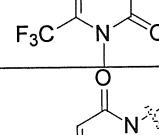
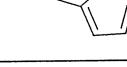
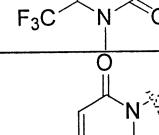
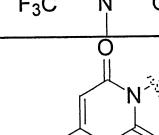
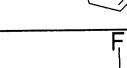
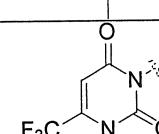
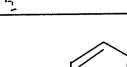
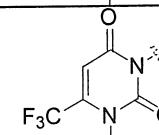
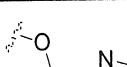
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|-----|-----------------|---|----|--|
| 711 |  | CH(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 712 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 713 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 714 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 715 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 716 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 717 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Br | F | CH | |
| 718 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Br | F | CH | |
| 719 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CF ₃ | F | CH | |
| 720 |  | CH(Me) | S | O | OEt | CF ₃ | F | CH | |
| 721 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH | |
| 722 |  | CH(Me) | S | O | OEt | CN | F | CH | |
| 723 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |

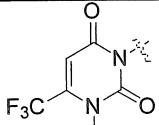
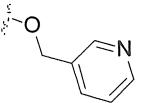
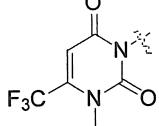
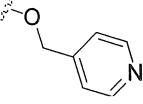
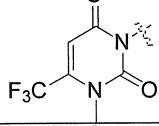
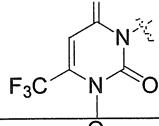
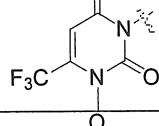
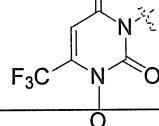
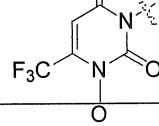
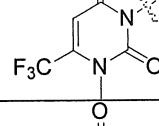
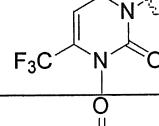
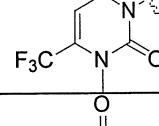
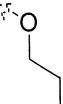
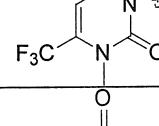
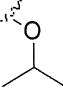
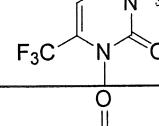
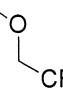
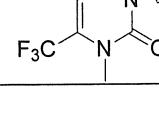
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------------------|---|---|--|----|---|----|--|
| 724 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Br | F | CH | |
| 725 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 726 |  | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 727 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 728 |  | C(Me) ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 729 |  | CH(Me) | S | O | OH | Cl | F | CH | |
| 730 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | 1H NMR (500 MHz, Chloroform-d) δ 7,28 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,74 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 6,08 (s, 1H), 3,80 (s, 6H), 3,47 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 1,53 (d, J = 7,0 Hz, 3H). |
| 731 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 732 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 733 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 734 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 735 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |

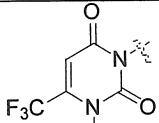
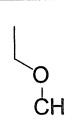
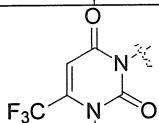
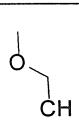
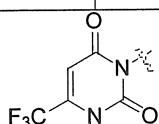
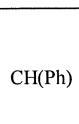
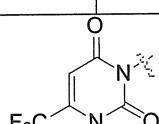
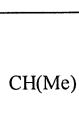
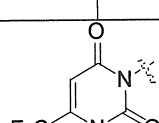
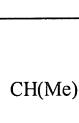
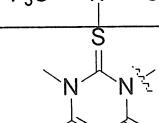
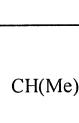
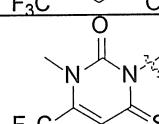
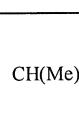
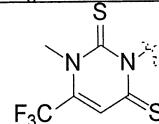
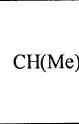
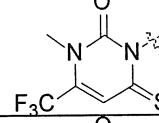
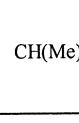
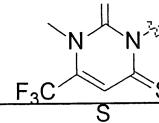
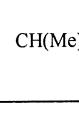
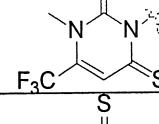
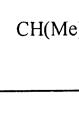
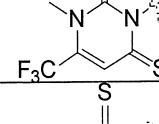
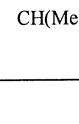
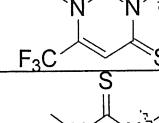
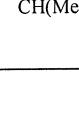
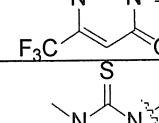
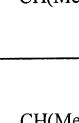
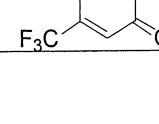
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 736 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 737 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 738 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 739 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 740 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 741 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 742 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 743 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 744 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 745 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 746 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 747 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 748 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 749 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 750 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 751 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 752 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 753 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 754 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 755 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 756 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 757 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 758 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 759 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 760 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 761 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |

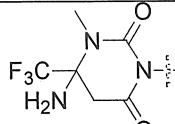
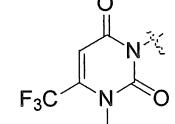
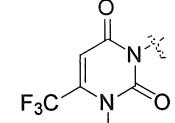
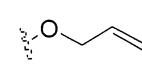
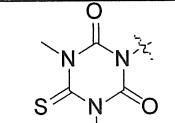
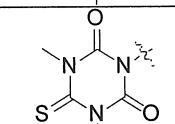
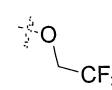
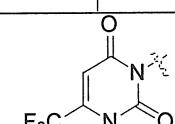
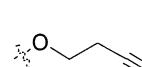
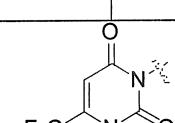
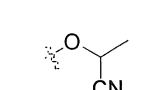
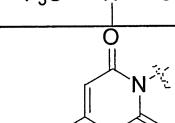
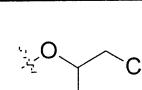
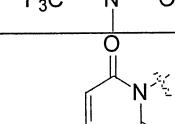
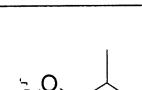
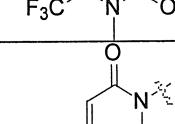
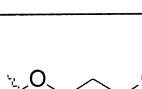
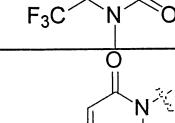
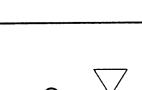
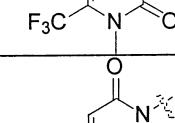
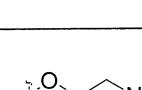
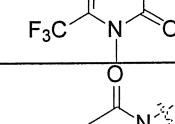
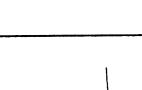
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 762 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 763 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 764 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 765 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 766 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 767 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 768 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 769 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 770 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 771 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 772 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 773 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 774 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|--|
| 775 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 776 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 777 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 778 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 779 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 780 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 781 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 782 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 783 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 784 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 785 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 786 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 787 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |

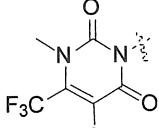
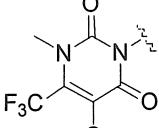
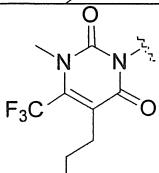
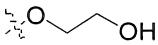
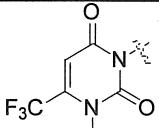
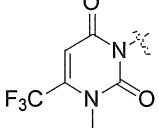
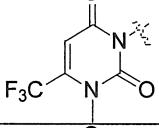
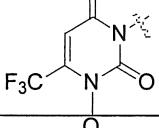
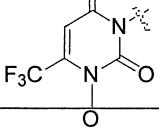
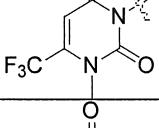
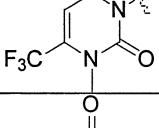
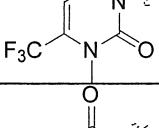
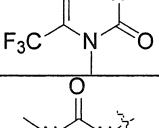
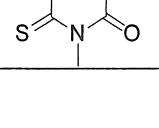
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|----|--|
| 788 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 789 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 790 |  | CH(F) | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 791 |  | CH(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 792 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 793 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 794 |  |  | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 795 |  | CH(OMe) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 796 |  | CH(OMe) | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 797 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 798 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 799 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 800 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH | |

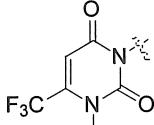
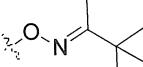
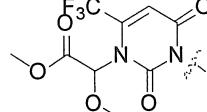
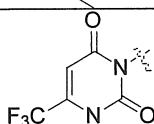
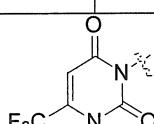
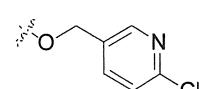
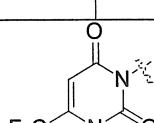
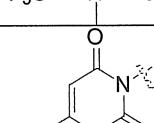
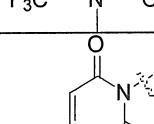
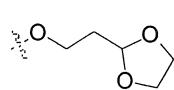
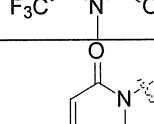
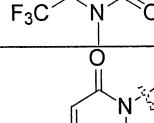
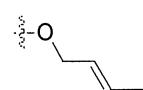
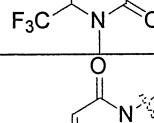
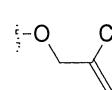
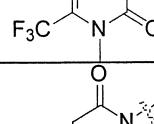
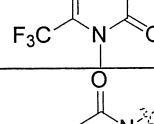
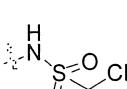
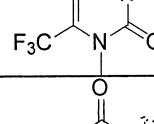
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|-----|-----|---|----|--|
| 801 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 802 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 803 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 804 |  |  | S | O | OMe | CF3 | F | CH | |
| 805 |  |  | S | O | OMe | CN | F | CH | |
| 806 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 807 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 808 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 809 |  |  | S | O | OMe | Br | F | CH | |
| 810 |  |  | S | O | OMe | CN | F | CH | |
| 811 |  |  | S | O | OMe | Br | F | CH | |
| 812 |  |  | S | O | OMe | CF3 | F | CH | |
| 813 |  |  | S | O | OMe | CN | F | CH | |
| 814 |  |  | S | O | OMe | Br | F | CH | |
| 815 |  |  | S | O | OMe | CF3 | F | CH | |

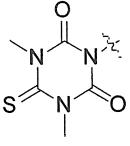
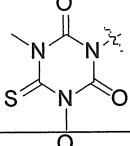
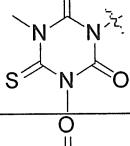
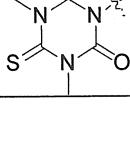
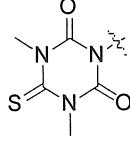
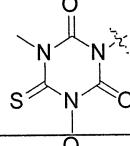
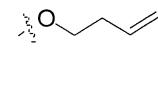
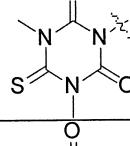
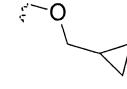
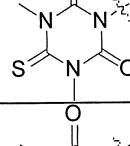
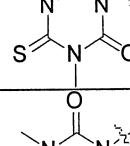
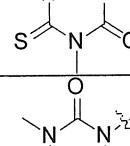
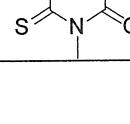
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 816 | | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH | |
| 817 | | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 818 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 819 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 820 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 821 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 822 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 823 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 824 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 825 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 826 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 827 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 828 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |

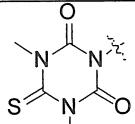
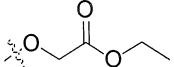
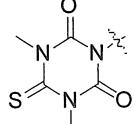
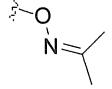
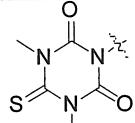
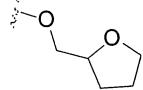
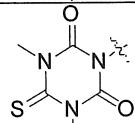
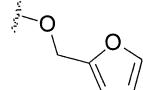
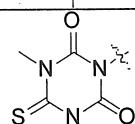
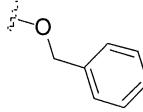
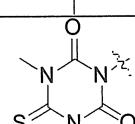
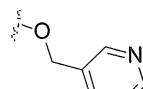
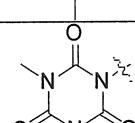
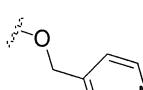
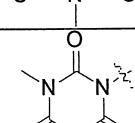
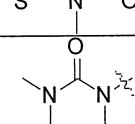
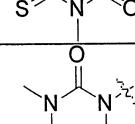
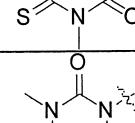
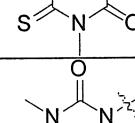
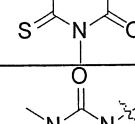
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------------------|---|---|--|----|---|----|--|
| 829 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 830 |  | C(Me) ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 831 |  | C(Me) ₂ | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 832 |  | CH(Me) | S | O | OH | Cl | F | CH | |
| 833 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 834 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 835 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 836 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 837 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 838 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 839 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 840 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 841 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |

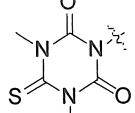
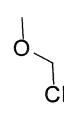
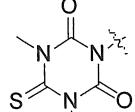
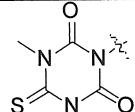
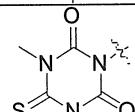
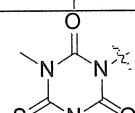
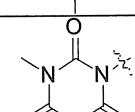
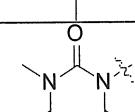
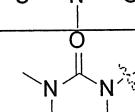
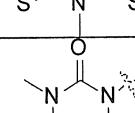
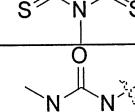
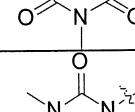
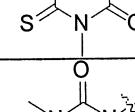
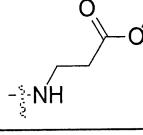
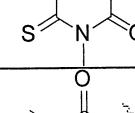
| | | | | | | | | | |
|-----|--|-----------|---|---|-----|----|---|----|--|
| 842 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 843 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 844 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 845 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 846 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH | |
| 847 | | | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 848 | | | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 849 | | | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 850 | | | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 851 | | | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 852 | | C(Me)(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 853 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 854 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |

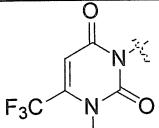
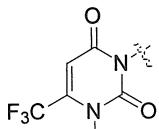
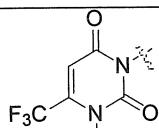
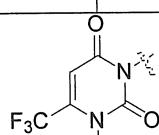
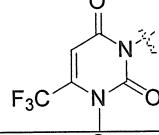
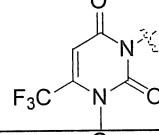
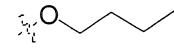
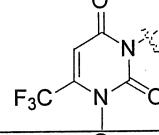
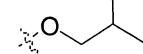
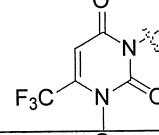
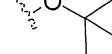
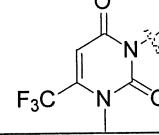
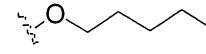
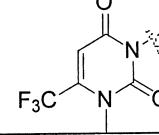
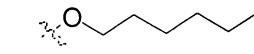
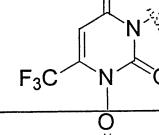
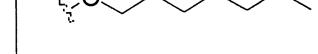
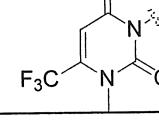
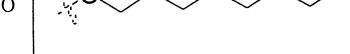
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|----|--|
| 855 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 856 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 857 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 858 |  | CH ₂ CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 859 |  | CH ₂ CH ₂ | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 860 |  | CH(Me)CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 861 |  | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 862 |  |  | S | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 863 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 864 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 865 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 866 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 867 |  | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|---------------------|---|---|--|----|---|----|--|
| 868 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 869 |  | CH(OMe) | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 870 |  | C(OMe) ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 871 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 872 |  | CH ₂ OH | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 873 |  | CH ₂ Cl | S | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 874 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 875 |  | CH(Me) | S | O | NH ₂ | Cl | F | CH | |
| 876 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 877 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 878 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 879 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH | |
| 880 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | N | |

| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---------|---|--|----|---|----|--|
| 881 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,24 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 7,25 – 7,19 (m, 2H), 4,46 (s, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,65 (s, 3H), 3,56 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 1,27 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 882 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 883 |  | CH(Me) | NH | S | OEt | Cl | F | CH | |
| 884 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 885 |  | CH(Me) | N Me | O |  | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,32 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 7,25 – 7,19 (m, 2H), 4,95–4,90 (m, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,56 (q, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 3,00 (s, 3H), 1,21–1,19 (m, 6H), 1,16 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 3H). |
| 886 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 887 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 888 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 889 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 890 |  | CH(Me) | N Me | O |  | Cl | F | CH | |
| 891 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

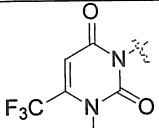
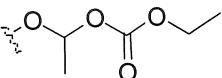
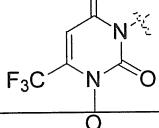
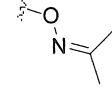
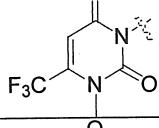
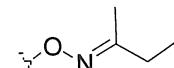
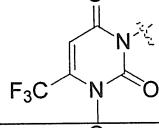
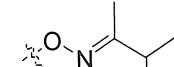
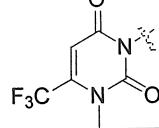
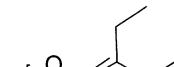
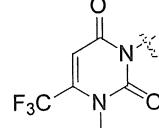
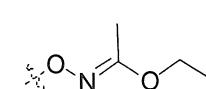
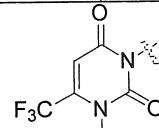
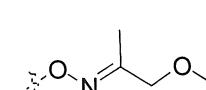
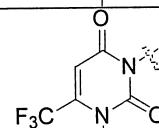
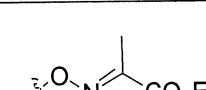
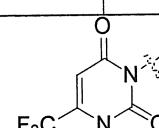
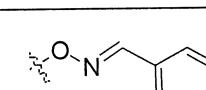
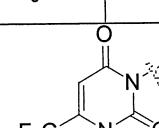
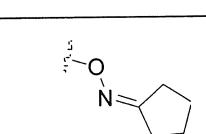
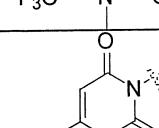
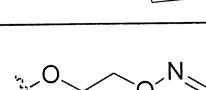
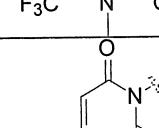
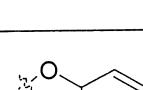
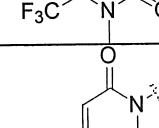
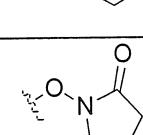
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|-----|---|--|----|---|----|--|
| 892 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 893 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 894 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 895 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 896 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 897 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 898 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 899 |  | CH(F) | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 900 |  | CH(Et) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 901 |  | CH | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 902 |  | CH | NEt | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 903 |  | CH | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 904 |  | CH | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |

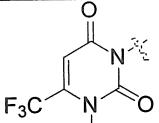
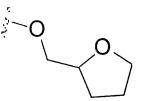
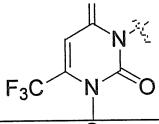
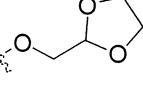
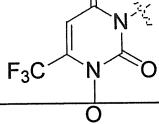
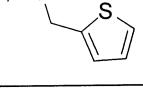
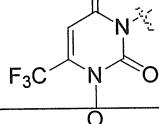
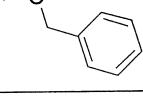
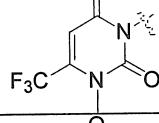
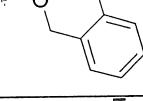
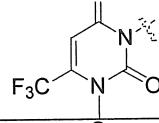
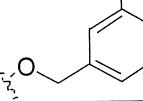
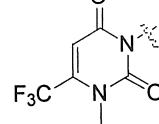
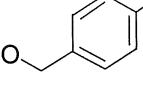
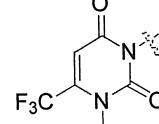
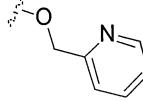
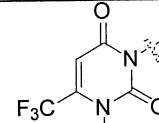
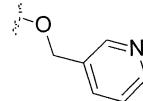
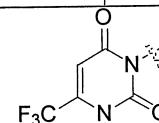
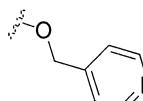
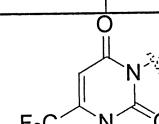
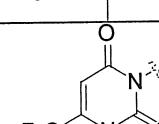
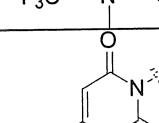
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|----|---|--|-----------------|---|----|--|
| 905 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 906 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH | |
| 907 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | Br | F | CH | |
| 908 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CF ₃ | F | CH | |
| 909 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | CF ₃ | F | CH | |
| 910 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH | |
| 911 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | CN | F | CH | |
| 912 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 913 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | Br | F | CH | |
| 914 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 915 |  | CH(Me) | NH | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 916 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 917 |  | C(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |

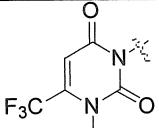
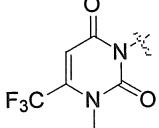
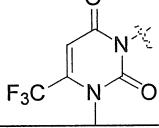
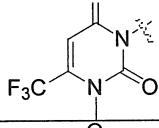
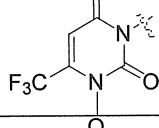
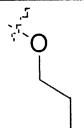
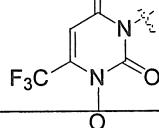
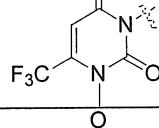
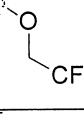
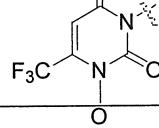
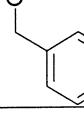
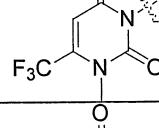
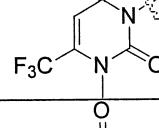
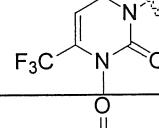
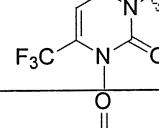
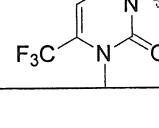
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|-----|---|--|----|---|----|--|
| 918 |  | CH(Me) | NH | O | OH | Cl | F | CH | |
| 919 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | ¹ H NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,01 (t, J = 4,5 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,57 (s, 1H), 4,56 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 3,40 (s, 3H), 1,90 (s, 3H). |
| 920 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 921 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 922 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 923 |  | CH(Me) | NEt | O |  | Cl | F | CH | |
| 924 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 925 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 926 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 927 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 928 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 929 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

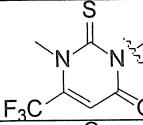
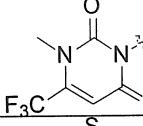
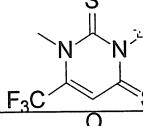
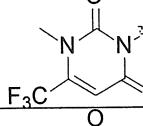
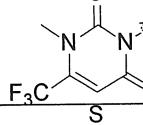
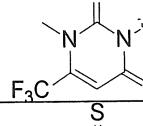
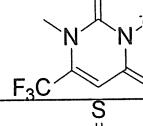
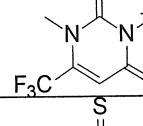
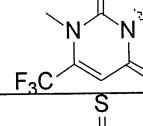
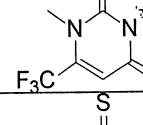
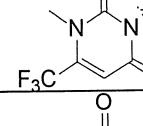
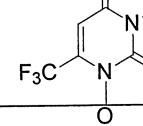
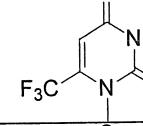
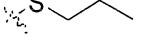
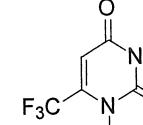
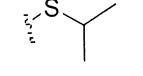
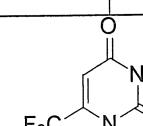
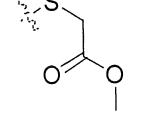
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|-----|---|--|----|---|----|--|
| 930 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 931 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 932 | | CH(Me) | NMe | O | | Cl | F | CH | |
| 933 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 934 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 935 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 936 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 937 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 938 | | CH(Me) | NEt | O | | Cl | F | CH | |
| 939 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 940 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 941 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 942 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |

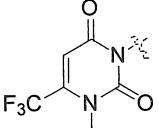
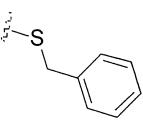
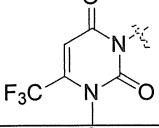
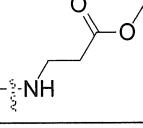
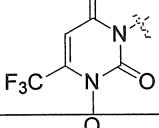
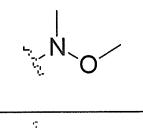
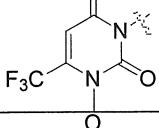
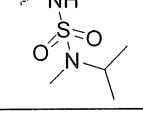
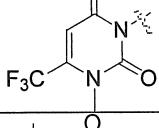
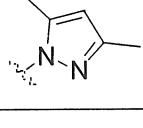
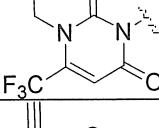
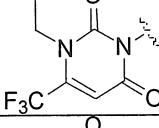
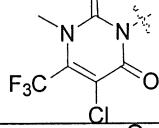
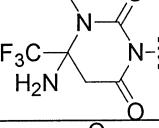
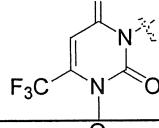
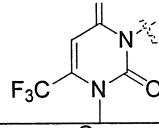
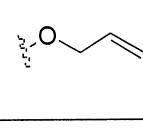
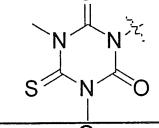
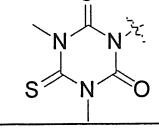
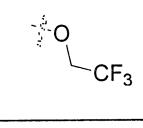
| | | | | | | | | | |
|-----|--|--------|----|---|--|----|---|----|--|
| 943 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 944 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 945 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 946 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 947 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 948 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 949 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 950 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 951 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 952 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 953 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 954 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |
| 955 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH | |

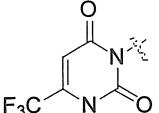
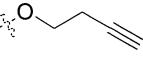
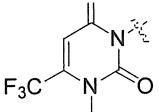
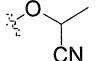
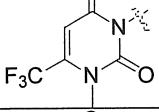
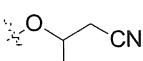
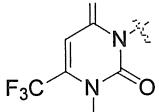
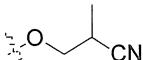
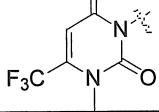
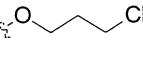
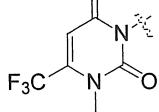
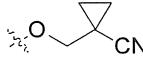
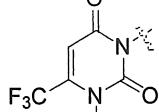
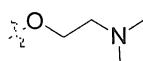
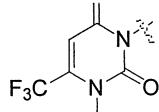
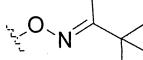
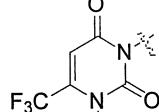
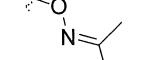
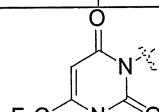
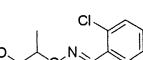
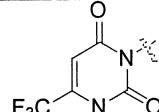
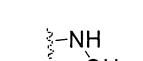
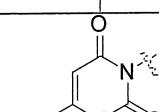
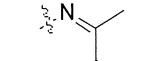
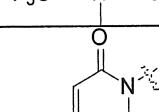
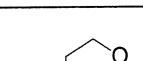
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|----|---|--|----|---|----|--|
| 956 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 957 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 958 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 959 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 960 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 961 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 962 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 963 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 964 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 965 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 966 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 967 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 968 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

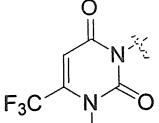
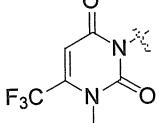
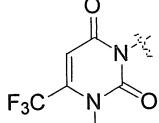
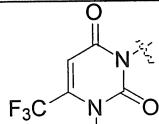
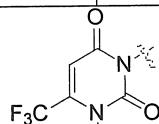
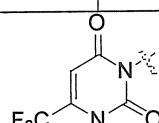
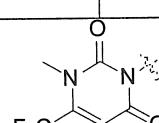
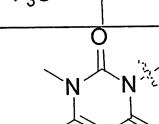
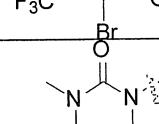
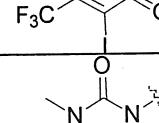
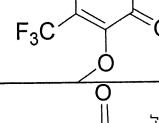
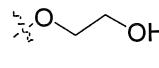
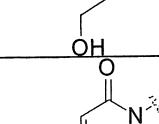
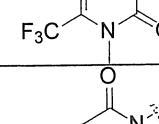
| | | | | | | | | | |
|-----|---|--------|----|---|--|----|---|----|--|
| 969 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 970 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 971 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 972 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 973 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 974 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 975 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 976 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 977 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 978 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 979 |  | CH(F) | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 980 |  | CH(Et) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 981 |  | CH | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |

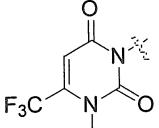
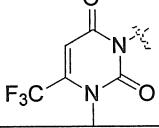
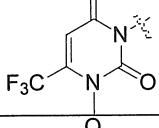
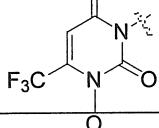
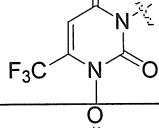
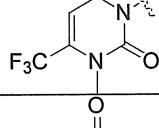
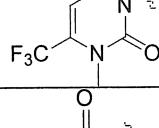
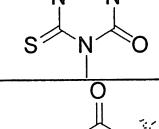
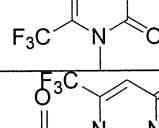
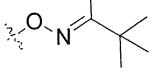
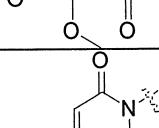
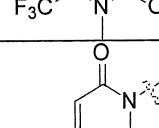
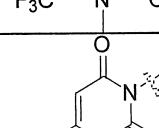
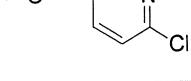
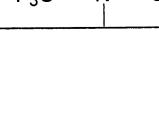
| | | | | | | | | | |
|-----|---|---|----|---|--|-----|---|----|--|
| 982 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 983 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 984 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 985 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 986 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 987 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 988 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 989 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 990 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 991 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 992 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 993 |  |  | NH | O | OMe | CF3 | F | CH | |
| 994 |  |  | NH | O | OMe | CN | F | CH | |

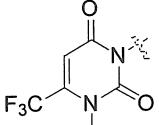
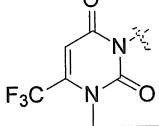
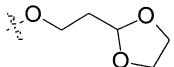
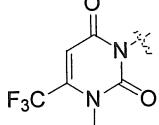
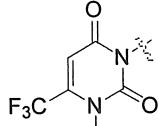
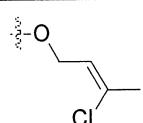
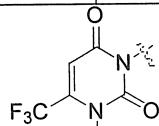
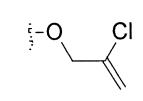
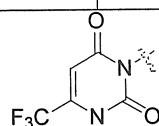
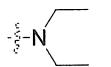
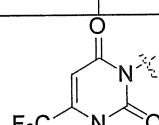
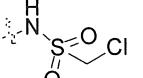
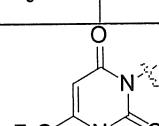
| | | | | | | | | | |
|------|---|--------|----|---|--|-----------------|---|----|--|
| 995 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 996 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 997 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 998 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH | |
| 999 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH | |
| 1000 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH | |
| 1001 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CF ₃ | F | CH | |
| 1002 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH | |
| 1003 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH | |
| 1004 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CF ₃ | F | CH | |
| 1005 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH | |
| 1006 |  | CH(Me) | NH | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 1007 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1008 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1009 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|------|---|--------|----|---|--|----|---|----|--|
| 1010 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1011 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1012 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1013 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1014 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1015 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1016 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1017 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1018 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1019 |  | C(Me)2 | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1020 |  | C(Me)2 | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1021 |  | CH(Me) | NH | O | OH | Cl | F | CH | |
| 1022 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

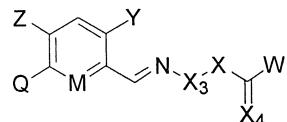
| | | | | | | | | | |
|------|---|--------|----|---|--|----|---|----|--|
| 1023 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1024 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1025 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1026 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1027 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1028 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1029 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1030 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1031 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1032 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1033 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1034 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1035 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|--|----|---|----|--|
| 1036 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1037 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1038 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1039 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1040 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1041 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1042 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1043 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1044 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1045 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1046 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1047 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1048 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|--|----|---|----|--|
| 1049 |  | CH(Me)CH ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1050 |  | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1051 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH | |
| 1052 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1053 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1054 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1055 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1056 |  | CH(Me) | NH | O | SEt | Cl | F | CH | |
| 1057 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1058 |  | CH(OMe) | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1059 |  | C(OMe) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1060 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1061 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |

| | | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|--|----|---|----|--|
| 1062 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH | |
| 1063 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1064 |  | CH(Me) | NH | O | NH ₂ | Cl | F | CH | |
| 1065 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1066 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1067 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1068 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH | |
| 1069 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | N | |

Bảng A được cấu tạo theo cách tương tự giống như Bảng 1 ở trên, ngoại trừ việc thay



thé các hợp chất raxemate có tâm bất đối xứng (I), trong đó, X là -C*X₁X₂-(alkyl)_n-, -alkyl-C*X₁X₂-(alkyl)_n-, tức là, X₁, X₂ không giống nhau, nguyên tử cacbon ở vị trí * là trung tâm bất đối xứng) (tức là, các hợp chất 1-188, 193-432, 438-439, 441-469, 471-478, 481-484, 486-493, 495-545, 547-641, 644-669, 672, 674-681, 683-727, 729-829, 832-857, 860, 862-869, 871-916, 918-1018, 1021-1046, 1049, 1051-1058 và 1060-1069) bằng các hợp chất tương đương với cấu hình R và xóa các hợp chất không có tâm bất đối tại vị trí tương ứng, và trong Bảng A, các mục trong cột "Số" được liệt kê theo trình tự là “1(R)-188(R), 193(R)-432(R), 438(R)-439(R), 441(R)-469(R), 471(R)-478(R), 481(R)-484(R), 486(R)-493(R), 495(R)-545(R), 547(R)-641(R), 644(R)-669(R), 672(R), 674(R)-681(R), 683(R)-727(R), 729(R)-829(R), 832(R)-857(R), 860(R), 862(R)-869(R),

871(R)-916(R), 918(R)-1018(R), 1021(R)-1046(R), 1049(R), 1051(R)-1058(R) và 1060(R)-1069(R)". Ví dụ, "1(R)" tương ứng với cấu hình R của hợp chất "1" trong Bảng 1, "194(R)" tương ứng với cấu hình R của hợp chất "194" trong Bảng 1.

Phương pháp điều chế hợp chất theo sáng chế sẽ được giải thích chi tiết trong chương trình và phương án sau. Nguyên liệu có sẵn trên thị trường hoặc được chuẩn bị thông qua phương pháp đã biết được báo cáo trong tài liệu chuyên ngành hoặc được biểu thị trong con đường tổng hợp. Người có trình độ trung bình trong lĩnh vực này nên hiểu rằng hợp chất theo sáng chế cũng có thể được tổng hợp bằng con đường tổng hợp khác. Mặc dù vật liệu và điều kiện phản ứng chi tiết trong con đường tổng hợp đã được giải thích trong văn bản sau đây, nó vẫn dễ dàng bị thay thế bằng vật liệu và điều kiện tương tự khác. Đồng phân của hợp chất, ví dụ, được tạo ra với sự biến đổi của phương pháp điều chế theo sáng chế được bao gồm trong phạm vi của sáng chế. Ngoài ra, phương pháp điều chế sau đây có thể được biến đổi thêm theo các bộ phận của sáng chế bằng cách sử dụng phương pháp hóa học phổ biến mà người có trình độ trung bình trong lĩnh vực này biết, ví dụ, bảo vệ nhóm thích hợp trong quá trình phản ứng, v.v.

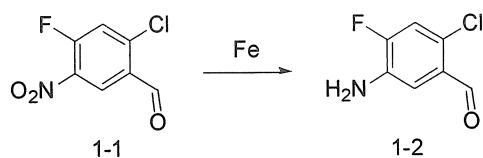
Phương pháp áp dụng sau đây có thể được sử dụng để nâng cao hiểu biết thêm về phương pháp điều chế theo sáng chế. Vật liệu, loại và tình trạng cụ thể đã được xác định để tiếp tục triển khai sáng chế, không phải là bất kỳ giới hạn nào trong phạm vi hợp lý của sáng chế đó. Thuốc thử của hợp chất tổng hợp sau được trình bày trong bảng có thể được mua từ thị trường hoặc dễ dàng được điều chế bởi những người có trình độ trung bình trong lĩnh vực này.

Ví dụ thực hiện sáng chế

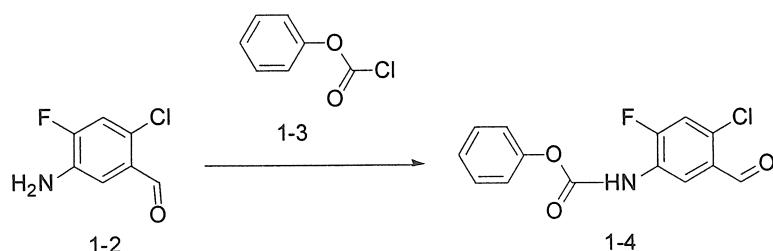
Ví dụ về các hợp chất đại diện như sau, phương pháp tổng hợp của các hợp chất khác cũng tương tự, và sẽ không được mô tả chi tiết ở đây,

1. Tổng hợp hợp chất 1

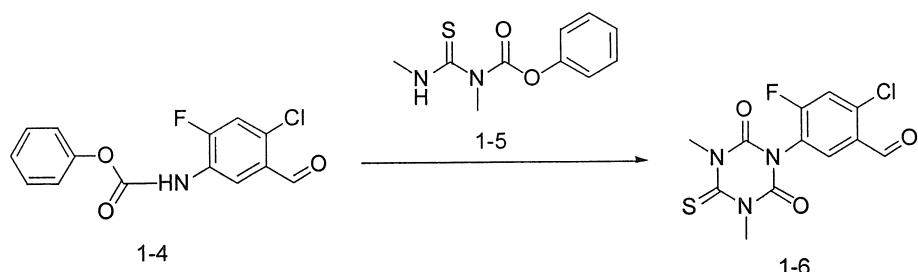
1) 1-1 (10g, 49,1 mmol, 1,0 eq), bột Fe (8,23g, 147,4 mmol, 3,0 eq), NH₄Cl (5,26g, 98,3 mmol, 2,0 eq) và nước (50 ml) được bổ sung vào 500 ml dung dịch EtOH theo trình tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 80°C trong 1 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy sự biến mất của các nguyên liệu thô. Sau khi lọc, dung dịch được cô cạn để loại bỏ etanol và sau đó được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (100ml*1), và sau đó được cô cạn để thu 1-2 (12g, sản phẩm thô) (chất rắn màu đen).



2) 1-2 (12g, 69,1 mmol, 1,0 eq, sản phẩm khô) được bô sung vào 100 ml dung dịch toluen. Sau đó, 1-3 (10,8g, 69,1 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 100°C. Sau khi hoàn thành bô sung, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 100°C trong 1 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy sự biến mất của các nguyên liệu thô, và sự tạo ra sản phẩm. Dung dịch phản ứng được cô cạn để loại bỏ toluen. Sản phẩm khô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 1-4 (5g) (chất rắn màu vàng).

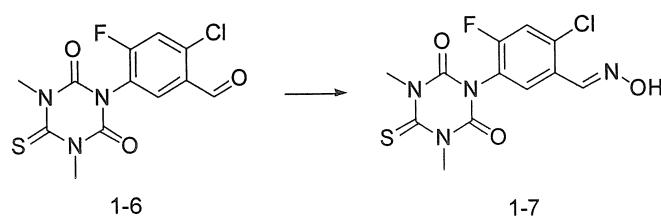


3) 1-5 (3,8g, 17,0 mmol, 1,0 eq) và AcONa (0,7g, 8,5 mmol, 0,5 eq) được bô sung vào 50 ml dung dịch DMF. Sau đó, 1-4 (5g, 17,0 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 60°C. Sau khi hoàn thành bô sung, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 60°C trong 1 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy sự biến mất của các nguyên liệu thô, và sự xuất hiện đỉnh mới. Sau khi bô sung nước (50ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (100ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm khô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 1-6 (4,0g, hiệu suất 71,3%) (chất rắn màu trắng).

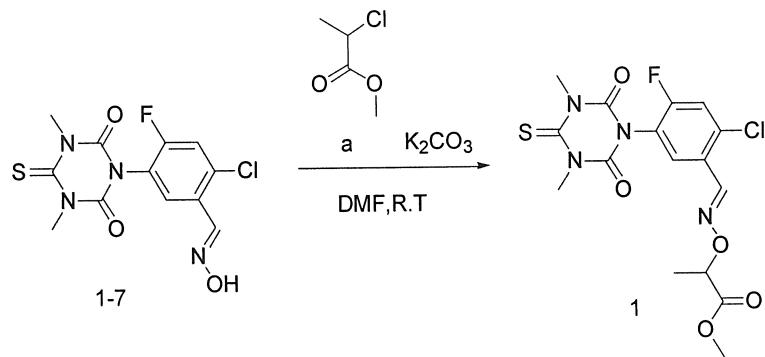


4) 1-6 (4g, 12,1 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào 40 ml of EtOH, và sau đó NH₂OHHCl (0,93g, 13,3 mmol, 1,1 eq) dung dịch nước (6 ml) được bô sung từng giọt vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 0°C. Sau khi hoàn thành bô sung, dung dịch phản ứng được khuấy ở nhiệt độ 0°C trong 2 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy rằng các nguyên liệu thô hầu hết được tiêu thụ, và một đỉnh chính mới xuất hiện. Dung dịch phản ứng được cô cạn để loại bỏ một phần etanol và sau đó được rót 10 ml nước, tạo ra một chất rắn kết tủa. Sau khi lọc,

bánh lọc được rửa bằng nước và được sấy khô để thu 1-7 (7g, hiệu suất 71,7%) (chất rắn màu trắng).

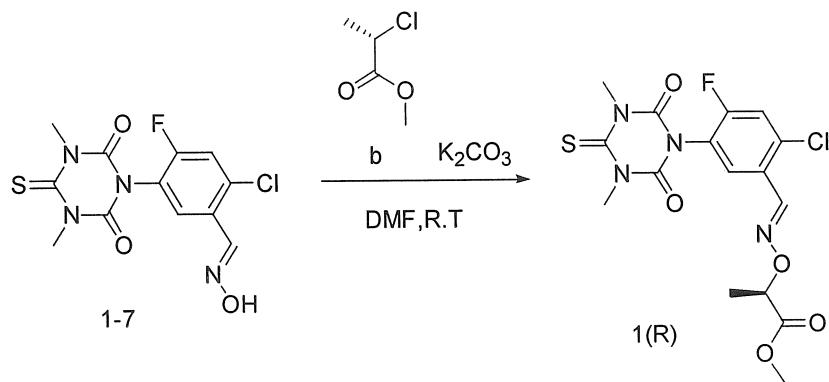


5) 1-7 (0,2g, 0,58 mmol, 1,0 eq), a (0,14g, 1,1 mmol, 2 eq) và K₂CO₃ (0,24g, 1,74 mmol, 3 eq) được bỏ sung vào 5 mL dung dịch DMF theo trình tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ phòng trong 4 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy sự biến mất của các nguyên liệu thô, và có tất cả các đỉnh sản phẩm. Sau khi bỏ sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (10ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 1 (0,15g, hiệu suất 60 %) (chất rắn màu trắng).



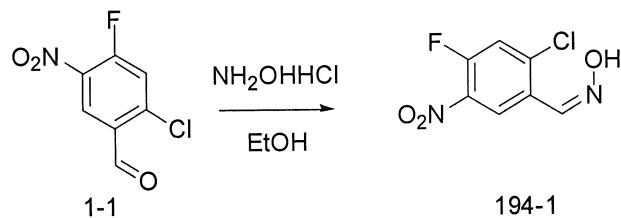
2. Tổng hợp hợp chất cấu hình 1(R)

1-7 (0,2g, 0,58 mmol, 1,0 eq), b (0,14g, 1,1 mmol, 2 eq), K₂CO₃ (0,24g, 1,74 mmol, 3 eq) được bỏ sung vào 5 mL dung dịch DMF theo trình tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ phòng trong 4 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy sự biến mất của các nguyên liệu thô, và có tất cả các đỉnh sản phẩm. Sau khi bỏ sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (10ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 1(R) (0,15g, hiệu suất 60%, R/S=98/2) (chất rắn màu trắng).

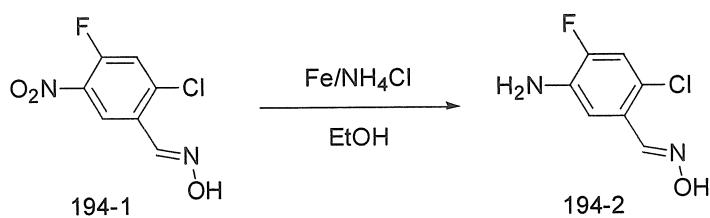


3. Tổng hợp hợp chất 194(R)

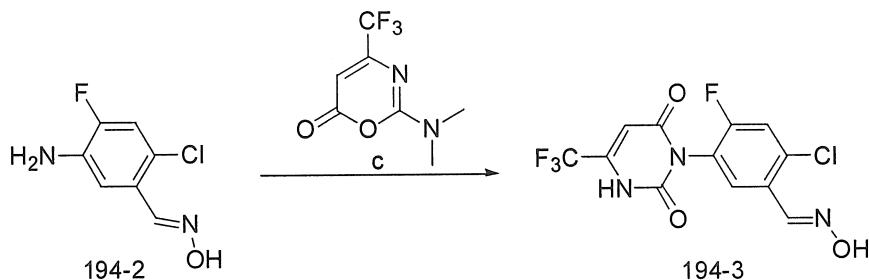
1) 1-1 (20g, 98,3 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào 200 ml EtOH, và sau đó dung dịch nước NH_2OHHCl (7,5g, 108,1 mmol, 1,1 eq) (30 ml) được bô sung từng giọt vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 0°C. Sau khi hoàn thành bô sung, dung dịch phản ứng được khuấy ở nhiệt độ 0°C trong 3 giờ. Thử nghiệm LCMS cho thấy rằng các nguyên liệu thô hầu hết đã được tiêu thụ và một đỉnh chính mới xuất hiện. Dung dịch phản ứng được cô cạn để loại bỏ một phần etanol và sau đó được rót vào 100 ml nước, tạo ra một chất rắn kết tủa. Sau khi lọc, bánh lọc được rửa bằng nước và được sấy khô để thu 194-1 (20g, hiệu suất 93%) (chất rắn màu trắng).



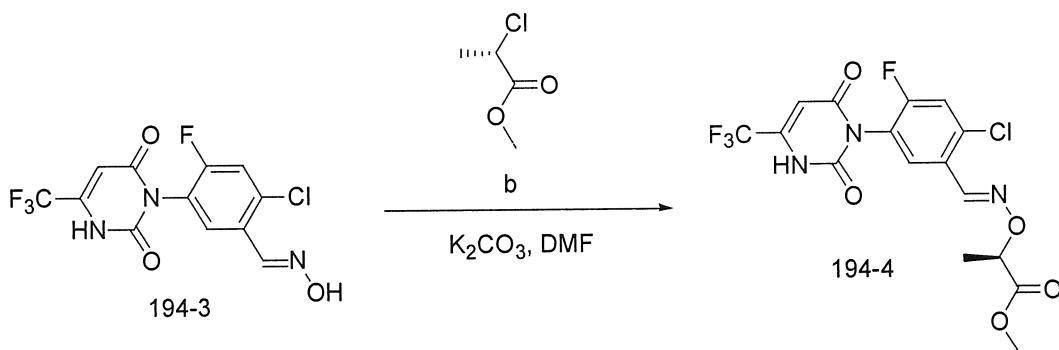
2) 194-1 (5g, 22,9 mmol, 1,0 eq), bột Fe (3,8g, 68,6 mmol, 3 eq), NH_4Cl (2,5g, 45,8 mmol, 2 eq) và nước (10ml) được bô sung vào 50 ml EtOH theo thứ tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 80°C trong 1 giờ. Thử nghiệm LCMS cho thấy sự xuất hiện của đỉnh sản phẩm. Dung dịch phản ứng được lọc bằng xelit và sau đó được cô cạn để loại bỏ etanol. Sau khi bô sung nước (20ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat và sau đó được cô cạn để thu sản phẩm thô màu đen. Sản phẩm thô được tách và được tinh chế bằng sắc ký cột để thu 194-2 (2g, hiệu suất 46,4%) (chất rắn màu xám).



3) 194-2 (1g, 5,3 mmol, 1,0 eq) và c (1,1g, 5,3 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào 20 ml axit axetic, và dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 110°C trong 1 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy rằng phản ứng của các nguyên liệu thô về cơ bản được hoàn thành, và có một đỉnh của sản phẩm chính. Dung dịch phản ứng được cô cạn để loại bỏ dung môi. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 194-3 (1,5g, hiệu suất 80,5%) (chất rắn màu trắng).

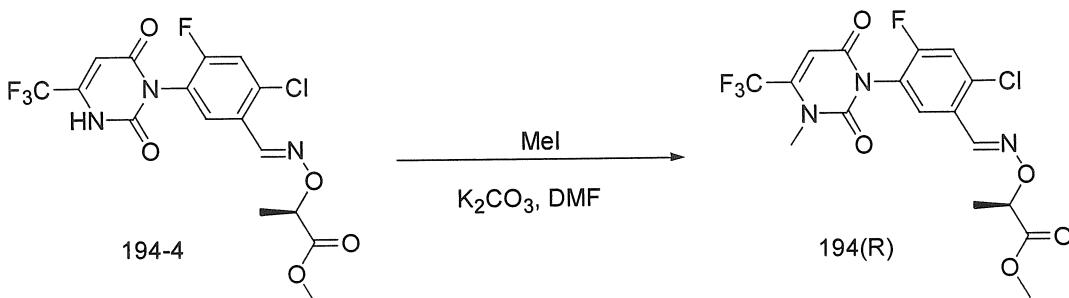


4) 194-3 (0,4g, 1,1 mmol, 1,5 eq), b (0,18g, 1,5 mmol, 1,3 eq) và K₂CO₃ (0,2g, 1,5 mmol, 1,3 eq) được bô sung vào 8 ml DMF theo thứ tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 25°C trong 4 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy việc tạo ra sản phẩm. Sau khi bô sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (10ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 194-4 (0,3g, hiệu suất 60,2%) (chất rắn màu trắng).



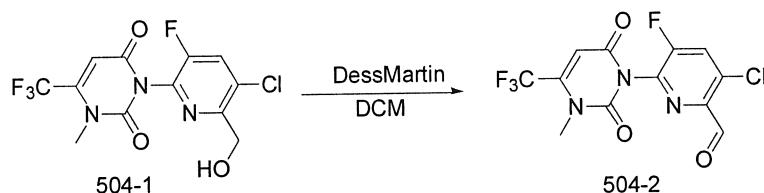
5) 194-4 (0,3g, 0,69 mmol, 1,0 eq), MeI (0,13g, 0,9 mmol, 1,3 eq) và K₂CO₃ (0,12g, 0,9 mmol, 1,3 eq) được bô sung vào 6 ml DMF theo thứ tự. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ 25°C trong 2 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy việc tạo ra sản phẩm. Sau khi bô sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha

hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (10ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 194(R) (0,2g, hiệu suất 64,6%, R/S=99/1) (chất rắn màu trắng).

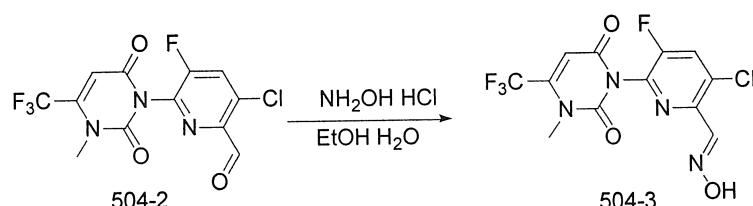


4. Tổng hợp hợp chất 504

(1) 504-1 (2g, 1,0 eq), DessMartin (4,8g, 2 eq) được bỏ sung vào 50 ml dung dịch DCM. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ phòng trong 2 giờ. Thử nghiệm LCMS cho thấy sự hoàn thành phản ứng. Sau khi bỏ sung dung dịch nước NaHCO₃ (100ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng DCM. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (100ml*2), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 504-2 (1,6g, hiệu suất 82%) (chất rắn màu trắng).

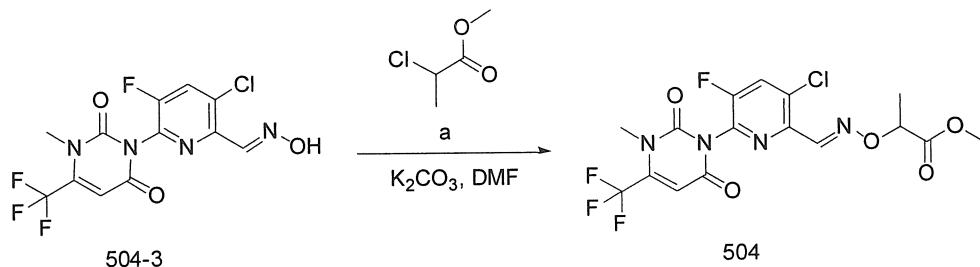


(2) 504-2 (1,6g, 1,0 eq), nước (10 ml), hydroxylamin hydrochlorua (0,63g, 2 eq) được bỏ sung vào 30 ml dung dịch etanol. Sau đó, dung dịch phản ứng được phản ứng ở nhiệt độ phòng trong 2 giờ. Thử nghiệm LCMS cho thấy sự hoàn thành phản ứng. Dung dịch phản ứng được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 504-3 (1,1g, hiệu suất 69%) (chất dầu màu trắng).



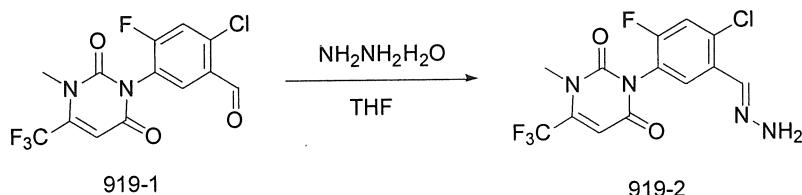
(3) 504-3 (0,3g, 1,0 eq) và K₂CO₃ (170 mg, 1,5 eq) được bỏ sung vào 10 ml DMF, sau đó a (150 mg, 1,5 eq) được bỏ sung vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 25°C, tiếp theo là phản ứng ở nhiệt độ 25°C trong 8 giờ. Thử nghiệm LCMS cho thấy việc tạo ra sản phẩm.

Sau khi bỏ sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (20ml*1), và sau đó được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 504 (0,2g, hiệu suất 54%) (chất rắn màu trắng).

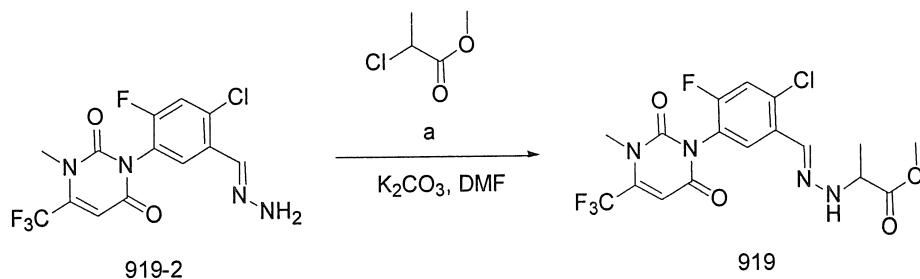


5. Tổng hợp hợp chất 919

(1) 919-1 (0,3g, 1,0 eq) và NH₂NH₂H₂O (0,5g, dung dịch nước 85%, 10 eq) được bỏ sung vào 10 ml THF. Sau đó, dung dịch phản ứng được khuấy ở nhiệt độ 60°C trong 3 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy việc tạo ra sản phẩm. Dung dịch phản ứng được cô cạn. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 919-2 (0,15g, hiệu suất 48%) (chất rắn màu trắng).



(2) 919-2 (0,15g, 1,0 eq) và K₂CO₃ (74 mg, 1,3 eq) được bỏ sung vào 6 ml DMF, sau đó a (55 mg, 1,1 eq) được bỏ sung vào dung dịch phản ứng ở nhiệt độ 25°C, sau đó phản ứng ở nhiệt độ 25°C trong 8 giờ. Thủ nghiệm LCMS cho thấy việc tạo ra sản phẩm. Sau khi bỏ sung nước (10ml), dung dịch phản ứng được chiết bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa (20ml*1), và sau đó được cô đặc. Sản phẩm thô tạo thành được tách bằng sắc ký cột để thu được 919 (50 mg, hiệu suất 27%) (chất rắn màu trắng).



Đánh giá hoạt tính sinh học:

Tiêu chí mức độ hoạt động đối với thiệt hại của thực vật (tức là tốc độ kiểm soát sinh trưởng) như sau:

Mức 5: tốc độ kiểm soát sinh trưởng trên 85%;

Mức 4: tốc độ kiểm soát sinh trưởng lớn hơn hoặc bằng 60% và nhỏ hơn 85%;

Mức 3: tốc độ kiểm soát sinh trưởng lớn hơn hoặc bằng 40% và nhỏ hơn 60%;

Mức 2: tốc độ kiểm soát sinh trưởng lớn hơn hoặc bằng 20% và nhỏ hơn 40%;

Mức 1: tốc độ kiểm soát sinh trưởng lớn hơn hoặc bằng 5% và nhỏ hơn 20%;

Mức 0: tốc độ kiểm soát sinh trưởng nhỏ hơn 5%.

Tốc độ kiểm soát sinh trưởng nêu trên là tốc độ kiểm soát theo khối lượng tươi.

Thử nghiệm về hiệu quả làm cỏ sau giai đoạn nảy mầm:

Hạt giống cỏ dại một lá mầm và hai lá mầm (*Descurainia sophia*, *Capsella bursa-pastoris*, *Abutilon theophrasti*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Lithospermum arvense*, *rorippa indica*, *Alopecurus aequalis*, *Alopecurus japonicus*, *Eleusine indica*, *Beckmannia syzigachne*, *Sclerocloa dura*, *Conyza Canadensis*, *Phleum paniculatum*, *Veronica didyma* Tenore, *Bromus japonicus*, *Aegilops tauschii*, *Phalaris arundinacea*, *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodiaceae*, *Commelina communis*, *Sonchus arvensis*, *Convolvulus arvensis*, *Cirsium setosum*, *Bidens tripartita L.*, *Solanum nigrum*, *Acalypha australis*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinocloa crusgalli*, *Setaria viridis*, *Setaria glauca*, *Leptocloa chinensis*, *Monochoria vaginalis*, *Sagittaria trifolia*, *Scirpus juncoides*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus iria*, *Cyperus difformis*, *Fimbristylis*, *Portulaca oleracea*, *Xanthium sibiricum*, *Pharbitis nil*, etc.) và hạt giống cây trồng chính (lúa mì, ngô, gạo, đậu tương, bông, hạt cải dầu, kê, bo bo, khoai tây, vừng, ricinus, v.v.) được đặt trong chậu nhựa đầy đất, sau đó phủ đất 0,5-2 cm, cho phép phát triển trong môi trường nhà kính tốt. Sau 2 tuần gieo, các cây thử nghiệm được xử lý ở giai đoạn 2-3 lá. Các hợp chất được thử nghiệm theo sáng chế được hòa tan tương ứng trong axeton, sau đó được thêm vào Tween 80 và 1,5 lít/ha chất côn đặc có thể nhũ hóa của methyl oleat làm chất hiệp lực, được pha loãng với một lượng nước nhất định để thu được dung dịch có nồng độ nhất định, và phun bằng tháp phun lên các cây trồng. Sau khi áp dụng, các cây được nuôi cấy 3 tuần trong nhà kính, và sau đó kết quả thí nghiệm về làm cỏ được tính. Liều lượng của các hợp chất được sử dụng là 500, 250, 125, 60, 30, 15, 7,5 g/ha và giá trị trung bình thu được bằng cách lặp lại ba lần. Dữ liệu đại diện được liệt kê trong Bảng 2.

Bảng 2. Kết quả về hiệu quả làm cỏ ở giai đoạn sau nảy mầm

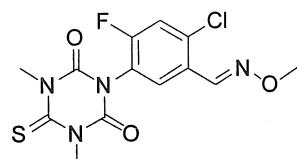
| | | | | | | | |
|--------|---|---|---|---|---|---|---------|
| 303(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 313 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 313(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 315 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 315(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 316 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 316(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 318 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 318(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 319 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 319(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 321 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 120g/ha |
| 321(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 120g/ha |
| 322 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 120g/ha |
| 322(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 120g/ha |
| 331 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 331(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 333 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 333(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 337 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 337(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 342 | 5 | 5 | 5 | 5 | 4 | 5 | 15g/ha |
| 342(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 344 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 344(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 347 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 347(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 349 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 349(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 351 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 60g/ha |
| 351(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 60g/ha |
| 388 | 5 | 5 | 5 | 5 | 4 | 5 | 15g/ha |

| | | | | | | | |
|--------|---|---|---|---|---|---|---------|
| 424(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 426 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 250g/ha |
| 426(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 250g/ha |
| 431 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 431(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 432 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 432(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 433 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 434 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 438 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 438(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 439 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 439(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 442 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 442(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 443 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 443(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 444 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 444(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 445 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 445(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 446 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 446(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 447 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 447(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 448 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 448(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 449 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 449(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 450 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 450(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 451 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |

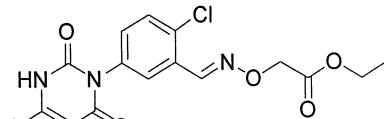
| | | | | | | | |
|--------|---|---|---|---|---|---|--------|
| 451(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 452 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 452(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 453 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 453(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 454 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 60g/ha |
| 454(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 60g/ha |
| 455 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 455(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 456 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 456(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 462 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 462(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 463 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 463(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 469 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 15g/ha |
| 471 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 471(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 473 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 473(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 475 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 475(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 476 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 476(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 477 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 477(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 478 | N | N | N | N | N | 5 | 60g/ha |
| 478(R) | N | N | N | N | N | 5 | 60g/ha |
| 479 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 480 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 481 | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |
| 481(R) | N | N | N | N | N | 5 | 15g/ha |

| | | | | | | | |
|-------------------------|---|---|---|---|---|---|--------|
| 881 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 885 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 919 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| 919(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 30g/ha |
| Hợp chất đối chứng A | 1 | 0 | 1 | 1 | 0 | 3 | 15g/ha |
| Hợp chất đối chứng B | 2 | 2 | 2 | 1 | 1 | 3 | 15g/ha |
| Hợp chất đối chứng C | 2 | 2 | 2 | 1 | 1 | 2 | 15g/ha |
| Hợp chất đối chứng D | 3 | 4 | 3 | 3 | 2 | N | 15g/ha |
| Hợp chất đối chứng E | 3 | 4 | 4 | 3 | 3 | N | 15g/ha |
| Hợp chất đối chứng F | 1 | 0 | 1 | 1 | 0 | 2 | 60g/ha |

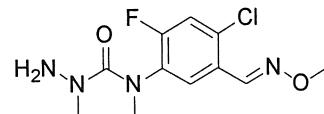
Ghi chú: N là không được thử nghiệm;



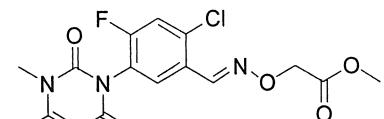
Hợp chất đối chứng A: ;



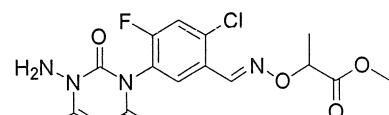
Hợp chất đối chứng B: ;



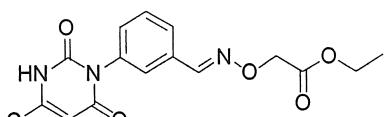
Hợp chất đối chứng C: ;



Hợp chất đối chứng D: ;



Hợp chất đối chứng E: ;



Hợp chất đối chứng F: .

Bảng 3. Kết quả của cấu hình R, cấu hình S và raxemate về hiệu quả làm cỏ ở giai đoạn

sau nảy mầm

| Hợp chất số | <i>Amaranthus retroflexus</i> | <i>Echinocloa crusgalli</i> | <i>Eleusine indica</i> | Liều lượng |
|-------------------------|-------------------------------|-----------------------------|------------------------|------------|
| 1(R) | 5 | 4 | 5 | 7,5g/ha |
| 1 | 3 | 3 | 3 | 7,5g/ha |
| 1(S) | 1 | 1 | 1 | 7,5g/ha |
| 194(R) | 5 | 5 | 5 | 7,5g/ha |
| 194 | 5 | 4 | 4 | 7,5g/ha |
| 194(S) | 2 | 1 | 1 | 7,5g/ha |
| Hợp chất đối chứng D | 2 | 1 | 2 | 7,5g/ha |

Thử nghiệm về hiệu quả làm cỏ ở giai đoạn trước khi nảy mầm:

Hạt giống cỏ dại một lá mầm và hai lá mầm và cây trồng chính nói trên được cho vào chậu nhựa đã lấp đất và phủ đất 0,5-2cm. Các hợp chất thử nghiệm theo sáng chế được hòa tan bằng axeton, sau đó được bổ sung tween 80, được pha loãng bằng một lượng nước nhất định để đạt được nồng độ nhất định, và được phun ngay sau khi gieo. Hạt giống thu được được ủ 4 tuần trong nhà kính sau khi phun và kết quả thử nghiệm đã được quan sát. Quan sát thấy rằng thuốc trừ cỏ hầu hết có tác dụng tuyệt vời ở mức bón 500, 250, 125, 60, 30, 15, 7, 5 g a.i./ha, đặc biệt đối với các loại cỏ dại như *Echinocloa crusgalli*, *Digitaria sanguinalis* và *Abutilon theophrasti*, v.v. và nhiều hợp chất có tính chọn lọc tốt đối với ngô, bông, lúa mì, gạo, đậu tương và đậu phộng, v.v.. Ngoài ra, đánh giá hiệu quả kiểm soát cỏ dại với mức tiêu chuẩn hoạt động trên. Nhiều hợp chất cho thấy hoạt tính và độ chọn lọc tuyệt vời, được thể hiện trong Bảng 4.

Bảng 4. Kết quả về hiệu quả làm cỏ ở giai đoạn trước khi nảy mầm

| Hợp chất số | <i>Veronica didyma</i> | <i>Descurainia sophia</i> | <i>Capsella bursa-pastoris</i> | <i>Abutilon theophrasti</i> | <i>Amaranthus retroflexus</i> | <i>Setaria viridis</i> | Ngô | Bông | Đậu nành | Đậu phộng | Liều lượng |
|-------------|------------------------|---------------------------|--------------------------------|-----------------------------|-------------------------------|------------------------|-----|------|----------|-----------|------------|
| 1(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 2(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 194(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 15g/ha |
| 194(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 194(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60g/ha |
| 196(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 198(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |

| | | | | | | | | | | | |
|--------|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|--------|
| 199(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 208(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 212(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 216(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 218(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 239(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 246(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 248(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 249(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 253(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 258(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 264(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 283(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 301(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 315(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 333(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 349(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 398(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 421(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 431(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 432(R) | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 433 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |
| 434 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30g/ha |

Từ thí nghiệm đối với cỏ dại chính trên ruộng lúa mì và lúa chỉ ra rằng hợp chất theo sáng chế nói chung có hiệu quả kiểm soát cỏ dại tốt. Trên hết, cần lưu ý rằng hợp chất theo sáng chế có hoạt tính cực kỳ cao đối với cỏ dại lá rộng và cỏ dại thuộc họ *Cyperaceae*, có khả năng chống lại chất ức chế ALS, chẳng hạn *Sagittaria trifolia*, *Scirpus juncoides*, *Cyperus difformis*, *Descurainia sophia*, *Capsella bursa-pastoris*, *Lithospermum arvense*, *Galium aparine L.*, và *Cyperus rotundus L.*, v.v., và có giá trị thương mại tuyệt vời.

Đánh giá an toàn lúa cây và đánh giá tác dụng kiểm soát cỏ dại trên ruộng lúa:

Đất ruộng lúa được nạp vào chậu theo tỉ lệ 1/1,000,000 ha. Các hạt giống *Echinocloa crusgalli*, *Scirpus juncoides*, *Bidens tripartita L.*, *Monochoria vaginalis*, và *Leptocloa chinensis* được gieo và phủ đất nhẹ nhàng, sau đó để yên trong nhà kính ở trạng thái trũng nước 0,5-1cm. Củ của cây Nhân mã (*Sagittaria trifolia*) đã được trồng vào ngày hôm sau hoặc 2 ngày sau đó. Sau đó, nó được giữ ở mức trũng nước 3-4cm. Cỏ dại được xử lý bằng cách nhỏ giọt dung dịch pha loãng WP hoặc SC được chuẩn bị theo phương pháp chuẩn bị thông thường của các hợp chất theo sáng chế với pipet đồng nhất để đạt được lượng hiệu quả quy định khi *Echinocloa crusgalli*, *Scirpus juncoides*, *Bidens tripartita L.*, *Monochoria vaginalis*, và *Leptocloa chinensis* đạt đến giai đoạn 0,5 lá và *Sagittaria trifolia* đạt đến thời

điểm của giai đoạn lá sơ cấp.

Ngoài ra, đất ruộng lúa nạp vào chậu theo tỉ lệ 1/1,000,000 ha được san phẳng để trũng nước ở độ sâu 3-4 cm. Lúa giai đoạn 5 lá (lúa japonica) cấy ở độ sâu 3cm vào ngày hôm sau. Hợp chất theo sáng chế được xử lý theo cách tương tự sau 5 ngày cấy.

Điều kiện sinh sản của *Echinocloa crusgalli*, *Scirpus juncoides*, *Bidens tripartita L.*, *Monochoria vaginalis*, *Leptocloa chinensis* và *Sagittaria trifolia* sau 14 ngày xử lý bằng hợp chất theo sáng chế và điều kiện sinh sản của lúa sau 21 ngày xử lý bằng hợp chất theo sáng chế tương ứng bằng mắt thường. Đánh giá hiệu quả kiểm soát cỏ dại với mức tiêu chuẩn hoạt động trên. Nhiều hợp chất cho thấy hoạt tính và tính chọn lọc tuyệt vời.

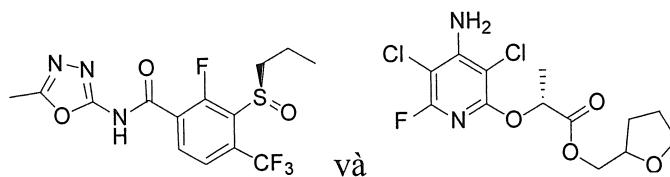
Bảng 5. Đánh giá hiệu quả của một số hợp chất

| Hợp chất số | <i>Leptocloa chinensis</i> | <i>Scirpus juncoides</i> | <i>Monochoria vaginalis</i> | Lúa | Liều lượng |
|---------------------|----------------------------|--------------------------|-----------------------------|-----|------------|
| 194(R) | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| 196(R) | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| 212(R) | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| 218(R) | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| 421(R) | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| 434 | 5 | 5 | 5 | 0 | 30 g/ha |
| Pyrazosulfuron-etyl | 2 | 1 | 2 | 1 | 30 g/ha |

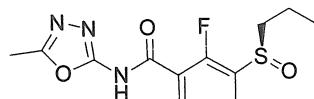
Lưu ý: Các hạt giống *Echinocloa crusgalli*, *Scirpus juncoides*, *Monochoria vaginalis* và *Bidens tripartita L.*, *Sagittaria trifolia* được thu thập từ tỉnh Hắc Long Giang của Trung Quốc. Các thử nghiệm chỉ ra rằng cỏ dại đã kháng với các liều lượng phổ biến của Pyrazosulfuron-etyl.

Thử nghiệm hiệu quả chế phẩm:

Thành phần hoạt tính B shuangzuocaotong, huanbifucaotong, benzuofucaotong, và sanzuohuangcaotong được sản xuất bởi công ty của tác giả, các phương pháp điều chế

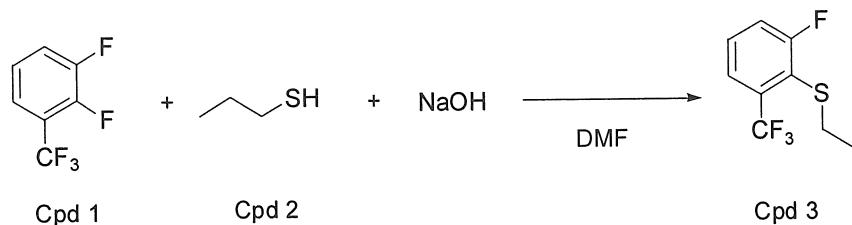


và như sau, và những chất khác được mua từ các công ty thuốc thử. Tất cả các nguyên liệu kỹ thuật được hòa tan trong axeton và pha loãng với dung dịch nước chứa 0,1% chất nhũ hóa Tween-80. Việc pha loãng được thực hiện theo yêu cầu.

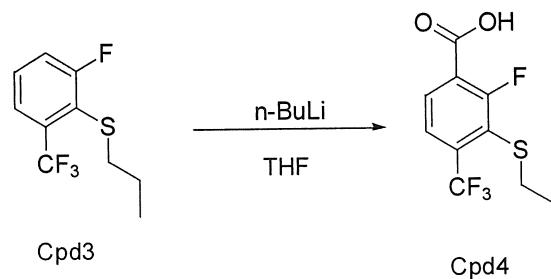


(1) Tổng hợp hợp chất

(1,1) Cpd 1(3g, 16 mmol, 1,0 eq), NaOH (0,72g, 18 mmol, 1,1 eq) được bô sung theo tuân tự vào 30 ml DMF, và sau đó Cpd 2 (1,28g, 16,8 mmol, 1,05 eq) được bô sung từng giọt ở nhiệt độ 0°C, và dung dịch phản ứng được khuấy ở 0°C trong 1 giờ. Khi thử nghiệm LCMS chỉ ra rằng phản ứng của nguyên liệu về cơ bản đã hoàn thành, có một đỉnh chính mới. Dung dịch phản ứng được rót vào 30 ml nước, và hỗn hợp được tách ra, và pha nước được chiết một lần bằng 50 ml etyl axetat, và pha hữu cơ thu được được rửa ba lần bằng dung dịch muối bão hòa (50 ml), làm khô, làm bay hơi đến khô dưới áp suất giảm và được tách bằng sắc ký cột để thu được Cpd 3 (3,6g, hiệu suất 91%) (dạng dầu không màu).

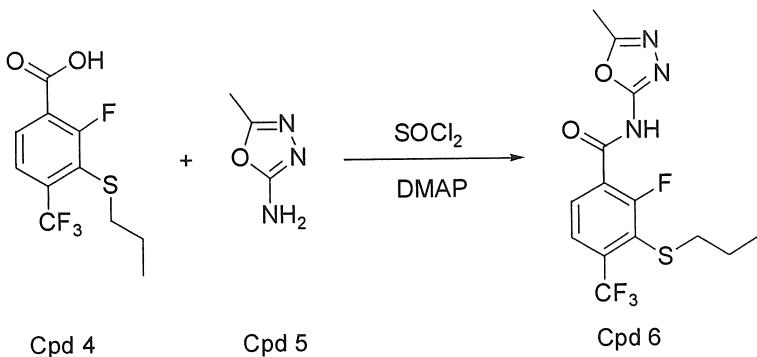


(1,2) Cpd 3(3,1g, 13 mmol, 1,0 eq) được bô sung vào 30 ml THF, sau đó n-BuLi (6,42 ml, 2,5 M, 16 mmol, 1,2 eq) được bô sung chậm ở nhiệt độ -78 °C, sau đó dung dịch phản ứng được khuấy ở nhiệt độ -78 °C trong 0,5 giờ, và được cấp CO₂ chậm trong 10 phút, sau đó dung dịch phản ứng được để ấm dần đến nhiệt độ phòng. Sản phẩm được xác định bằng LCMS. 20 ml nước được rót vào dung dịch phản ứng, hỗn hợp được tách ra, pha nước được chiết một lần bằng 30 ml etyl axetat, và pha hữu cơ tạo thành được điều chỉnh từ từ đến độ pH = 4-5 bằng axit clohydric đặc, được lọc và sấy khô để tạo ra Cpd 4(3,2g, hiệu suất 87%) (chất rắn màu trắng).



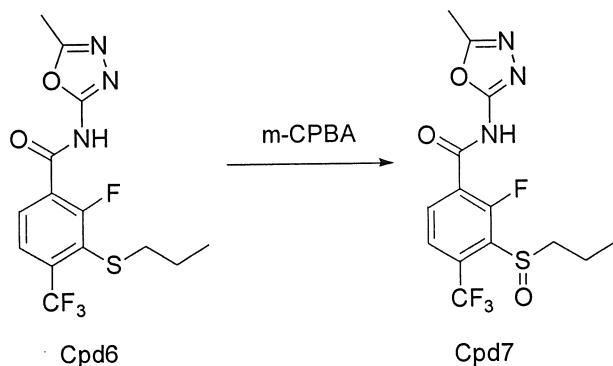
(1,3) Cpd 4(3,1g, 11 mmol, 1,0 eq), Cpd 5 (1,66g, 16,8 mmol, 1,5 eq), DMAP (0,13g, 1,1 mmol, 0,1 eq) được bô sung theo tuân tự vào 30 ml pyridin. Sau đó, SOCl₂ (2,0g, 16,8 mmol, 1,5 eq) được bô sung chậm ở nhiệt độ 0°C, và dung dịch phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 3 giờ. Sản phẩm được xác định bằng LCMS. Pyridin được loại bỏ

bằng cách cô cạn, sau đó 30 ml nước được rót vào dung dịch phản ứng, và hỗn hợp được tách ra. Pha nước được hiết ba lần bằng 30 ml etyl axetat, và pha hữu cơ tạo thành được rửa ba lần bằng dung dịch muối bão hòa (50 ml), sấy khô, và làm bay hơi đến khô dưới áp suất giảm và được tách bằng sắc ký cột để thu Cpd 6(2,5g, hiệu suất 63%) (chất rắn màu trắng).



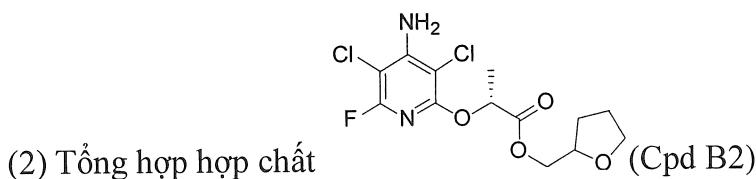
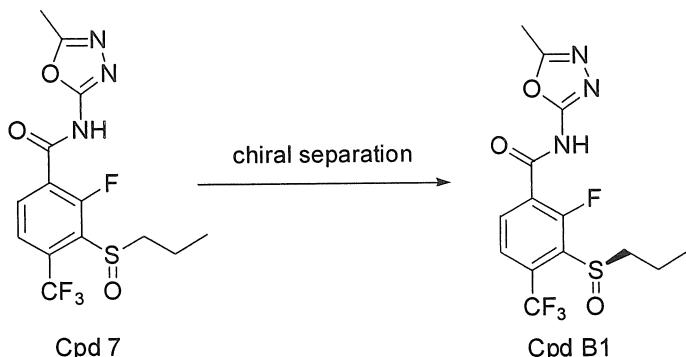
(1,4) Cpd 6(1g, 2,8 mmol, 1,0 eq) và m-CPBA (0,54g, 3,1 mmol, 1,1 eq) được bổ sung theo tuân tự vào 10 mL diclometan. Dung dịch phản ứng sau đó được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 1 giờ. Sản phẩm được xác định bằng LCMS, và phản ứng của các nguyên liệu ban đầu cơ bản đã hoàn thành. Dung dịch phản ứng được rót vào 10 ml nước, phản ứng được dập tắt bằng natri hydro sulfit, và hỗn hợp được tách ra. Pha nước được chiết ba lần bằng 30 ml diclometan, và pha hữu cơ tạo thành được rửa một lần bằng dung dịch muối bão hòa (30 ml), dried, và được làm bay hơi đến khô cạn dưới áp suất giảm, và được tách bằng sắc ký cột để tạo ra Cpd 7(0,85g, hiệu suất 82%) (chất rắn màu trắng xám).

¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) 12,57 (s, 1H), 8,07 (dd, J = 8,0, 7,0 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 3,57-3,47 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 1,70-1,52 (m, 2H), 1,08-0,93 (m, 3H).

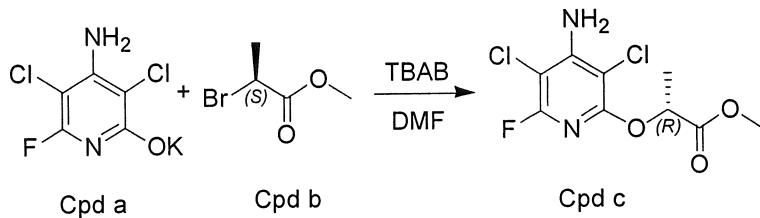


(1,5) Cpd 7 (0,5g, độ tinh khiết 98%) được cho ra HPLC bắt đổi xứng (Cột: CHIRALPAK IG; Kích thước cột: 3 cm x 25 cm, 5 um; Bơm: 3,0 ml; Pha động: Hex(0,2% FA) : IPA=50:50; Tốc độ dòng chảy: 28ml/phút; Bước sóng: UV 254nm; Nhiệt độ: 25°C; Dung dịch mẫu: 70mg/ml trong EtOH/DCM; Thời gian chạy = 60 phút) để tách, và sau đó được cô đặc để thu Cpd B1 (cấu hình R)(0,16g, Rt=10,51 phút, 100% ee, độ tinh khiết 98%)

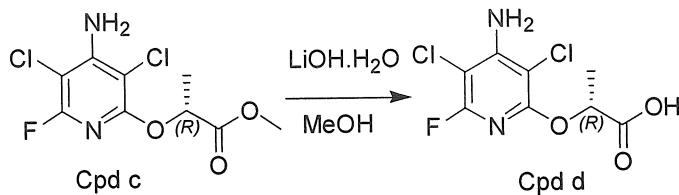
ở dạng chất rắn màu trắng, được xác định bởi nhiều xạ đơn tinh thể.



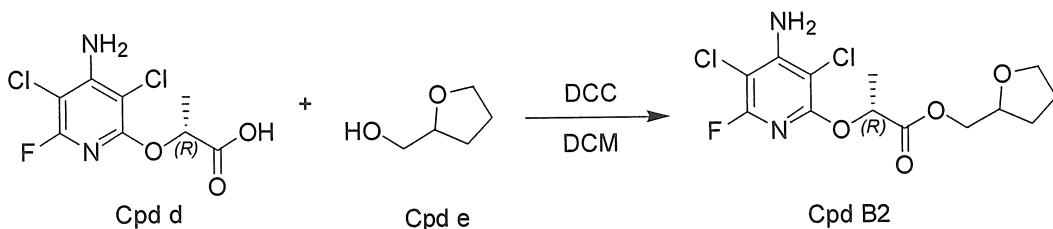
(2,1) Cpd a (0,5g, 2,13mmol), Cpd b (313mg, 2,55mmol), một lượng chất xúc tác TBAB (10mg), và DMF (10mL) được bổ sung vào một bình cầu đáy tròn, và được khuấy ở nhiệt độ 15 °C trong 24 giờ. Khi có một lượng nhỏ nguyên liệu thô còn lại theo phát hiện LC-MS, việc xử lý thêm được thực hiện. Dung dịch phản ứng được rót vào 50mL nước, và được chiết bằng methyl tert-butyl ete hai lần (50mL x 2). Pha hữu cơ được sấy khô, được cô đặc, và được tách bằng sắc ký cột, để thu được Cpd c (300mg, hiệu suất 50%), dưới dạng chất rắn màu trắng.



(2,2) Cpd c (0,3g, 1,06mmol), metanol (20mL) được bổ sung vào bình một cỗ 100 mL, lithi hydroxit (44,5mg, 1,06mmol) được hòa tan trong 2 mL nước, và được bổ sung từ từ vào bình một cỗ ở nhiệt độ phòng, sau đó khuấy ở nhiệt độ phòng trong 12 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng của các nguyên liệu thô theo phát hiện LC-MS, dung dịch phản ứng được điều chỉnh bằng HCl loãng 0,5M đến độ pH = 5-6, được cô đặc, và sau đó được chiết bằng nước và etyl axetat. Pha hữu cơ được làm khô, và cô đặc để thu được Cpd d (200mg, hiệu suất 70%) dưới dạng chất rắn màu trắng.



(2,3) Cpd d (200mg, 0,74mmol), Cpd e (75mg, 0,74mmol), DCC (152mg, 0,74mmol), và DCM khan (20mL) được bô sung vào bình cầu đáy tròn 100 mL, và được phản ứng ở nhiệt độ phòng trong 12 giờ. Sau khi hoàn thành phản ứng của nguyên liệu thô theo phát hiện LC-MS, dung dịch phản ứng được cô đặc, và được tách bằng sắc ký cột để thu được Cpd B2 (200mg, hiệu suất 77%), ở dạng chất rắn màu trắng.



¹H NMR (500 MHz, Cloform-*d*) δ 5,28 (q, *J* = 7,0 Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,27 – 4,07 (m, 3H), 3,91 – 3,73 (m, 2H), 2,04 – 1,82 (m, 3H), 1,66 (d, *J* = 7,0 Hz, 3H), 1,59-1,54 (m, 1H).

(A) Xử lý sau nảy mầm bằng cách phun tản lá:

Cỏ dại được trồng bằng phương pháp nuôi cây trong chậu. Một bát dinh dưỡng bằng nhựa 180 x 140 mm chứa 4/5 lớp đất mặt từ ruộng được đặt trong một chảo tráng men, trong đó đất đã được làm khô bằng không khí và được sàng lọc và có độ ẩm ban đầu là 20%. Hạt giống cỏ dại dày đủ và đồng đều được chọn lọc, ngâm trong nước ấm 25 °C trong 6 giờ, và nảy mầm trong tủ ấm sinh hóa 28°C (bóng tối). Hạt cỏ dại vừa nảy mầm đặt đều trên mặt đất và sau đó phủ đất 0,5-1 cm tùy theo kích cỡ của hạt.

Việc nuôi cây được thực hiện trong nhà kính có ánh sáng mặt trời có thể kiểm soát được ở nhiệt độ từ 20 đến 30°C, trong ánh sáng tự nhiên, và độ ẩm tương đối từ 57% đến 72%. Đất là mùn với hàm lượng chất hữu cơ là 1,63%, giá trị pH là 7,1, nitơ thủy phân kiềm là 84,3 mg/kg, phốt pho có sẵn nhanh chóng là 38,5 mg/kg và kali có sẵn nhanh chóng 82,1 mg/kg.

3 chậu với 20 hạt cỏ dại mỗi chậu được xử lý trong một thử nghiệm với 4 lần lặp lại cho mỗi thử nghiệm.

Các tác nhân chỉ được sử dụng một lần trong thử nghiệm. Ở giai đoạn cỏ có từ 1,5-2 lá, cỏ được tia thưa để duy trì 10 cây cỏ trên mỗi chậu và 30 cây cỏ cho mỗi lần xử lý, sau đó tiếp tục được cấy sang *Conyza Canadensis* cao 10cm, các loại cỏ khác giai đoạn 3-4 lá và xử lý.

Cỏ dại được chăm bón tốt được đặt đều trên giàn có diện tích 0,5m², và một dung dịch của các chất được phun lên thân và lá của chúng bằng tháp phun đi bộ loại 3WP-2000 ở liều lượng 450kg/ha và áp suất phun bằng 0,3MPa. Sau khi tắt cả dung dịch được phun, van được đóng lại. Sau 30 giây, cửa của tháp phun được mở ra, và bát dinh dưỡng được lấy ra. Sau đó, van được mở, và ống phun được làm sạch bằng cách phun 50 ml nước. Sau khi xử lý, cỏ dại được nuôi cấy thường xuyên trong nhà kính.

(B) Xử lý làm kín đất:

Cỏ dại được trồng trong nhà kính có ánh sáng mặt trời có thể kiểm soát được ở 20 đến 30°C, trong ánh sáng tự nhiên, và độ ẩm tương đối từ 57% đến 72%. Đất là mùn với hàm lượng chất hữu cơ là 1,63%, giá trị pH là 7,1, nitơ thủy phân kiềm là 84,3 mg/kg, photpho có sẵn nhanh chóng là 38,5 mg/kg, và kali có sẵn nhanh chóng 82,1 mg/kg. Đất thử nghiệm được cho vào 3/4 chậu và sau đó tưới từ đáy chậu để làm ướt hoàn toàn đất đến bão hòa. Hạt cỏ dại thử nghiệm đã được nảy mầm, và gieo theo số lượng và đồng đều trên bề mặt, sau đó phủ đất 0,5-2 cm tùy theo cỡ hạt và sẵn sàng sử dụng sau 72 giờ sau khi gieo.

3 chậu với 30 hạt cỏ dại mỗi chậu được xử lý trong một lần xử lý với 4 lần lặp lại cho mỗi lần xử lý.

Cỏ dại được gieo đều trên một nền có diện tích 0,5m² và dung dịch tác nhân được phun lên đất bằng tháp phun đi bộ loại 3WP-2000 với liều lượng 450kg/ha và phun với áp suất 0,3MPa. Sau khi phun hết dung dịch, van đã được đóng lại. Sau 30 giây, cửa của tháp phun được mở ra và bát dinh dưỡng được đưa ra ngoài. Sau đó, van được mở và ống phun được làm sạch bằng cách phun 50 ml nước.

(C) Điều tra dữ liệu và phân tích thống kê:

Một phương pháp để điều tra số lượng tuyệt đối đã được sử dụng, trong đó toàn bộ cây con của cỏ dại sống sót được cắt bằng lưỡi dao dọc theo bề mặt đất, và trọng lượng tươi của cỏ dại được cân bằng cân phân tích. Đối với cỏ dại chết, trọng lượng tươi của chúng bằng không.

Cuộc điều tra được thực hiện sau 21 ngày kể từ ngày xử lý duy nhất một lần.

Tỷ lệ úc chế trọng lượng tươi lý thuyết của tổ hợp hai thành phần hoạt tính trong mỗi nhóm được tính bằng phương pháp Gowing ($E0=X+Y-X*Y/100$), và sau đó được so sánh với tỷ lệ úc chế thực tế đo được (E), do đó ảnh hưởng của sự kết hợp (sau đây gọi là tác động kết hợp) đối với cỏ dại đã được đánh giá: giá trị $E-E0$, lớn hơn 10%, tương ứng với hiệu quả hiệp lực, giá trị $E-E0$, nhỏ hơn -10%, tương ứng với hiệu ứng đối kháng, và giá trị $E-E0$, nằm trong khoảng từ -10% đến 10%, tương ứng với hiệu quả bổ sung. Tỷ lệ tối ưu của hai thành phần hoạt tính được xác định bởi hiệu quả kiểm soát thực tế, đặc tính của thuốc diệt cỏ và sự cân bằng của công thức tương ứng. Trong đó, trong công thức, X là tỉ lệ úc chế trọng lượng tươi của thành phần hoạt tính A trong liều lượng P, và Y là tỉ lệ úc chế trọng lượng tươi của thành phần hoạt tính B trong liều lượng Q. Kết quả thống kê được hiển thị trong bảng 6.

Bảng 6. Hiệu quả kiểm soát thực tế và hiệu quả kết hợp của các kết hợp của A trên cỏ dại

| Các thành phần | Cỏ dại | Tán lá / Đất F/ S | Liều lượng g a.i./ha | Tỉ lệ | Hiệu quả kiểm soát (%) của A được áp dụng một mình (A) | Hiệu quả kiểm soát (%) của B được áp dụng một mình (B) | Hiệu quả kiểm soát thực tế (%) của A+B E(A+B) | Hiệu quả kiểm soát theo lý thuyết (%) của A+B E0(A+B) | $E(A+B)-E0(A+B)$ |
|----------------|------------------------------------|-------------------|----------------------|-------|--|--|---|---|------------------|
| A+topramezon | <i>Echino cloa caudata Roshev.</i> | F | 1,5+7,5 | 1:5 | 65,9 | 38,5 | 93,5 | 79,0 | 14,5 |
| A+isoxaflutol | <i>Echino cloa caudata Roshev.</i> | F | 1,5+15 | 1:10 | 65,9 | 41,3 | 91,9 | 80,0 | 11,9 |
| A+tembotriion | <i>Echino cloa caudata Roshev.</i> | F | 1,5+15 | 1:10 | 65,9 | 31,7 | 88,3 | 76,7 | 11,6 |
| A+tefuryltrion | <i>Echino cloa caudata</i> | F | 1,5+30 | 1:20 | 65,9 | 21,5 | 86,6 | 73,2 | 13,4 |

| | | | | | | | | | |
|--------------------------|---|---|---------|------|------|------|-------|------|------|
| | <i>a Roshev.</i> | | | | | | | | |
| A+shuangzuo caotong | <i>Echino cloa caudat a Roshev.</i> | F | 1,5+15 | 1:10 | 65,9 | 35,9 | 94,5 | 78,1 | 16,4 |
| A+huanbifuca otong | <i>Echino cloa caudat a Roshev.</i> | F | 1,5+60 | 1:40 | 65,9 | 27,4 | 87,4 | 75,2 | 12,2 |
| A+sanzuohua ngcaotong | <i>Echino cloa caudat a Roshev.</i> | F | 1,5+30 | 1:20 | 65,9 | 56,7 | 98,4 | 85,2 | 13,2 |
| A+benzuofuc aotong | <i>Echino cloa caudat a Roshev.</i> | F | 1,5+15 | 1:10 | 65,9 | 25,2 | 89,9 | 74,5 | 15,4 |
| A+Cpd B1 | <i>Echino cloa caudat a Roshev.</i> | F | 1,5+7,5 | 1:5 | 65,9 | 47,8 | 96,2 | 82,2 | 14,0 |
| A+glyphosat | <i>Cyperu s rotundu s</i> | F | 7,5+300 | 1:40 | 52,4 | 19,4 | 82,4 | 61,6 | 20,8 |
| A+glyphosat | <i>Conyza Canade nsis</i> | F | 45+450 | 1:10 | 75,6 | 51,2 | 100,0 | 88,1 | 11,9 |
| A+glufosinat amoni | <i>Cyperu s serotin us</i> | F | 15+300 | 1:20 | 47,3 | 23,1 | 90,2 | 59,5 | 30,7 |
| A+glufosinat amoni | <i>Conyza Canade nsis</i> | F | 45+300 | 3:20 | 75,6 | 57,8 | 100,0 | 89,7 | 10,3 |
| A+glufosinat- P-amoni | <i>Cyperu s serotin us</i> | F | 15+150 | 1:10 | 47,3 | 21,4 | 85,3 | 58,6 | 26,7 |
| A+paraquat dchlorua | <i>Cyperu s difform</i> | F | 15+150 | 1:10 | 42,2 | 35,7 | 87,4 | 62,8 | 24,6 |

| | <i>is</i> | | | | | | | | |
|------------------------------|--------------------------------|---|---------|-------|------|------|-------|------|------|
| A+paraquat diclorua | <i>Conyza Canadensis</i> | F | 45+225 | 1:5 | 75,6 | 48,4 | 100,0 | 87,4 | 12,6 |
| A+diquat dibromua monohydrat | <i>Cyperus difformis</i> | F | 15+300 | 1:20 | 42,2 | 18,4 | 79,2 | 52,8 | 26,4 |
| A+diquat dibromua monohydrat | <i>Conyza Canadensis</i> | F | 45+300 | 3:20 | 75,6 | 37,8 | 100,0 | 84,8 | 15,2 |
| A+flurtamone | <i>Capsella bursa-pastoris</i> | F | 0,75+75 | 1:100 | 48,3 | 56,7 | 95,4 | 77,6 | 17,8 |
| A+diflufenican | <i>Capsella bursa-pastoris</i> | F | 0,75+75 | 1:100 | 48,3 | 33,1 | 86,7 | 65,4 | 21,3 |
| A+picolinafen | <i>Capsella bursa-pastoris</i> | F | 0,75+45 | 1:60 | 48,3 | 44,4 | 91,5 | 71,3 | 20,2 |
| A+clomazon | <i>Eleusine indica</i> | F | 3+150 | 1:50 | 47,8 | 46,5 | 95,1 | 72,1 | 23,0 |
| A+bixlozon | <i>Eleusine indica</i> | F | 3+180 | 1:60 | 47,8 | 36,7 | 88,8 | 67,0 | 21,8 |
| A+tribenuron-metyl | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+3 | 5:2 | 62,8 | 27,9 | 90,1 | 73,2 | 16,9 |
| A+thifensulfuron methyl | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+4,5 | 5:3 | 62,8 | 30,8 | 87,2 | 74,3 | 12,9 |
| A+pyrazosulfuron-ethyl | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+7,5 | 1:1 | 62,8 | 35,7 | 89,5 | 76,1 | 13,4 |
| A+thiencarbazone-metyl | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+3 | 5:2 | 62,8 | 41,1 | 93,3 | 78,1 | 15,2 |
| A+halosulfuron methyl | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+9 | 5:6 | 62,8 | 36,4 | 94,7 | 76,3 | 18,4 |

| | <i>um</i> | | | | | | | | |
|----------------------|-----------------------------|---|---------|------|------|------|------|------|------|
| A+rimsulfuron | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+1,5 | 5:1 | 62,8 | 26,2 | 92,4 | 72,5 | 19,9 |
| A+nicosulfuron | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+3 | 5:2 | 62,8 | 31,4 | 88,5 | 74,5 | 14,0 |
| A+imazamox | <i>Malachium aquaticum</i> | F | 7,5+15 | 1:2 | 62,8 | 27,2 | 91,2 | 72,9 | 18,3 |
| A+clethodim | <i>Eriocloa villosa</i> | F | 0,75+30 | 1:40 | 42,9 | 35,5 | 89,5 | 63,2 | 26,3 |
| A+sethoxydim | <i>Eriocloa villosa</i> | F | 0,75+45 | 1:60 | 42,9 | 36,7 | 92,3 | 63,9 | 28,4 |
| A+quizalofop-P-metyl | <i>Eriocloa villosa</i> | F | 0,75+15 | 1:20 | 42,9 | 41,7 | 87,3 | 66,7 | 20,6 |
| A+oxyfluorfen | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+60 | 1:20 | 63,5 | 31,5 | 91,4 | 75,0 | 16,4 |
| A+oxadiazon | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+90 | 1:30 | 63,5 | 24,3 | 92,1 | 72,4 | 19,7 |
| A+oxadiargyl | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+30 | 1:10 | 63,5 | 38,7 | 89,8 | 77,6 | 12,2 |
| A+sulfentrazon | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+90 | 1:30 | 63,5 | 26,5 | 94,1 | 73,2 | 20,9 |
| A+pyraclonil | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+75 | 1:25 | 63,5 | 37,9 | 90,5 | 77,3 | 13,2 |
| A+flumioxazin | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+7,5 | 2:5 | 63,5 | 29,4 | 92,4 | 74,2 | 18,2 |
| A+saflufenacil | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+0,75 | 4:1 | 63,5 | 39,7 | 98,4 | 78,0 | 20,4 |
| A+carfentrazon-ethyl | <i>Lithospermum arvense</i> | F | 3+4,5 | 2:3 | 63,5 | 27,2 | 89,3 | 73,4 | 15,9 |
| A+trifludimoxazin | <i>Lithospermum</i> | F | 3+4,5 | 2:3 | 63,5 | 31,8 | 94,8 | 75,1 | 19,7 |

| | <i>arvense</i> | | | | | | | | |
|-----------------|----------------------------|---|----------|-------|------|------|------|------|------|
| A+metribuzin | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+15 | 1:20 | 59,2 | 36,3 | 89,3 | 74,0 | 15,3 |
| A+terbutylazine | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+150 | 1:200 | 59,2 | 31,7 | 94,1 | 72,1 | 22,0 |
| A+amicarbazon | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+60 | 1:80 | 59,2 | 43,7 | 90,7 | 77,0 | 13,7 |
| A+clotoluron | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+225 | 1:300 | 59,2 | 24,5 | 86,2 | 69,2 | 17,0 |
| A+isoproturon | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+225 | 1:300 | 59,2 | 33,9 | 92,5 | 73,0 | 19,5 |
| A+bromacil | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+450 | 1:600 | 59,2 | 28,4 | 83,9 | 70,8 | 13,1 |
| A+propanil | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+300 | 1:400 | 59,2 | 21,7 | 93,8 | 68,1 | 25,7 |
| A+desmedipharm | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+300 | 1:400 | 59,2 | 16,2 | 90,5 | 65,8 | 24,7 |
| A+phenmedipham | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+300 | 1:400 | 59,2 | 20,8 | 86,2 | 67,7 | 18,5 |
| A+bentazon | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+150 | 1:200 | 59,2 | 30,2 | 88,4 | 71,5 | 16,9 |
| A+bromoxynil | <i>Eclipta prostrata</i> | F | 0,75+60 | 1:80 | 59,2 | 41,2 | 92,6 | 76,0 | 16,6 |
| A+butralin | <i>Leptocloa chinensis</i> | S | 3+180 | 1:60 | 33,2 | 47,4 | 92,3 | 64,9 | 27,4 |
| A+pendimethalin | <i>Leptocloa chinensis</i> | S | 3+150 | 1:50 | 33,2 | 43,2 | 85,8 | 62,1 | 23,7 |
| A+butaclor | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+225 | 1:75 | 40,2 | 42,2 | 92,3 | 65,4 | 26,9 |
| A+pretilaclor | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+180 | 1:60 | 40,2 | 51,2 | 95,7 | 70,8 | 24,9 |

| | | | | | | | | | |
|----------------------------|------------------------------------|---|----------|-------|------|------|------|------|------|
| A+mefenacet | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+150 | 1:50 | 40,2 | 46,4 | 89,6 | 67,9 | 21,7 |
| A+s-metolaclor | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+150 | 1:50 | 40,2 | 31,3 | 94,3 | 58,9 | 35,4 |
| A+flufenacet | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+150 | 1:50 | 40,2 | 45,6 | 96,3 | 67,5 | 28,8 |
| A+pyroxasulfon | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+60 | 1:20 | 40,2 | 57,6 | 98,2 | 74,6 | 23,6 |
| A+anilofos | <i>Descurainia sophia</i> | S | 3+75 | 1:25 | 40,2 | 38,3 | 97,3 | 63,1 | 34,2 |
| A+prosulfocarb | <i>Echino cloa crusgallii</i> | S | 15+600 | 1:40 | 51,7 | 32,6 | 86,9 | 67,4 | 19,5 |
| A+ Cpd B2 | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+90 | 1:120 | 57,3 | 42,1 | 92,6 | 75,3 | 17,3 |
| A+floxypyrr | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+60 | 1:80 | 57,3 | 39,3 | 90,3 | 74,1 | 16,2 |
| A+florpyrauxifenzyl benzyl | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+15 | 1:20 | 57,3 | 50,3 | 91,5 | 78,8 | 12,7 |
| A+halauxifen-methyl | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+3 | 1:4 | 57,3 | 35,6 | 87,6 | 72,5 | 15,1 |
| A+triclopyr | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+90 | 1:120 | 57,3 | 34,2 | 91,5 | 71,9 | 19,6 |
| A+clopyralid | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+45 | 1:60 | 57,3 | 28,9 | 83,3 | 69,6 | 13,7 |
| A+picloram | <i>Veronica a didyma</i> Tenore | F | 0,75+300 | 1:400 | 57,3 | 43,6 | 88,7 | 75,9 | 12,8 |
| A+aminopyral | <i>Veronica</i> | F | 0,75+30 | 1:40 | 57,3 | 32,2 | 90,2 | 71,0 | 19,2 |

| | | | | | | | | | |
|---|---|---|----------|-------|------|------|------|------|------|
| id | <i>a didyma</i> Tenore | | | | | | | | |
| A+dicamba | <i>Veronic a didyma</i> Tenore | F | 0,75+150 | 1:200 | 57,3 | 29,7 | 87,3 | 70,0 | 17,3 |
| A+ axit 2-metyl-4-clo phenoxyaxetic | <i>Veronic a didyma</i> Tenore | F | 0,75+150 | 1:200 | 57,3 | 39,3 | 90,9 | 74,1 | 16,8 |
| A+ axit 2,4-diclophen oxy axetic | <i>Veronic a didyma</i> Tenore | F | 0,75+150 | 1:200 | 57,3 | 32,6 | 85,2 | 71,2 | 14,0 |
| A+triaziflam | <i>Amara nthus retrofle xus</i> | S | 3+30 | 1:10 | 37,3 | 42,1 | 91,3 | 63,7 | 27,6 |
| A+indaziflam | <i>Amara nthus retrofle xus</i> | S | 3+15 | 1:5 | 37,3 | 49,3 | 93,3 | 68,2 | 25,1 |
| A+cinmetylin | <i>Lolium multiflo rum</i> Lamk. | S | 30+300 | 1:10 | 48,6 | 33,7 | 87,3 | 65,9 | 21,4 |

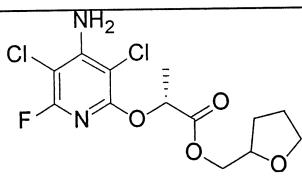
Lưu ý: Số hợp chất được biểu diễn bởi A là 194 (R).

Ngoài ra, sáng chế cũng đề xuất các kết hợp cụ thể khác của thành phần A và thành phần B, để minh họa thêm chế phẩm của sáng chế. Các hợp chất trong cột "Thành phần A (Hợp chất số)" được xác định trong Bảng 1. Cột thứ hai của Bảng B1 liệt kê các hợp chất cụ thể (ví dụ: "topramezon" ở hàng đầu tiên) đối với thành phần B. Các hàng còn lại của Bảng B1 được cấu tạo tương tự.

Bảng B1. Danh sách các thành phần của chế phẩm

| Thành phần A (Hợp chất số) | Thành phần B |
|-------------------------------|--------------|
| 1 | topramezon |
| 1 | isoxaflutol |
| 1 | tembotrion |
| 1 | tefuryltrion |

| | |
|---|--|
| 1 | shuangzuocaotong |
| 1 | huanbifucaotong |
| 1 | sanzuohuangcaotong |
| 1 | benzuofucaotong |
| 1 |  |
| 1 | glyphosat |
| 1 | glufosinat amoni |
| 1 | glufosinat-P-amoni |
| 1 | paraquat diclorua |
| 1 | diquat dibromua monohydrat |
| 1 | flurtamón |
| 1 | diflufenican |
| 1 | picolinafen |
| 1 | clomazon |
| 1 | bixlozon |
| 1 | tribenuron-metyl |
| 1 | thifensulfuron methyl |
| 1 | pyrazosulfuron-etyl |
| 1 | thiencarbazón-metyl |
| 1 | halosulfuron methyl |
| 1 | rimsulfuron |
| 1 | nicosulfuron |
| 1 | imazamox |
| 1 | clethodim |
| 1 | sethoxydim |
| 1 | quizalofop-P-metyl |
| 1 | oxyfluorfen |
| 1 | oxadiazon |
| 1 | oxadiargyl |
| 1 | sulfentrazon |
| 1 | pyraclonil |
| 1 | flumioxazin |
| 1 | saflufenacil |

| | |
|---|--|
| 1 | carfentrazon-etyl |
| 1 | trifludimoxazin |
| 1 | metribuzin |
| 1 | terbutylazin |
| 1 | amicarbazone |
| 1 | clotoluron |
| 1 | isoproturon |
| 1 | bromacil |
| 1 | propanil |
| 1 | desmedipham |
| 1 | phenmedipham |
| 1 | bentazon |
| 1 | bromoxynil |
| 1 | butralin |
| 1 | pendimethalin |
| 1 | butaclor |
| 1 | pretilaclor |
| 1 | mefenacet |
| 1 | s-metolaclor |
| 1 | flufenacet |
| 1 | pyroxasulfon |
| 1 | anilofos |
| 1 | prosulfocarb |
| 1 |  |
| 1 | floxypyridine |
| 1 | florpyrauxifen benzyl |
| 1 | halauxifen-methyl |
| 1 | triclopyr |
| 1 | clopyralid |
| 1 | picloram |
| 1 | aminopyralid |
| 1 | dicamba |
| 1 | axit 2-methyl-4-clophenoxyacetic |

| | |
|---|------------------------------|
| 1 | axit 2,4-diclophenoxy axetic |
| 1 | triaziflam |
| 1 | indaziflam |
| 1 | cinmetylin |

Bảng B2 được xây dựng theo cách tương tự như của Bảng B1 ở trên, ngoại trừ việc thay thế các mục nhập trong cột “Thành phần A (Hợp chất số)” với các mục nhập trong cột tương ứng “Thành phần A (Hợp chất số)” được thể hiện dưới đây. Do đó, ví dụ, trong bảng B2, các mục nhập trong cột “Thành phần A (Hợp chất số)” tất cả được thể hiện là “2” (tức là, hợp chất 2 được xác định trong bảng 1), và hỗn hợp của hợp chất 2 và “topramezon” được liệt kê cụ thể trong hàng đầu tiên dưới tiêu đề của Bảng B2. Các bảng từ B3 đến B552 được xây dựng tương tự.

| Bảng | "Thành phần A (Hợp chất số)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất số)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất số)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất số)" mục nhập cột |
|------|---|------|---|------|---|------|---|
| B2 | 2 | B3 | 3 | B4 | 4 | B5 | 5 |
| B6 | 6 | B7 | 7 | B8 | 8 | B9 | 9 |
| B10 | 10 | B11 | 11 | B12 | 12 | B13 | 13 |
| B14 | 14 | B15 | 15 | B16 | 16 | B17 | 17 |
| B18 | 18 | B19 | 19 | B20 | 20 | B21 | 21 |
| B22 | 22 | B23 | 23 | B24 | 24 | B25 | 25 |
| B26 | 26 | B27 | 27 | B28 | 28 | B29 | 29 |
| B30 | 30 | B31 | 31 | B32 | 32 | B33 | 33 |
| B34 | 34 | B35 | 35 | B36 | 36 | B37 | 37 |
| B38 | 38 | B39 | 39 | B40 | 40 | B41 | 41 |
| B42 | 42 | B43 | 43 | B44 | 44 | B45 | 45 |
| B46 | 46 | B47 | 47 | B48 | 48 | B49 | 49 |
| B50 | 50 | B51 | 51 | B52 | 52 | B53 | 53 |
| B54 | 54 | B55 | 55 | B56 | 56 | B57 | 57 |
| B58 | 58 | B59 | 59 | B60 | 60 | B61 | 61 |
| B62 | 62 | B63 | 63 | B64 | 64 | B65 | 65 |
| B66 | 66 | B67 | 67 | B68 | 68 | B69 | 69 |
| B70 | 70 | B71 | 71 | B72 | 72 | B73 | 73 |
| B74 | 74 | B75 | 75 | B76 | 76 | B77 | 77 |
| B78 | 78 | B79 | 79 | B80 | 80 | B81 | 81 |

| | | | | | | | |
|------|-----|------|-----|------|-----|------|-----|
| B82 | 82 | B83 | 83 | B84 | 84 | B85 | 85 |
| B86 | 86 | B87 | 87 | B88 | 88 | B89 | 89 |
| B90 | 90 | B91 | 91 | B92 | 92 | B93 | 93 |
| B94 | 94 | B95 | 95 | B96 | 96 | B97 | 97 |
| B98 | 98 | B99 | 99 | B100 | 100 | B101 | 101 |
| B102 | 102 | B103 | 103 | B104 | 104 | B105 | 105 |
| B106 | 106 | B107 | 107 | B108 | 108 | B109 | 109 |
| B110 | 110 | B111 | 111 | B112 | 112 | B113 | 113 |
| B114 | 114 | B115 | 115 | B116 | 116 | B117 | 117 |
| B118 | 118 | B119 | 119 | B120 | 120 | B121 | 121 |
| B122 | 122 | B123 | 123 | B124 | 124 | B125 | 125 |
| B126 | 126 | B127 | 127 | B128 | 128 | B129 | 129 |
| B130 | 130 | B131 | 131 | B132 | 132 | B133 | 133 |
| B134 | 134 | B135 | 135 | B136 | 136 | B137 | 137 |
| B138 | 138 | B139 | 139 | B140 | 140 | B141 | 141 |
| B142 | 142 | B143 | 143 | B144 | 144 | B145 | 145 |
| B146 | 146 | B147 | 147 | B148 | 148 | B149 | 149 |
| B150 | 150 | B151 | 151 | B152 | 152 | B153 | 153 |
| B154 | 154 | B155 | 155 | B156 | 156 | B157 | 157 |
| B158 | 158 | B159 | 159 | B160 | 160 | B161 | 161 |
| B162 | 162 | B163 | 163 | B164 | 164 | B165 | 165 |
| B166 | 166 | B167 | 167 | B168 | 168 | B169 | 169 |
| B170 | 170 | B171 | 171 | B172 | 172 | B173 | 173 |
| B174 | 174 | B175 | 175 | B176 | 176 | B177 | 177 |
| B178 | 178 | B179 | 179 | B180 | 180 | B181 | 181 |
| B182 | 182 | B183 | 183 | B184 | 184 | B185 | 185 |
| B186 | 186 | B187 | 187 | B188 | 188 | B189 | 189 |
| B190 | 190 | B191 | 191 | B192 | 192 | B193 | 193 |
| B194 | 194 | B195 | 195 | B196 | 196 | B197 | 197 |
| B198 | 198 | B199 | 199 | B200 | 200 | B201 | 201 |
| B202 | 202 | B203 | 203 | B204 | 204 | B205 | 205 |
| B206 | 206 | B207 | 207 | B208 | 208 | B209 | 209 |
| B210 | 210 | B211 | 211 | B212 | 212 | B213 | 213 |
| B214 | 214 | B215 | 215 | B216 | 216 | B217 | 217 |
| B218 | 218 | B219 | 219 | B220 | 220 | B221 | 221 |
| B222 | 222 | B223 | 223 | B224 | 224 | B225 | 225 |
| B226 | 226 | B227 | 227 | B228 | 228 | B229 | 229 |

| | | | | | | | |
|------|-----|------|-----|------|-----|------|-----|
| B230 | 230 | B231 | 231 | B232 | 232 | B233 | 233 |
| B234 | 234 | B235 | 235 | B236 | 236 | B237 | 237 |
| B238 | 238 | B239 | 239 | B240 | 240 | B241 | 241 |
| B242 | 242 | B243 | 243 | B244 | 244 | B245 | 245 |
| B246 | 246 | B247 | 247 | B248 | 248 | B249 | 249 |
| B250 | 250 | B251 | 251 | B252 | 252 | B253 | 253 |
| B254 | 254 | B255 | 255 | B256 | 256 | B257 | 257 |
| B258 | 258 | B259 | 259 | B260 | 260 | B261 | 261 |
| B262 | 262 | B263 | 263 | B264 | 264 | B265 | 265 |
| B266 | 266 | B267 | 267 | B268 | 268 | B269 | 269 |
| B270 | 270 | B271 | 271 | B272 | 272 | B273 | 273 |
| B274 | 274 | B275 | 275 | B276 | 276 | B277 | 277 |
| B278 | 278 | B279 | 279 | B280 | 280 | B281 | 281 |
| B282 | 282 | B283 | 283 | B284 | 284 | B285 | 285 |
| B286 | 286 | B287 | 287 | B288 | 288 | B289 | 289 |
| B290 | 290 | B291 | 291 | B292 | 292 | B293 | 293 |
| B294 | 294 | B295 | 295 | B296 | 296 | B297 | 297 |
| B298 | 298 | B299 | 299 | B300 | 300 | B301 | 301 |
| B302 | 302 | B303 | 303 | B304 | 304 | B305 | 305 |
| B306 | 306 | B307 | 307 | B308 | 308 | B309 | 309 |
| B310 | 310 | B311 | 311 | B312 | 312 | B313 | 313 |
| B314 | 314 | B315 | 315 | B316 | 316 | B317 | 317 |
| B318 | 318 | B319 | 319 | B320 | 320 | B321 | 321 |
| B322 | 322 | B323 | 323 | B324 | 324 | B325 | 325 |
| B326 | 326 | B327 | 327 | B328 | 328 | B329 | 329 |
| B330 | 330 | B331 | 331 | B332 | 332 | B333 | 333 |
| B334 | 334 | B335 | 335 | B336 | 336 | B337 | 337 |
| B338 | 338 | B339 | 339 | B340 | 340 | B341 | 341 |
| B342 | 342 | B343 | 343 | B344 | 344 | B345 | 345 |
| B346 | 346 | B347 | 347 | B348 | 348 | B349 | 349 |
| B350 | 350 | B351 | 351 | B352 | 352 | B353 | 353 |
| B354 | 354 | B355 | 355 | B356 | 356 | B357 | 357 |
| B358 | 358 | B359 | 359 | B360 | 360 | B361 | 361 |
| B362 | 362 | B363 | 363 | B364 | 364 | B365 | 365 |
| B366 | 366 | B367 | 367 | B368 | 368 | B369 | 369 |
| B370 | 370 | B371 | 371 | B372 | 372 | B373 | 373 |
| B374 | 374 | B375 | 375 | B376 | 376 | B377 | 377 |

| | | | | | | | |
|------|-----|------|-----|------|-----|------|-----|
| B378 | 378 | B379 | 379 | B380 | 380 | B381 | 381 |
| B382 | 382 | B383 | 383 | B384 | 384 | B385 | 385 |
| B386 | 386 | B387 | 387 | B388 | 388 | B389 | 389 |
| B390 | 390 | B391 | 391 | B392 | 392 | B393 | 393 |
| B394 | 394 | B395 | 395 | B396 | 396 | B397 | 397 |
| B398 | 398 | B399 | 399 | B400 | 400 | B401 | 401 |
| B402 | 402 | B403 | 403 | B404 | 404 | B405 | 405 |
| B406 | 406 | B407 | 407 | B408 | 408 | B409 | 409 |
| B410 | 410 | B411 | 411 | B412 | 412 | B413 | 413 |
| B414 | 414 | B415 | 415 | B416 | 416 | B417 | 417 |
| B418 | 418 | B419 | 419 | B420 | 420 | B421 | 421 |
| B422 | 422 | B423 | 423 | B424 | 424 | B425 | 425 |
| B426 | 426 | B427 | 427 | B428 | 428 | B429 | 429 |
| B430 | 430 | B431 | 431 | B432 | 432 | B433 | 433 |
| B434 | 434 | B435 | 435 | B436 | 436 | B437 | 437 |
| B438 | 438 | B439 | 439 | B440 | 440 | B441 | 441 |
| B442 | 442 | B443 | 443 | B444 | 444 | B445 | 445 |
| B446 | 446 | B447 | 447 | B448 | 448 | B449 | 449 |
| B450 | 450 | B451 | 451 | B452 | 452 | B453 | 453 |
| B454 | 454 | B455 | 455 | B456 | 456 | B457 | 457 |
| B458 | 458 | B459 | 459 | B460 | 460 | B461 | 461 |
| B462 | 462 | B463 | 463 | B464 | 464 | B465 | 465 |
| B466 | 466 | B467 | 467 | B468 | 468 | B469 | 469 |
| B470 | 470 | B471 | 471 | B472 | 472 | B473 | 473 |
| B474 | 474 | B475 | 475 | B476 | 476 | B477 | 477 |
| B478 | 478 | B479 | 479 | B480 | 480 | B481 | 481 |
| B482 | 482 | B483 | 483 | B484 | 484 | B485 | 485 |
| B486 | 486 | B487 | 487 | B488 | 488 | B489 | 489 |
| B490 | 490 | B491 | 491 | B492 | 492 | B493 | 493 |
| B494 | 494 | B495 | 495 | B496 | 496 | B497 | 497 |
| B498 | 498 | B499 | 499 | B500 | 500 | B501 | 501 |
| B502 | 502 | B503 | 503 | B504 | 504 | B505 | 505 |
| B506 | 506 | B507 | 507 | B508 | 508 | B509 | 509 |
| B510 | 510 | B511 | 511 | B512 | 512 | B513 | 513 |
| B514 | 514 | B515 | 515 | B516 | 516 | B517 | 517 |
| B518 | 518 | B519 | 519 | B520 | 520 | B521 | 521 |
| B522 | 522 | B523 | 523 | B524 | 524 | B525 | 525 |

| | | | | | | | |
|------|-----|------|-----|------|-----|------|-----|
| B526 | 526 | B527 | 527 | B528 | 528 | B529 | 529 |
| B530 | 530 | B531 | 531 | B532 | 532 | B533 | 533 |
| B534 | 534 | B535 | 535 | B536 | 536 | B537 | 537 |
| B538 | 538 | B539 | 539 | B540 | 540 | B541 | 541 |
| B542 | 542 | B543 | 543 | B544 | 544 | B545 | 545 |
| B546 | 546 | B547 | 547 | B548 | 692 | B549 | 730 |
| B550 | 881 | B551 | 885 | B552 | 919 | | |

Bảng C1 được xây dựng theo cách tương tự như của Bảng B1 ở trên, ngoại trừ việc thay thế các mục nhập trong cột “Thành phần A (Hợp chất só)” với các mục nhập trong cột tương ứng “Thành phần A (Hợp chất só)” được thể hiện dưới đây. Do đó, ví dụ, trong bảng C1, các mục nhập trong cột “Thành phần A (Hợp chất só)” tất cả được thể hiện là “1(R)” (tức là, cấu hình R của hợp chất 1 được xác định trong bảng A), và và hỗn hợp của hợp chất 1(R) và “topramezon” được liệt kê cụ thể trong hàng đầu tiên dưới tiêu đề của Bảng C1. Các bảng từ C2 đến C535 được xây dựng tương tự.

| Bảng | "Thành phần A (Hợp chất só)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất só)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất só)" mục nhập cột | Bảng | "Thành phần A (Hợp chất só)" mục nhập cột |
|------|---|------|---|------|---|------|---|
| C2 | 2(R) | C3 | 3(R) | C4 | 4(R) | C5 | 5(R) |
| C6 | 6(R) | C7 | 7(R) | C8 | 8(R) | C9 | 9(R) |
| C10 | 10(R) | C11 | 11(R) | C12 | 12(R) | C13 | 13(R) |
| C14 | 14(R) | C15 | 15(R) | C16 | 16(R) | C17 | 17(R) |
| C18 | 18(R) | C19 | 19(R) | C20 | 20(R) | C21 | 21(R) |
| C22 | 22(R) | C23 | 23(R) | C24 | 24(R) | C25 | 25(R) |
| C26 | 26(R) | C27 | 27(R) | C28 | 28(R) | C29 | 29(R) |
| C30 | 30(R) | C31 | 31(R) | C32 | 32(R) | C33 | 33(R) |
| C34 | 34(R) | C35 | 35(R) | C36 | 36(R) | C37 | 37(R) |
| C38 | 38(R) | C39 | 39(R) | C40 | 40(R) | C41 | 41(R) |
| C42 | 42(R) | C43 | 43(R) | C44 | 44(R) | C45 | 45(R) |
| C46 | 46(R) | C47 | 47(R) | C48 | 48(R) | C49 | 49(R) |
| C50 | 50(R) | C51 | 51(R) | C52 | 52(R) | C53 | 53(R) |
| C54 | 54(R) | C55 | 55(R) | C56 | 56(R) | C57 | 57(R) |
| C58 | 58(R) | C59 | 59(R) | C60 | 60(R) | C61 | 61(R) |
| C62 | 62(R) | C63 | 63(R) | C64 | 64(R) | C65 | 65(R) |
| C66 | 66(R) | C67 | 67(R) | C68 | 68(R) | C69 | 69(R) |

| | | | | | | | |
|------|--------|------|--------|------|--------|------|--------|
| C70 | 70(R) | C71 | 71(R) | C72 | 72(R) | C73 | 73(R) |
| C74 | 74(R) | C75 | 75(R) | C76 | 76(R) | C77 | 77(R) |
| C78 | 78(R) | C79 | 79(R) | C80 | 80(R) | C81 | 81(R) |
| C82 | 82(R) | C83 | 83(R) | C84 | 84(R) | C85 | 85(R) |
| C86 | 86(R) | C87 | 87(R) | C88 | 88(R) | C89 | 89(R) |
| C90 | 90(R) | C91 | 91(R) | C92 | 92(R) | C93 | 93(R) |
| C94 | 94(R) | C95 | 95(R) | C96 | 96(R) | C97 | 97(R) |
| C98 | 98(R) | C99 | 99(R) | C100 | 100(R) | C101 | 101(R) |
| C102 | 102(R) | C103 | 103(R) | C104 | 104(R) | C105 | 105(R) |
| C106 | 106(R) | C107 | 107(R) | C108 | 108(R) | C109 | 109(R) |
| C110 | 110(R) | C111 | 111(R) | C112 | 112(R) | C113 | 113(R) |
| C114 | 114(R) | C115 | 115(R) | C116 | 116(R) | C117 | 117(R) |
| C118 | 118(R) | C119 | 119(R) | C120 | 120(R) | C121 | 121(R) |
| C122 | 122(R) | C123 | 123(R) | C124 | 124(R) | C125 | 125(R) |
| C126 | 126(R) | C127 | 127(R) | C128 | 128(R) | C129 | 129(R) |
| C130 | 130(R) | C131 | 131(R) | C132 | 132(R) | C133 | 133(R) |
| C134 | 134(R) | C135 | 135(R) | C136 | 136(R) | C137 | 137(R) |
| C138 | 138(R) | C139 | 139(R) | C140 | 140(R) | C141 | 141(R) |
| C142 | 142(R) | C143 | 143(R) | C144 | 144(R) | C145 | 145(R) |
| C146 | 146(R) | C147 | 147(R) | C148 | 148(R) | C149 | 149(R) |
| C150 | 150(R) | C151 | 151(R) | C152 | 152(R) | C153 | 153(R) |
| C154 | 154(R) | C155 | 155(R) | C156 | 156(R) | C157 | 157(R) |
| C158 | 158(R) | C159 | 159(R) | C160 | 160(R) | C161 | 161(R) |
| C162 | 162(R) | C163 | 163(R) | C164 | 164(R) | C165 | 165(R) |
| C166 | 166(R) | C167 | 167(R) | C168 | 168(R) | C169 | 169(R) |
| C170 | 170(R) | C171 | 171(R) | C172 | 172(R) | C173 | 173(R) |
| C174 | 174(R) | C175 | 175(R) | C176 | 176(R) | C177 | 177(R) |
| C178 | 178(R) | C179 | 179(R) | C180 | 180(R) | C181 | 181(R) |
| C182 | 182(R) | C183 | 183(R) | C184 | 184(R) | C185 | 185(R) |
| C186 | 186(R) | C187 | 187(R) | C188 | 188(R) | C189 | 193(R) |
| C190 | 547(R) | C191 | 195(R) | C192 | 196(R) | C193 | 197(R) |
| C194 | 198(R) | C195 | 199(R) | C196 | 200(R) | C197 | 201(R) |
| C198 | 202(R) | C199 | 203(R) | C200 | 204(R) | C201 | 205(R) |
| C202 | 206(R) | C203 | 207(R) | C204 | 208(R) | C205 | 209(R) |
| C206 | 210(R) | C207 | 211(R) | C208 | 212(R) | C209 | 213(R) |
| C210 | 214(R) | C211 | 215(R) | C212 | 216(R) | C213 | 217(R) |
| C214 | 218(R) | C215 | 219(R) | C216 | 220(R) | C217 | 221(R) |

| | | | | | | | |
|------|--------|------|--------|------|--------|------|--------|
| C218 | 222(R) | C219 | 223(R) | C220 | 224(R) | C221 | 225(R) |
| C222 | 226(R) | C223 | 227(R) | C224 | 228(R) | C225 | 229(R) |
| C226 | 230(R) | C227 | 231(R) | C228 | 232(R) | C229 | 233(R) |
| C230 | 234(R) | C231 | 235(R) | C232 | 236(R) | C233 | 237(R) |
| C234 | 238(R) | C235 | 239(R) | C236 | 240(R) | C237 | 241(R) |
| C238 | 242(R) | C239 | 243(R) | C240 | 244(R) | C241 | 245(R) |
| C242 | 246(R) | C243 | 247(R) | C244 | 248(R) | C245 | 249(R) |
| C246 | 250(R) | C247 | 251(R) | C248 | 252(R) | C249 | 253(R) |
| C250 | 254(R) | C251 | 255(R) | C252 | 256(R) | C253 | 257(R) |
| C254 | 258(R) | C255 | 259(R) | C256 | 260(R) | C257 | 261(R) |
| C258 | 262(R) | C259 | 263(R) | C260 | 264(R) | C261 | 265(R) |
| C262 | 266(R) | C263 | 267(R) | C264 | 268(R) | C265 | 269(R) |
| C266 | 270(R) | C267 | 271(R) | C268 | 272(R) | C269 | 273(R) |
| C270 | 274(R) | C271 | 275(R) | C272 | 276(R) | C273 | 277(R) |
| C274 | 278(R) | C275 | 279(R) | C276 | 280(R) | C277 | 281(R) |
| C278 | 282(R) | C279 | 283(R) | C280 | 284(R) | C281 | 285(R) |
| C282 | 286(R) | C283 | 287(R) | C284 | 288(R) | C285 | 289(R) |
| C286 | 290(R) | C287 | 291(R) | C288 | 292(R) | C289 | 293(R) |
| C290 | 294(R) | C291 | 295(R) | C292 | 296(R) | C293 | 297(R) |
| C294 | 298(R) | C295 | 299(R) | C296 | 300(R) | C297 | 301(R) |
| C298 | 302(R) | C299 | 303(R) | C300 | 304(R) | C301 | 305(R) |
| C302 | 306(R) | C303 | 307(R) | C304 | 308(R) | C305 | 309(R) |
| C306 | 310(R) | C307 | 311(R) | C308 | 312(R) | C309 | 313(R) |
| C310 | 314(R) | C311 | 315(R) | C312 | 316(R) | C313 | 317(R) |
| C314 | 318(R) | C315 | 319(R) | C316 | 320(R) | C317 | 321(R) |
| C318 | 322(R) | C319 | 323(R) | C320 | 324(R) | C321 | 325(R) |
| C322 | 326(R) | C323 | 327(R) | C324 | 328(R) | C325 | 329(R) |
| C326 | 330(R) | C327 | 331(R) | C328 | 332(R) | C329 | 333(R) |
| C330 | 334(R) | C331 | 335(R) | C332 | 336(R) | C333 | 337(R) |
| C334 | 338(R) | C335 | 339(R) | C336 | 340(R) | C337 | 341(R) |
| C338 | 342(R) | C339 | 343(R) | C340 | 344(R) | C341 | 345(R) |
| C342 | 346(R) | C343 | 347(R) | C344 | 348(R) | C345 | 349(R) |
| C346 | 350(R) | C347 | 351(R) | C348 | 352(R) | C349 | 353(R) |
| C350 | 354(R) | C351 | 355(R) | C352 | 356(R) | C353 | 357(R) |
| C354 | 358(R) | C355 | 359(R) | C356 | 360(R) | C357 | 361(R) |
| C358 | 362(R) | C359 | 363(R) | C360 | 364(R) | C361 | 365(R) |
| C362 | 366(R) | C363 | 367(R) | C364 | 368(R) | C365 | 369(R) |

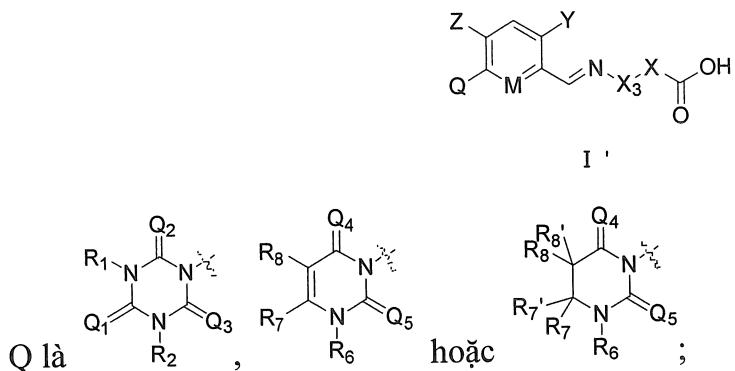
| | | | | | | | |
|------|--------|------|--------|------|--------|------|--------|
| C366 | 370(R) | C367 | 371(R) | C368 | 372(R) | C369 | 373(R) |
| C370 | 374(R) | C371 | 375(R) | C372 | 376(R) | C373 | 377(R) |
| C374 | 378(R) | C375 | 379(R) | C376 | 380(R) | C377 | 381(R) |
| C378 | 382(R) | C379 | 383(R) | C380 | 384(R) | C381 | 385(R) |
| C382 | 386(R) | C383 | 387(R) | C384 | 388(R) | C385 | 389(R) |
| C386 | 390(R) | C387 | 391(R) | C388 | 392(R) | C389 | 393(R) |
| C390 | 394(R) | C391 | 395(R) | C392 | 396(R) | C393 | 397(R) |
| C394 | 398(R) | C395 | 399(R) | C396 | 400(R) | C397 | 401(R) |
| C398 | 402(R) | C399 | 403(R) | C400 | 404(R) | C401 | 405(R) |
| C402 | 406(R) | C403 | 407(R) | C404 | 408(R) | C405 | 409(R) |
| C406 | 410(R) | C407 | 411(R) | C408 | 412(R) | C409 | 413(R) |
| C410 | 414(R) | C411 | 415(R) | C412 | 416(R) | C413 | 417(R) |
| C414 | 418(R) | C415 | 419(R) | C416 | 420(R) | C417 | 421(R) |
| C418 | 422(R) | C419 | 423(R) | C420 | 424(R) | C421 | 425(R) |
| C422 | 426(R) | C423 | 427(R) | C424 | 428(R) | C425 | 429(R) |
| C426 | 430(R) | C427 | 431(R) | C428 | 432(R) | C429 | 438(R) |
| C430 | 439(R) | C431 | 503(R) | C432 | 441(R) | C433 | 442(R) |
| C434 | 443(R) | C435 | 444(R) | C436 | 445(R) | C437 | 446(R) |
| C438 | 447(R) | C439 | 448(R) | C440 | 449(R) | C441 | 450(R) |
| C442 | 451(R) | C443 | 452(R) | C444 | 453(R) | C445 | 454(R) |
| C446 | 455(R) | C447 | 456(R) | C448 | 457(R) | C449 | 458(R) |
| C450 | 459(R) | C451 | 460(R) | C452 | 461(R) | C453 | 462(R) |
| C454 | 463(R) | C455 | 464(R) | C456 | 465(R) | C457 | 466(R) |
| C458 | 467(R) | C459 | 468(R) | C460 | 469(R) | C461 | 508(R) |
| C462 | 471(R) | C463 | 472(R) | C464 | 473(R) | C465 | 474(R) |
| C466 | 475(R) | C467 | 476(R) | C468 | 477(R) | C469 | 478(R) |
| C470 | 533(R) | C471 | 542(R) | C472 | 481(R) | C473 | 482(R) |
| C474 | 483(R) | C475 | 484(R) | C476 | 543(R) | C477 | 486(R) |
| C478 | 487(R) | C479 | 488(R) | C480 | 489(R) | C481 | 490(R) |
| C482 | 491(R) | C483 | 492(R) | C484 | 493(R) | C485 | 692(R) |
| C486 | 495(R) | C487 | 496(R) | C488 | 497(R) | C489 | 498(R) |
| C490 | 499(R) | C491 | 500(R) | C492 | 501(R) | C493 | 502(R) |
| C494 | 504(R) | C495 | 505(R) | C496 | 506(R) | C497 | 507(R) |
| C498 | 509(R) | C499 | 510(R) | C500 | 511(R) | C501 | 512(R) |
| C502 | 513(R) | C503 | 514(R) | C504 | 515(R) | C505 | 516(R) |
| C506 | 517(R) | C507 | 518(R) | C508 | 519(R) | C509 | 520(R) |
| C510 | 521(R) | C511 | 522(R) | C512 | 523(R) | C513 | 524(R) |

| | | | | | | | |
|------|--------|------|--------|------|--------|------|--------|
| C514 | 525(R) | C515 | 526(R) | C516 | 527(R) | C517 | 528(R) |
| C518 | 529(R) | C519 | 530(R) | C520 | 531(R) | C521 | 532(R) |
| C522 | 534(R) | C523 | 535(R) | C524 | 536(R) | C525 | 537(R) |
| C526 | 538(R) | C527 | 539(R) | C528 | 540(R) | C529 | 541(R) |
| C530 | 544(R) | C531 | 545(R) | C532 | 730(R) | C1 | 1(R) |
| C533 | 881(R) | C534 | 885(R) | C535 | 919(R) | | |

Đồng thời, sau một số thử nghiệm, người ta thấy rằng các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có tính chọn lọc tốt đối với nhiều loại cỏ thuộc họ gramin như zoysia japonica, cỏ bermuda, cỏ fescue cao, cỏ bluegrass, ryegrass và paspalum ven biển, v.v., và có khả năng kiểm soát nhiều loại cỏ dại quan trọng và cỏ dại lá rộng. Các hợp chất cũng cho thấy tính chọn lọc tuyệt vời và giá trị thương mại trong các thử nghiệm trên mía, đậu tương, bông, hướng dương dầu, khoai tây, vườn cây ăn quả và rau trong các phương pháp ứng dụng thuốc diệt cỏ khác nhau.

Yêu cầu bảo hộ

1. Hợp chất iminoaryl được thể dãn xuất bởi axit carboxylic, được biểu diễn bởi công thức tổng quát I':



Y là halogen, haloalkyl hoặc xyano;

Z là halogen;

M là CH hoặc N;

X là $-CX_1X_2\text{-}(alkyl)_n\text{-}$, $\text{-alkyl-CX}_1X_2\text{-}(alkyl)_n\text{-}$ hoặc $\text{-(CH}_2\text{)}_r\text{-}$;

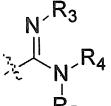
X_1, X_2 mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyanoalkyl, hydroxyalkyl, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylamino, haloalkoxy, haloalkylthio, alkyl carbonyl, alkoxy carbonyl, alkoxyalkyl, haloalkoxyalkyl, alkylaminoalkyl, aryl, heteroxycycl, arylalkyl hoặc heteroxyclic alkyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi halogen, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “aryl”, “heteroxycycl”, “arylalkyl” và “heteroxyclic alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thể hoặc được thể bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxyaloalkyl, xycloalkyl được thể alkyl, $-\text{OR}_{13}$, $-\text{SR}_{13}$, $-(\text{CO})\text{OR}_{13}$, $-(\text{SO}_2)\text{R}_{13}$, $-\text{N}(\text{R}_{13})_2$ và $-\text{O-alkyl-(CO)OR}_{13}$, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{-}$ hoặc $-\text{OCH}_2\text{O-}$ không được thể hoặc được thể halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X_1, X_2 không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

X_3 là O, S, NH hoặc N-alkyl;

Q_1, Q_2, Q_3, Q_4, Q_5 mỗi nhóm độc lập là O hoặc S;

R_1 , R_2 mỗi nhóm độc lập là H, xyano, alkyl, alkenyl, alkynyl, formyl alkyl, xyanoalkyl,

amino, aminoalkyl, amino carbonyl, amino carbonylalkyl, aminosulfonyl, xycloalkyl, cycloalkylalkyl, cycloalkenyl, cycloalkenyl alkyl, heteroxycycl, heteroxyclic alkyl, aryl,

arylalkyl, $R_4R_5N-(CO)-NR_3-$,  , $R_3-S(O)_m-(alkyl)_n-$, $R_3-O-(alkyl)_n-$, $R_3-(CO)-(alkyl)_n-$, $R_3-O-(alkyl)_n-(CO)-$, $R_3-(CO)-O-(alkyl)_n-$, $R_3-S-(CO)-(alkyl)_n-$, $R_3-O-(CO)-alkyl-$ hoặc $R_3-O-(CO)-O-alkyl-$, trong đó,

“alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

“amino”, “aminoalkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonylalkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc nhiều nhóm được chọn từ $-R_{11}$, $-OR_{11}$, $-(CO)R_{11}$, $-(CO)OR_{11}$, $-alkyl-(CO)OR_{11}$, $-(SO_2)R_{11}$, $-(SO_2)OR_{11}$, $-alkyl-(SO_2)R_{11}$, $-(CO)N(R_{12})_2$ và $-(SO_2)N(R_{12})_2$,

“xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “heteroxcycl”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, $-OR_{13}$, $-SR_{13}$, $-(CO)OR_{13}$, $-(SO_2)R_{13}$, $-N(R_{13})_2$ và $-O-alkyl-(CO)OR_{13}$, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với $-OCH_2CH_2-$ hoặc $-OCH_2O-$ không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R_6 là alkyl, alkenyl, alkynyl hoặc xyano, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, alkoxy và alkoxy carbonyl;

R_7 , R_7' , R_8 , R_8' mỗi nhóm độc lập là H, alkyl, halogen, haloalkyl, amino, hydroxyalkyl hoặc alkoxy;

R_3 , R_4 , R_5 mỗi nhóm độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, cycloalkylalkyl, cycloalkenyl, cycloalkenylalkyl, heteroxycycl, heteroxyclic alkyl, aryl hoặc arylalkyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”,

“xycloalkenylalkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₁₁ độc lập là alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenylalkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, alkyl, haloalkyl, alkoxy carbonyl, alkylthio, alkylsulfonyl, alkoxy và haloalkoxy;

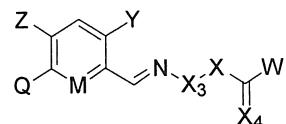
R₁₂ độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxy, alkylsulfonyl, xycloalkyl, xycloalkenylalkyl, xycloalkenyl hoặc xycloalkenylalkyl, hoặc N(R₁₂)₂ in -(CO)N(R₁₂)₂ hoặc -(SO₂)N(R₁₂)₂ mỗi nhóm độc lập là heteroxycycl không được thê hoặc được thê với nguyên tử nitơ ở vị trí 1;

R₁₃ độc lập là H, alkyl, haloalkyl, phenyl hoặc phenyl được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, alkyl, haloalkyl, alkoxy carbonyl, alkylthio, alkylsulfonyl, alkoxy và haloalkoxy;

r là số nguyên bằng 2 hoặc lớn hơn; m bằng 0, 1 hoặc 2; n độc lập bằng 0 hoặc 1;

dẫn xuất có nghĩa là nhóm chức axit carboxylic trong công thức tổng quát được thay đổi este, axylhydrazit, imidat, thioimidat, amidin, amit, orthoeste, axyl xyanua, axyl halogenua, thioeste, thionoeste, dithioleste, nitril bất kỳ hoặc dẫn xuất axit carboxylic bất kỳ khác.

2. Hợp chất iminoaryl được thê dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm 1, khác biệt ở chỗ hợp chất này được biểu diễn bởi công thức tổng quát I:

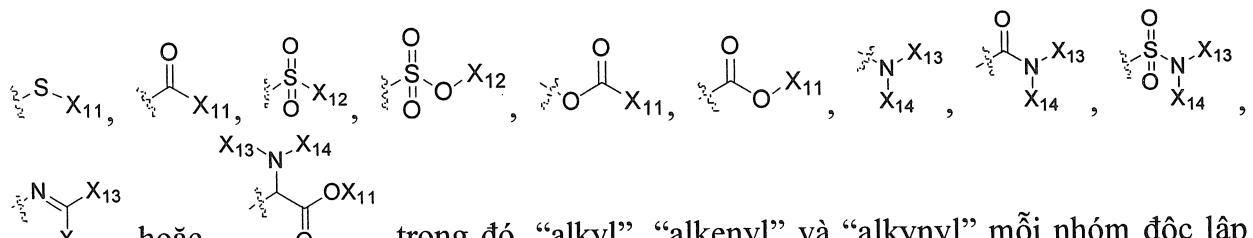


I

trong đó, W là OX₅, SX₅ hoặc N(X₅)₂;

X₃, X₄ mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-alkyl;

X_5 là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkenyl, heteroxycycl, aryl, $\text{O}_\text{x} X_{11}$,



hoặc $\text{N}(X_{13})X_{14}$ hoặc $\text{C}(=O)\text{O}X_{11}$, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” và “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro,

xycloalkyl, xycloalkenyl, heteroxycycl, aryl, $\text{O}_\text{x} X_{11}$, $\text{S}_\text{x} X_{11}$, $\text{C}(=O)X_{11}$, $\text{O}=\text{C}(X_{11})\text{O}$,

$\text{O}=\text{C}(O_\text{x} X_{11})$, $\text{N}_\text{x} X_{13}$, $\text{N}(X_{13})X_{14}$, $\text{C}(=O)N(X_{13})X_{14}$ và $\text{O}=\text{N}(X_{13})X_{14}$, “xycloalkyl”, “xycloalkenyl”, “heteroxycycl” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxyxcloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc $\text{N}(X_5)_2$ là $\text{N}(X_{13})X_{14}$ hoặc heteroxycycl không được thê hoặc được thê với nguyên tử cacbon ở vị trí 1;

X_{11} độc lập là H, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, heteroxycycl, heteroxyclic

alkyl, aryl, arylalkyl hoặc $\text{Q}-\text{M}-\text{C}(=\text{N}-\text{X}_3-\text{X}_4)-\text{Y}$, trong đó, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxyxcloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, heteroxcycll, heteroxyclic alkyl, aryl hoặc arylalkyl, trong đó, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “heteroxcycll”, “heteroxyclic alkyl”, “aryl” và “arylalkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₃, X₁₄ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, alkoxy, alkoxyalkyl, alkyl carbonyl, alkoxy carbonyl, alkylsulfonyl, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, xycloalkylalkyl, xycloalkenyl, xycloalkenyl alkyl, aryl, arylalkyl, heteroxcycll hoặc heteroxyclic alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành cấu trúc vòng không được thê hoặc được thê, hoặc N, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành cấu trúc heteroxcycll không được thê hoặc được thê với nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “alkyl”, “alkenyl” “alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “xycloalkyl”, “xycloalkylalkyl”, “xycloalkenyl”, “xycloalkenyl alkyl”, “aryl”, “arylalkyl”, “heteroxcycll” và “heteroxyclic alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, alkyl, alkenyl, alkynyl, xycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloxycloalkyl, xycloalkyl được thê alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-alkyl-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất.

3. Hợp chất iminoaryl được thê dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm 1 hoặc 2, khác biệt ở chỗ,

Y là halogen, halo C1-C8 alkyl hoặc xyano;

X là -CX₁X₂-(C1-C8 alkyl)_n-, -(C1-C8 alkyl)-CX₁X₂-(C1-C8 alkyl)_n- hoặc -(CH₂)_r;

X₁, X₂ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C1-C8 alkyl, hydroxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylamino, halo C1-C8 alkoxy, halo C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkyl carbonyl, C1-C8

alkoxy carbonyl, C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkylamino C1-C8 alkyl, aryl, heteroxycycll, aryl C1-C8 alkyl hoặc heteroxycycll C1-C8 alkyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “aryl”, “heteroxycycll”, “aryl C1-C8 alkyl” và “heteroxycycll C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X₁, X₂ không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

R₁, R₂ mỗi nhóm độc lập là H, xyano, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, formyl C1-C8 alkyl, xyano C1-C8 alkyl, amino, amino C1-C8 alkyl, amino carbonyl, amino carbonyl C1-C8 alkyl, aminosulfonyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxycycll, heteroxycycll

C1-C8 alkyl, aryl, aryl C1-C8 alkyl, R₄R₅N-(CO)-NR₃- , R₃-S(O)_m-(C1-C8 alkyl)_n- , R₃-O-(C1-C8 alkyl)_n- , R₃-(CO)-(C1-C8 alkyl)_n- , R₃-O-(C1-C8 alkyl)_n-(CO)-, R₃-(CO)-O-(C1-C8 alkyl)_n- , R₃-S-(CO)-(C1-C8 alkyl)_n- , R₃-O-(CO)-(C1-C8 alkyl)- hoặc R₃-O-(CO)-O-(C1-C8 alkyl)-, trong đó,

“C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

“amino”, “amino C1-C8 alkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonyl C1-C8 alkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc hai nhóm được chọn từ -R₁₁, -OR₁₁, -(CO)R₁₁, -(CO)OR₁₁, -(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₁, -(SO₂)R₁₁, -(SO₂)OR₁₁, -(C1-C8 alkyl)-(SO₂)R₁₁, -(CO)N(R₁₂)₂ và -(SO₂)N(R₁₂)₂,

“C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxycycll”, “heteroxycycll C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl,

halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₆ represents C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl hoặc xyano, trong đó, the “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, C1-C8 alkoxy và C1-C8 alkoxy carbonyl;

R₇, R_{7'}, R₈, R_{8'} mỗi nhóm độc lập là H, C1-C8 alkyl, halogen, halo C1-C8 alkyl, amino, hydroxy C1-C8 alkyl hoặc C1-C8 alkoxy;

R₃, R₄, R₅ mỗi nhóm độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C8 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C8 alkyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thê C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₁₁ độc lập là C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkoxy và halo C1-C8 alkoxy;

R₁₂ độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkylsulfonyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl

hoặc C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, hoặc N(R₁₂)₂ in -(CO)N(R₁₂)₂ hoặc -(SO₂)N(R₁₂)₂ độc lập

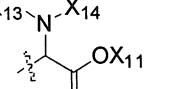
là heteroxcycll , ,  hoặc  với nguyên tử nito ở vị trí 1 mà không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo và C1-C8 alkyl;

R₁₃ độc lập là H, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, phenyl hoặc phenyl được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, halo C1-C8 alkyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylthio, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkoxy và halo C1-C8 alkoxy;

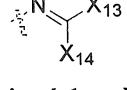
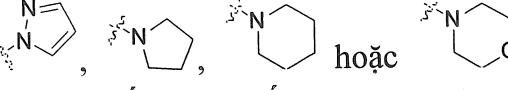
r là 2, 3, 4, 5 hoặc 6;

tốt hơn là, khi công thức tổng quát là I, X₃, X₄ mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-(C1-C8)alkyl;

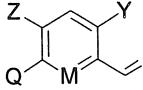
X₅ là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8

xycloalkenyl, heteroxcycll, aryl, , , , , , , , , , ,  hoặc , trong đó, “C1-C8 alkyl”, “C2-C8 alkenyl” và “C2-C8 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkenyl, heteroxcycll, aryl, , , , , , , , , , 

C3-C8 xycloalkenyl, heteroxcycll, aryl, , , , , , , , , ,  và , “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “heteroxcycll” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thế C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thế hoặc được thế halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc $N(X_5)_2$ là  hoặc heteroxycycll  với nguyên tử nito ở vị trí 1 mà không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo và C1-C8 alkyl;

X_{11} độc lập là H, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxycycll, heteroxycycll

C1-C8 alkyl, aryl, aryl C1-C8 alkyl hoặc , trong đó, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxycycll”, “heteroxycycll C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thế C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thế hoặc được thế halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X_{12} độc lập là C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl, C3-C8 xycloalkenyl, C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl, heteroxycycll, heteroxycycll C1-C8 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C8 alkyl, trong đó, “C3-C8 xycloalkyl”, “C3-C8 xycloalkyl C1-C8 alkyl”, “C3-C8 xycloalkenyl”, “C3-C8 xycloalkenyl C1-C8 alkyl”, “heteroxycycll”, “heteroxycycll C1-C8 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C8 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, halo C1-C8 alkyl, halo C2-C8 alkenyl, halo C2-C8 alkynyl, halo C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkyl được thế C1-C8 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C8 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thế hoặc được thế halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X_{13} , X_{14} mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, C1-C8 alkoxy, C1-C8 alkoxy C1-C8 alkyl, C1-C8 alkyl carbonyl, C1-C8 alkoxy carbonyl, C1-C8 alkylsulfonyl, C1-C8 alkyl, C2-C8 alkenyl, C2-C8 alkynyl, C3-C8 xycloalkyl, C3-C8 xycloalkylalkyl, C3-C8

xycloalkenyl, C₃-C₈ xycloalkenyl C₁-C₈ alkyl, aryl, aryl C₁-C₈ alkyl, heteroxcyclyl hoặc heteroxcyclyl C₁-C₈ alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành carboxyclyl có 5~8 cạnh hoặc heteroxcyclyl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nitơ, hoặc N, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành heteroxcyclyl với nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “C₁-C₈ alkyl”, “C₂-C₈ alkenyl” và “C₂-C₈ alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C₃-C₈ xycloalkyl”, “C₃-C₈ xycloalkyl C₁-C₈ alkyl”, “C₃-C₈ xycloalkenyl”, “C₃-C₈ xycloalkenyl C₁-C₈ alkyl”, “aryl”, “aryl C₁-C₈ alkyl”, “heteroxcyclyl” và “heteroxcyclyl C₁-C₈ alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C₁-C₈ alkyl, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkynyl, C₃-C₈ xycloalkyl, halo C₁-C₈ alkyl, halo C₂-C₈ alkenyl, halo C₂-C₈ alkynyl, halo C₃-C₈ xycloalkyl, C₃-C₈ xycloalkyl được thê C₁-C₈ alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C₁-C₈ alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất, “carboxyclyl có 5~8 cạnh hoặc heteroxcyclyl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nitơ” không được thê hoặc được thê bởi 1-4 nhóm được chọn từ C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc vùng với aryl hoặc heteroxcyclyl tạo thành một vòng hợp nhất, “heteroxcyclyl với nguyên tử nitơ ở vị trí 1” không được thê hoặc được thê bởi ít nhất một nhóm được chọn từ oxo và C₁-C₈ alkyl.

4. Hợp chất iminoaryl được thê dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm 2 hoặc 3, khác biệt ở chỗ,

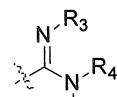
Y là halogen, halo C₁-C₆ alkyl hoặc xyano;

X là -CX₁X₂-(C₁-C₆ alkyl)_n-, -(C₁-C₆ alkyl)-CX₁X₂-(C₁-C₆ alkyl)_n- hoặc -(CH₂)_r;

X₁, X₂ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C₁-C₆ alkyl, hydroxy C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ alkylthio, C₁-C₆ alkylamino, halo C₁-C₆ alkoxy, halo C₁-C₆ alkylthio, C₁-C₆ alkyl carbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl, halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl, aryl, heteroxcyclyl, aryl C₁-C₆ alkyl hoặc heteroxcyclyl C₁-C₆ alkyl, trong đó, “C₁-C₆ alkyl”, “C₂-C₆ alkenyl” và “C₂-C₆ alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C₃-C₆ xycloalkyl”, “C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₆ alkyl”, “aryl”, “heteroxcyclyl”, “aryl C₁-C₆ alkyl” và “heteroxcyclyl C₁-C₆ alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl,

halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất; và X₁, X₂ không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

R₁, R₂ mỗi nhóm độc lập là H, xyano, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, formyl C1-C6 alkyl, xyano C1-C6 alkyl, amino, amino C1-C6 alkyl, amino carbonyl, amino carbonyl C1-C6 alkyl, aminosulfonyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxycycl, heteroxycycl



C1-C6 alkyl, aryl, aryl C1-C6 alkyl, R₄R₅N-(CO)-NR₃-, R₃-S(O)_m-(C1-C6 alkyl)_n-, R₃-O-(C1-C6 alkyl)_n-, R₃-(CO)-(C1-C6 alkyl)_n-, R₃-O-(C1-C6 alkyl)_n-(CO)-, R₃-(CO)-O-(C1-C6 alkyl)_n-, R₃-S-(CO)-(C1-C6 alkyl)_n-, R₃-O-(CO)-(C1-C6 alkyl)- hoặc R₃-O-(CO)-O-(C1-C6 alkyl)-, trong đó,

“C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen,

“amino”, “amino C1-C6 alkyl”, “amino carbonyl”, “amino carbonyl C1-C6 alkyl” và “aminosulfonyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi một hoặc hai nhóm được chọn từ -R₁₁, -OR₁₁, -(CO)R₁₁, -(CO)OR₁₁, -(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₁, -(SO₂)R₁₁, -(SO₂)OR₁₁, -(C1-C6 alkyl)-(SO₂)R₁₁, -(CO)N(R₁₂)₂ và -(SO₂)N(R₁₂)₂,

“C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxycycl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₆ là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl hoặc xyano, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc

được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, C1-C6 alkoxy và C1-C6 alkoxy carbonyl;

R₇, R_{7'}, R₈, R_{8'} mỗi nhóm độc lập là H, C1-C6 alkyl, halogen, halo C1-C6 alkyl, amino, hydroxy C1-C6 alkyl hoặc C1-C6 alkoxy;

R₃, R₄, R₅ mỗi nhóm độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C6 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C6 alkyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃ hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

R₁₁ độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, phenyl, benzyl, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “phenyl” và “benzyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkoxy và halo C1-C6 alkoxy;

R₁₂ độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkylsulfonyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl hoặc C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, hoặc N(R₁₂)₂ in -(CO)N(R₁₂)₂ hoặc -(SO₂)N(R₁₂)₂ độc lập là heteroxcyclyl , ,  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 mà không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

R₁₃ độc lập là H, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, phenyl hoặc phenyl được thê bởi 1,

2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, halo C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylthio, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkoxy và halo C1-C6 alkoxy;

tốt hơn, khi công thức tổng quát là I, X₃, X₄ mỗi nhóm độc lập là O, S, NH hoặc N-(C1-C6)alkyl;

X₅ là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6

xycloalkenyl, heteroxcyclyl, aryl, $\text{O}-\text{X}_{11}$, $\text{S}-\text{X}_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{11}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{X}_{12}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{12}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{11}$, $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, $\text{S}(=\text{O})-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, $\text{N}=\text{C}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$ hoặc $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{11}$, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi ít nhất một nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C6 xycloalkyl,

C3-C6 xycloalkenyl, heteroxcyclyl, aryl, $\text{O}-\text{X}_{11}$, $\text{S}-\text{X}_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{11}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{11}$,

$\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{O}-\text{X}_{11}$, $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, $\text{N}=\text{C}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, $\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$ và $\text{O}-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{X}_{13}$, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “heteroxcyclyl” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thế hoặc được thế bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thế C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thế hoặc được thế halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc N(X₅)₂ là $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{X}_{13}$ hoặc heteroxcyclyl $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{X}_{13}$, $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}_5\text{H}_5$, $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}_7\text{H}_9$ hoặc $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}_7\text{H}_9\text{O}$ hoặc $\text{N}(\text{X}_{14})-\text{C}_7\text{H}_9\text{O}_2$ với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 mà không được thế hoặc được thế bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

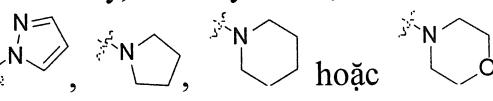
X₁₁ độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C6 alkyl, aryl, aryl C1-C6 alkyl hoặc

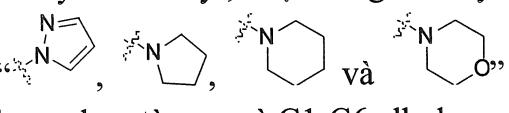
$\text{C}_6\text{H}_4-\text{Z}-\text{M}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{X}_{14})-\text{X}_{13}$, trong đó, “C3-C6 xycloalkyl”,

“C3-C6 cycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxycycl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 cycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 cycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 cycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, heteroxycycl, heteroxycycl C1-C6 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C6 alkyl, trong đó, “C3-C6 cycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “heteroxycycl”, “heteroxycycl C1-C6 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 cycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 cycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C6 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₃, X₁₄ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 cycloalkyl, C3-C6 cycloalkylalkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl, aryl, aryl C1-C6 alkyl, heteroxycycl hoặc heteroxycycl C1-C6 alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành carboxycl có 5~8 cạnh hoặc heteroxycycl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nitơ, hoặc N, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau,

tạo thành heteroxycycl  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 cycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C6 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C6 alkyl”, “aryl”, “aryl C1-C6 alkyl”, “heteroxycycl” và “heteroxycycl C1-C6 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl,

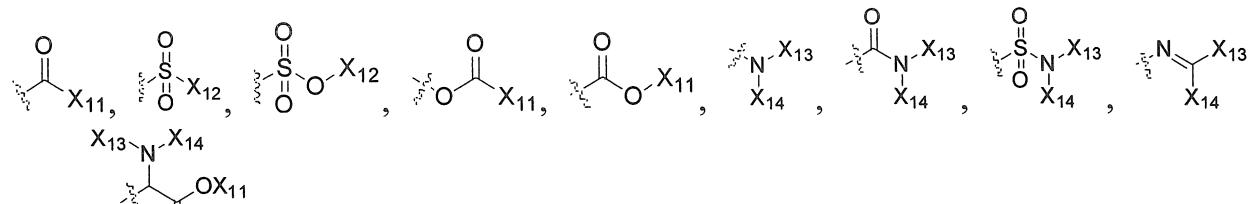
C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, halo C₁-C₆ alkyl, halo C₂-C₆ alkenyl, halo C₂-C₆ alkynyl, halo C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl được thê C₁-C₆ alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C₁-C₆ alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhât, “carboxycycl” có 5~8 cạnh hoặc heteroxycycl chứa oxy, lưu huỳnh hoặc nito” không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc cùng với aryl hoặc heteroxycycl tạo thành một vòng hợp nhât,  và không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C₁-C₆ alkyl.

5. Hợp chất iminoaryl được thê dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm bất kỳ trong các điểm từ 1 đến 4, khác biệt ở chỗ,

X là -CX₁X₂-(C₁-C₃ alkyl)_n-, -(C₁-C₃ alkyl)-CX₁X₂-(C₁-C₃ alkyl)_n- hoặc -(CH₂)_r;

X₁, X₂ mỗi nhóm độc lập là H, halogen, xyano, amino, nitro, formyl, xyano C₁-C₃ alkyl, hydroxy C₁-C₃ alkyl, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₃ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ alkylthio, C₁-C₆ alkylamino, halo C₁-C₆ alkoxy, halo C₁-C₆ alkylthio, C₁-C₆ alkyl carbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkyl, halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkyl, C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkyl, aryl, heteroxycycl, aryl C₁-C₃ alkyl hoặc heteroxycycl C₁-C₃ alkyl, trong đó, “C₁-C₆ alkyl”, “C₂-C₆ alkenyl” và “C₂-C₆ alkynyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C₃-C₆ xycloalkyl”, “C₃-C₆ xycloalkyl C₁-C₃ alkyl”, “aryl”, “heteroxycycl”, “aryl C₁-C₃ alkyl” và “heteroxycycl C₁-C₃ alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, halo C₁-C₆ alkyl, halo C₂-C₆ alkenyl, halo C₂-C₆ alkynyl, halo C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl được thê C₁-C₆ alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C₁-C₃ alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhât; và X₁, X₂ không cùng là hydro ở cùng một thời điểm;

tốt hơn, khi công thức tổng quát là I, X₅ là H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ xycloalkenyl, heteroxycycl, aryl, ---O---X_{11} , ---S---X_{11} ,



nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ halogen, xyano, nitro, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkenyl, heteroxcyclyl, aryl,

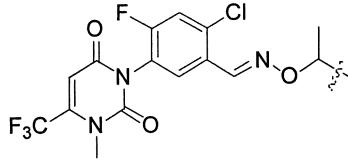
“C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “heteroxcyclyl” và “aryl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

hoặc N(X₅)₂ là

hoặc heteroxcyclyl

với nguyên tử nitơ ở vị trí 1 mà không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo và C1-C6 alkyl;

X₁₁ độc lập là H, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl



C1-C3 alkyl, aryl, aryl C1-C3 alkyl hoặc

, trong đó, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C3 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C3 alkyl” mỗi nhóm độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề

trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

X₁₂ độc lập là C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, heteroxcyclyl, heteroxcyclyl C1-C3 alkyl, aryl hoặc aryl C1-C3 alkyl, trong đó, the “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “heteroxcyclyl”, “heteroxcyclyl C1-C3 alkyl”, “aryl” và “aryl C1-C3 alkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất;

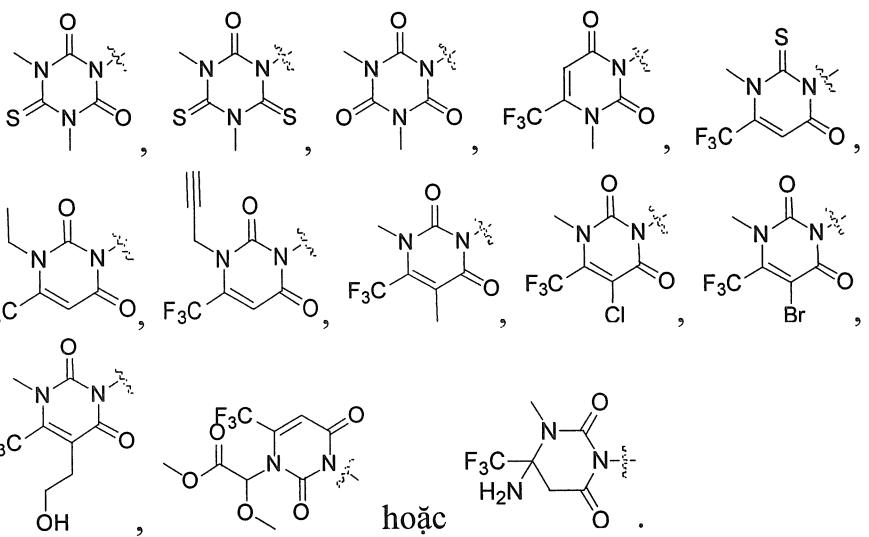
X₁₃, X₁₄ mỗi nhom độc lập là H, halogen, xyano, C1-C6 alkoxy, C1-C6 alkoxy C1-C3 alkyl, C1-C6 alkyl carbonyl, C1-C6 alkoxy carbonyl, C1-C6 alkylsulfonyl, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkylalkyl, C3-C6 xycloalkenyl, C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl, aryl, aryl C1-C3 alkyl, heteroxcyclyl hoặc heteroxcyclyl C1-C3 alkyl, hoặc C, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành carboxyclyl bao hòa

có 5~8 cạnh,  hoặc , hoặc N, X₁₃, X₁₄, cùng với nhau, tạo thành

, ,  hoặc  với nguyên tử nitơ ở vị trí 1, trong đó, “C1-C6 alkyl”, “C2-C6 alkenyl” và “C2-C6 alkynyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi halogen, “C3-C6 xycloalkyl”, “C3-C6 xycloalkyl C1-C3 alkyl”, “C3-C6 xycloalkenyl”, “C3-C6 xycloalkenyl C1-C3 alkyl”, “aryl”, “aryl C1-C3 alkyl”, “heteroxcyclyl” và “heteroxcyclyl C1-C3 alkyl” mỗi nhom độc lập không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhom được chọn từ oxo, halogen, xyano, nitro, C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C2-C6 alkynyl, C3-C6 xycloalkyl, halo C1-C6 alkyl, halo C2-C6 alkenyl, halo C2-C6 alkynyl, halo C3-C6 xycloalkyl, C3-C6 xycloalkyl được thê C1-C6 alkyl, -OR₁₃, -SR₁₃, -(CO)OR₁₃, -(SO₂)R₁₃, -N(R₁₃)₂ và -O-(C1-C3 alkyl)-(CO)OR₁₃, hoặc hai nguyên tử cacbon liền kề trên vòng cùng với -OCH₂CH₂- hoặc -OCH₂O- không được thê hoặc được thê halogen tạo thành một vòng hợp nhất, “carboxyclyl bao hòa có 5~8 cạnh,

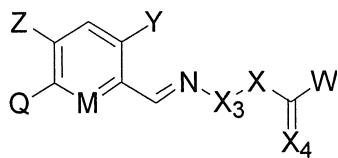
hoặc  không được thê hoặc được thê bởi 1, 2 hoặc 3 nhóm được chọn từ C1-C6 alkyl, C1-C6 alkoxy carbonyl và benzyl, hoặc cùng với phenyl hoặc thiienyl tạo thành một vòng hợp nhất, “, ,  và 

tốt hơn nữa, Q là

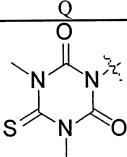
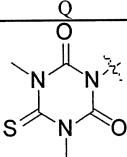
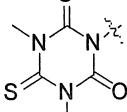


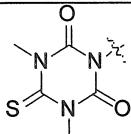
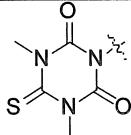
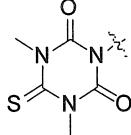
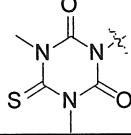
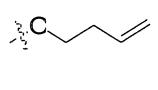
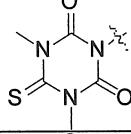
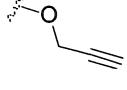
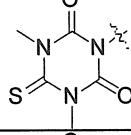
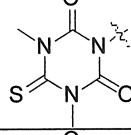
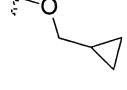
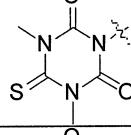
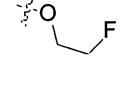
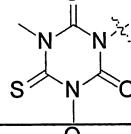
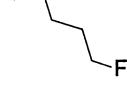
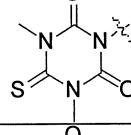
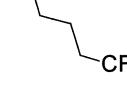
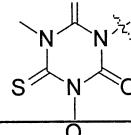
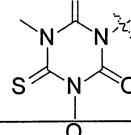
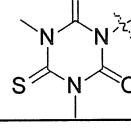
hoặc

6. Hợp chất iminoaryl được thê dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, khác biệt ở chỗ, khi nguyên tử cacbon liên kết với X₁ và X₂ trong công thức tổng quát là trung tâm chiral, nó là cấu hình R, và dựa trên hàm lượng của các đồng phân lập thể có cấu hình R và S ở vị trí này, nó có độ tinh khiết lập thể bằng 60-100% (R), tốt hơn là 70-100% (R), tốt hơn nữa là 80-100% (R), tốt hơn nữa là 90-100% (R), tốt hơn nữa là 95-100% (R); hoặc tốt hơn, nó là giá trị bất kỳ được chọn từ:



I

| NO. |  | X | X ₃ | X ₄ | W | Y | Z | M |
|-----|---|--------|----------------|----------------|-----|----|---|----|
| 1 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 2 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |

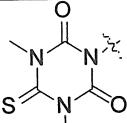
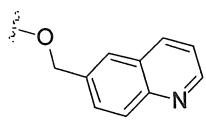
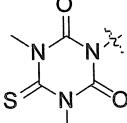
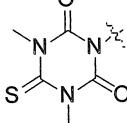
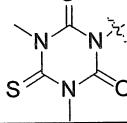
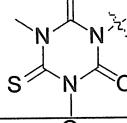
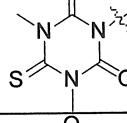
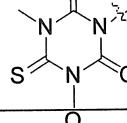
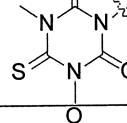
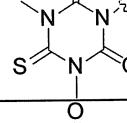
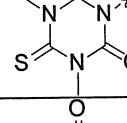
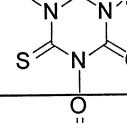
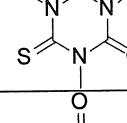
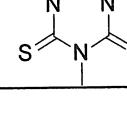
| | | | | | | | | |
|----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 3 |  | CH(Me) | O | S |  | Cl | F | CH |
| 4 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 5 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 6 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 7 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 8 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 9 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 10 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 11 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 12 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 13 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 14 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 15 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | |
|----|--|--------|--------|--|---------------|
| 16 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 17 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 18 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 19 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 20 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 21 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 22 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 23 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 24 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 25 | | CH(Me) | O S | | Cl F CH |
| 26 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 27 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 28 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |

| | | | | | | | | |
|----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 29 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 30 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 31 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 32 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 33 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 34 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 35 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 36 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 37 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 38 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 39 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 40 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 41 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

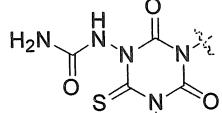
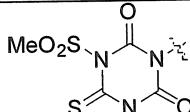
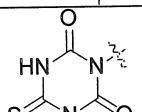
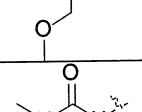
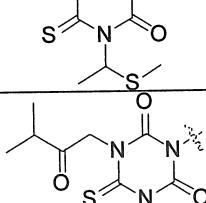
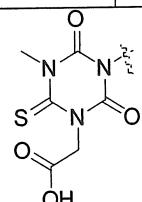
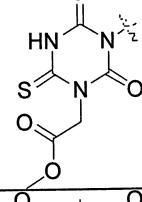
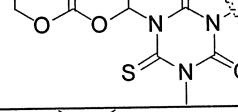
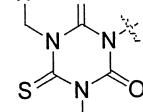
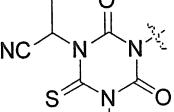
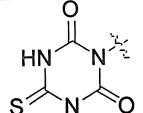
| | | | | | | | | |
|----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 42 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 43 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 44 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 45 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 46 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 47 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 48 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 49 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 50 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 51 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 52 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 53 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 54 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

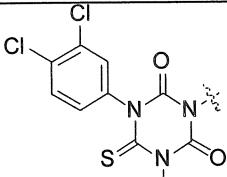
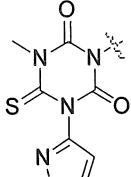
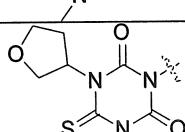
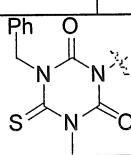
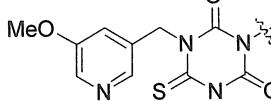
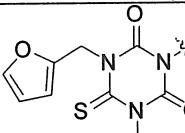
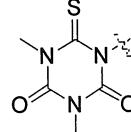
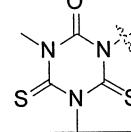
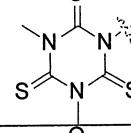
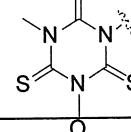
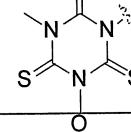
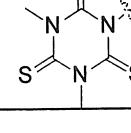
| | | | | | | | | |
|----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 55 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 56 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 57 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 58 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 59 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 60 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 61 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 62 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 63 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 64 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 65 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 66 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 67 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

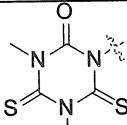
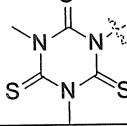
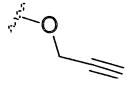
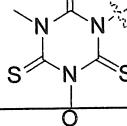
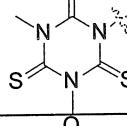
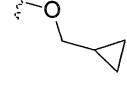
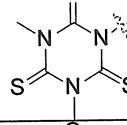
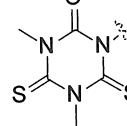
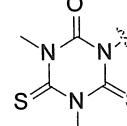
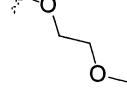
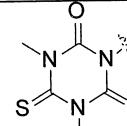
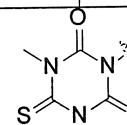
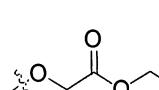
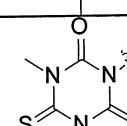
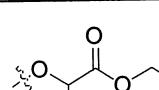
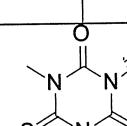
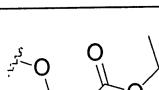
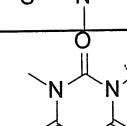
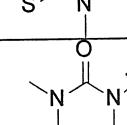
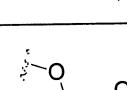
| | | | | | | | | |
|----|---|---|---|---|--|----|---|----|
| 68 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 69 |  | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 70 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 71 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 72 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 73 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 74 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 75 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 76 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 77 |  | CH(CF3) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 78 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 79 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 80 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |

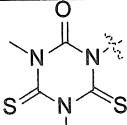
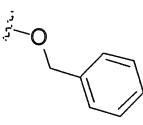
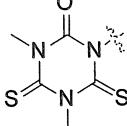
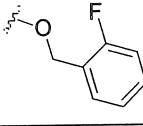
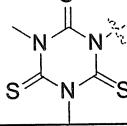
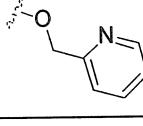
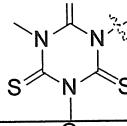
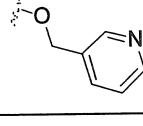
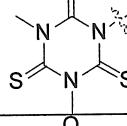
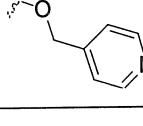
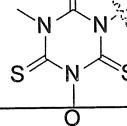
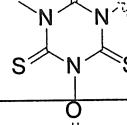
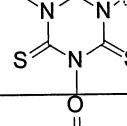
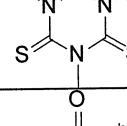
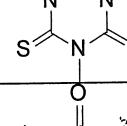
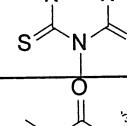
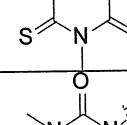
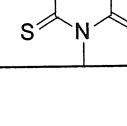
| | | | | | | | | |
|----|--|-----------|---|---|-----|-----------------|---|----|
| 81 | | CH(COOMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 82 | | CH(Ph) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 83 | | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | CH |
| 84 | | CH(Me) | O | O | OEt | Br | F | CH |
| 85 | | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | CH |
| 86 | | CH(Me) | O | O | OEt | CF ₃ | F | CH |
| 87 | | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | CH |
| 88 | | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | CH |
| 89 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 90 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 91 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 92 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 93 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |

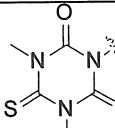
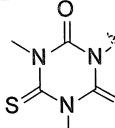
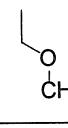
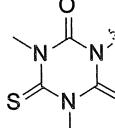
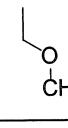
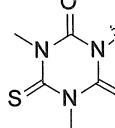
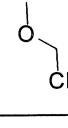
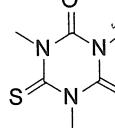
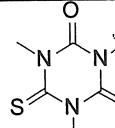
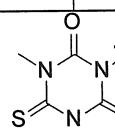
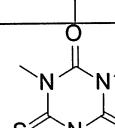
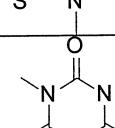
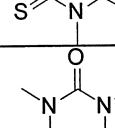
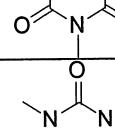
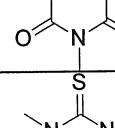
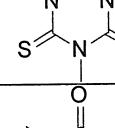
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|
| 94 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 95 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 96 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 97 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 98 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 99 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 100 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 101 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 102 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 103 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 104 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 105 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |

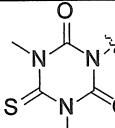
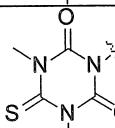
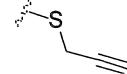
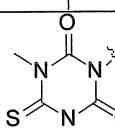
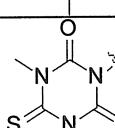
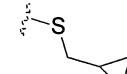
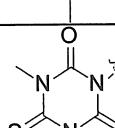
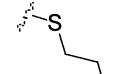
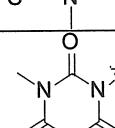
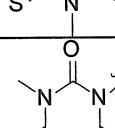
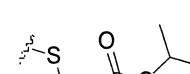
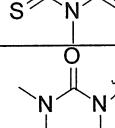
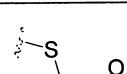
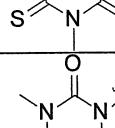
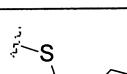
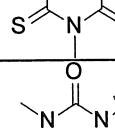
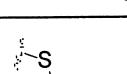
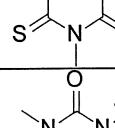
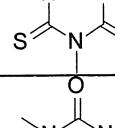
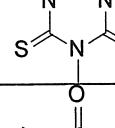
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|-----|----|---|----|
| 106 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 107 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 108 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 109 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 110 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 111 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 112 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 113 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 114 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 115 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 116 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |

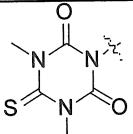
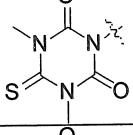
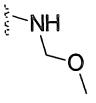
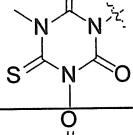
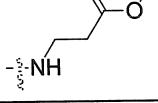
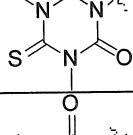
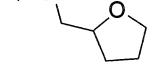
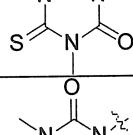
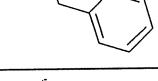
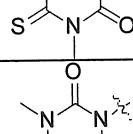
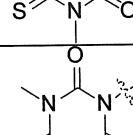
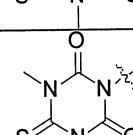
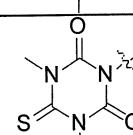
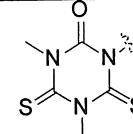
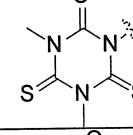
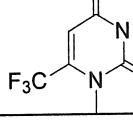
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 117 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 118 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 119 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 120 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 121 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 122 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 123 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 124 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 125 |  | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH |
| 126 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 127 |  | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH |
| 128 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 129 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 130 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 131 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 132 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 133 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 134 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 135 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 136 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 137 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 138 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 139 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 140 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 141 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 142 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 143 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 144 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 145 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 146 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 147 |  | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 148 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 149 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 150 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 151 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 152 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 153 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 154 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|-----|-----------------|---|----|
| 155 |  | CH(CF ₃) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 156 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 157 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 158 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 159 |  | CH(COOMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 160 |  | CH(Ph) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 161 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Br | F | CH |
| 162 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CF ₃ | F | CH |
| 163 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | CH |
| 164 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 165 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 166 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 167 |  | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 168 |  | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH |
| 169 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 170 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 171 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 172 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 173 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 174 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 175 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 176 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 177 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 178 |  | CH(Me) | O | O | SEt | CN | F | CH |
| 179 |  | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH |
| 180 |  | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH |

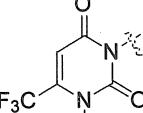
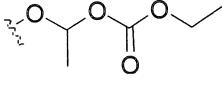
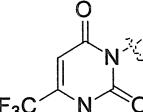
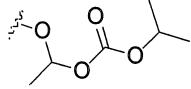
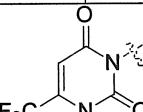
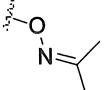
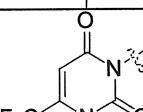
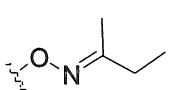
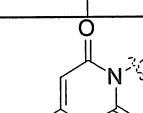
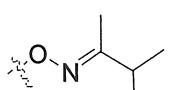
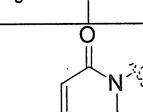
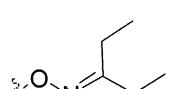
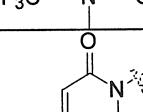
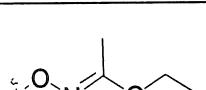
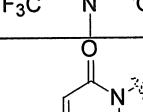
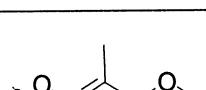
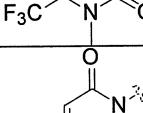
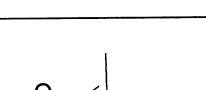
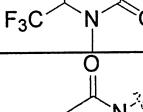
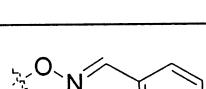
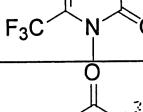
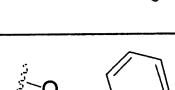
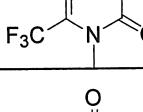
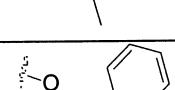
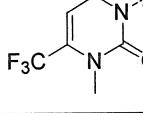
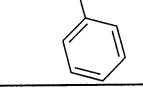
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------------------|---|---|---|----|---|----|
| 181 |  | CH(Me) | O | O | NHEt | Cl | F | CH |
| 182 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 183 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 184 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 185 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 186 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 187 |  | CH(Me) | O | O |  | CN | F | CH |
| 188 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 189 |  | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 190 |  | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 191 |  | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 192 |  | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 193 |  | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | CH |

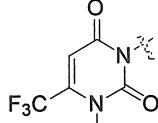
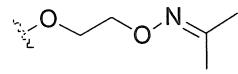
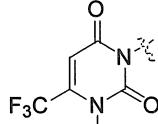
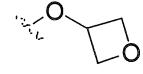
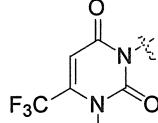
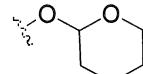
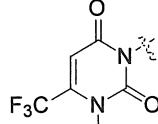
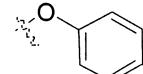
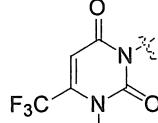
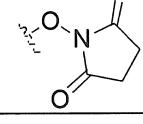
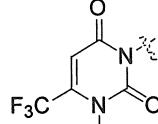
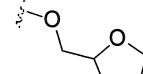
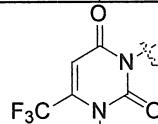
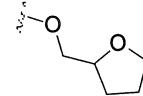
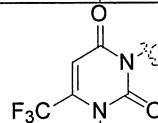
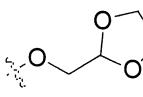
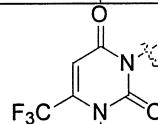
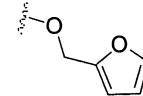
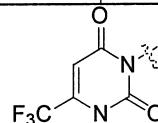
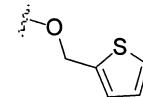
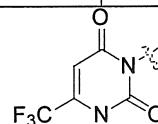
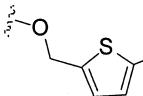
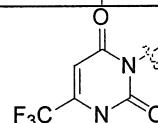
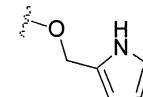
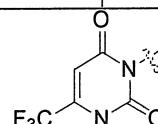
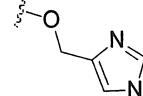
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|
| 194 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 195 | | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH |
| 196 | | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 197 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH |
| 198 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 199 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 200 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 201 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 202 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 203 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 204 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 205 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 206 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

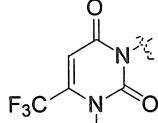
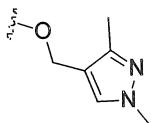
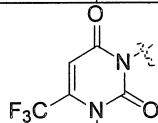
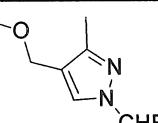
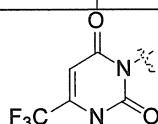
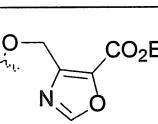
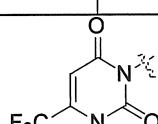
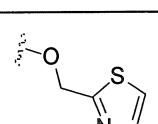
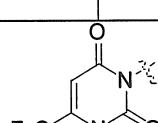
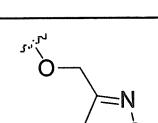
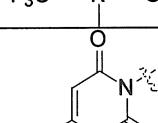
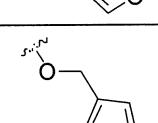
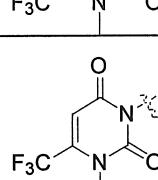
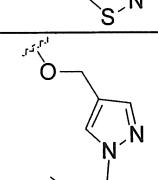
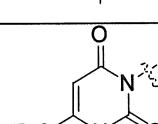
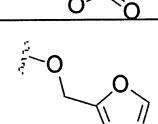
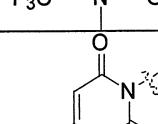
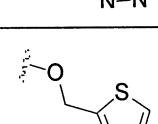
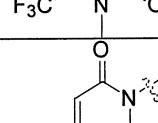
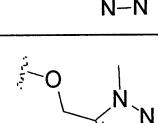
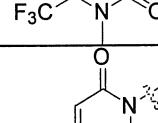
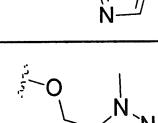
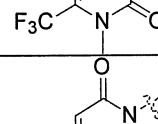
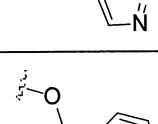
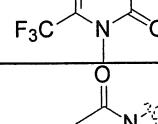
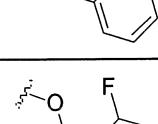
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 207 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 208 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 209 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 210 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 211 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 212 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 213 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 214 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 215 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 216 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 217 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 218 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 219 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

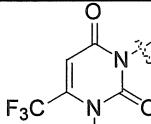
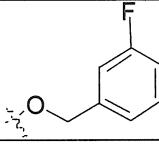
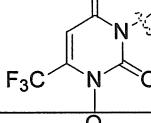
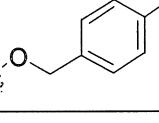
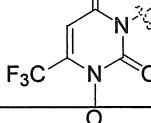
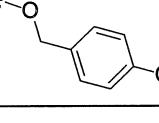
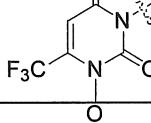
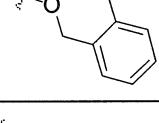
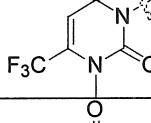
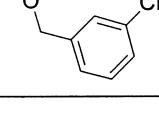
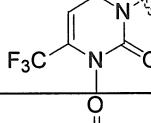
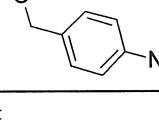
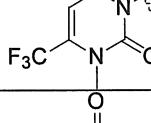
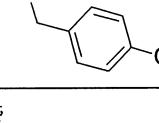
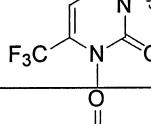
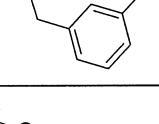
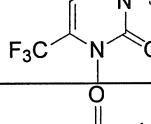
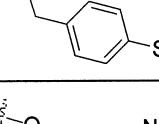
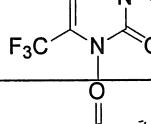
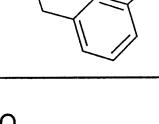
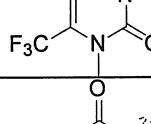
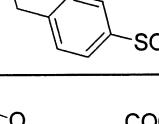
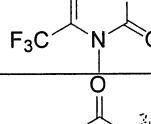
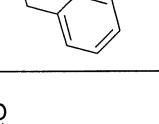
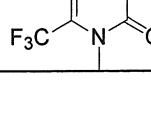
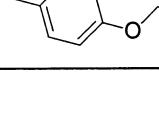
| | | | | | |
|-----|--|--------|--------|--|---------------|
| 220 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 221 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 222 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 223 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 224 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 225 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 226 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 227 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 228 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 229 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 230 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 231 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |
| 232 | | CH(Me) | O O | | Cl F CH |

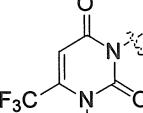
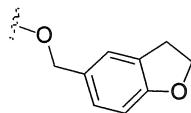
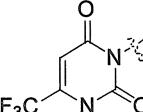
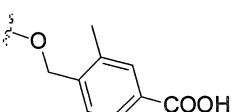
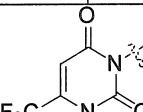
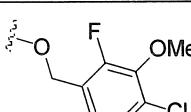
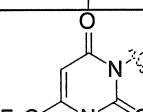
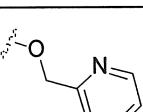
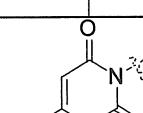
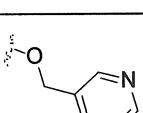
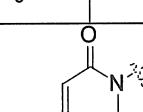
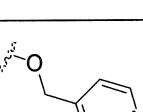
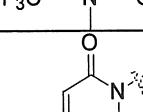
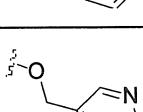
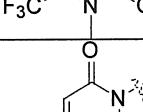
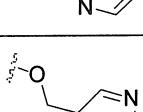
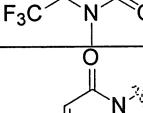
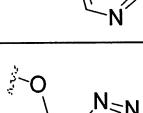
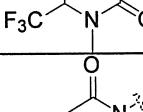
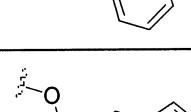
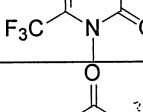
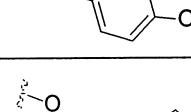
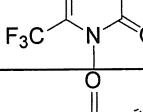
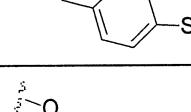
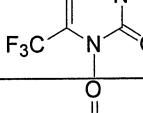
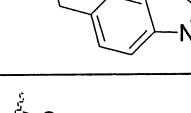
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 233 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 234 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 235 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 236 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 237 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 238 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 239 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 240 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 241 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 242 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 243 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 244 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 245 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

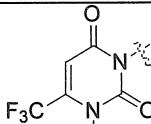
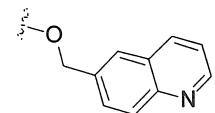
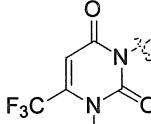
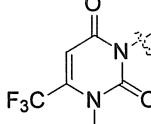
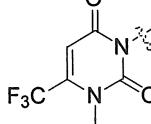
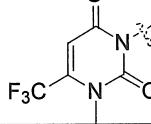
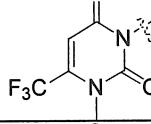
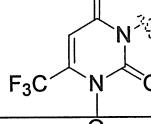
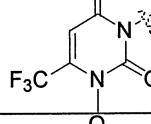
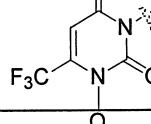
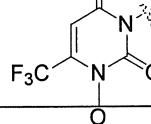
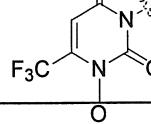
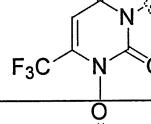
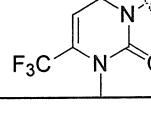
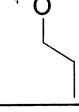
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 246 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 247 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 248 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 249 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 250 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 251 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 252 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 253 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 254 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 255 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 256 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 257 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 258 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

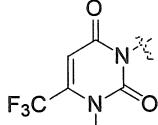
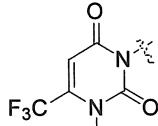
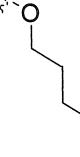
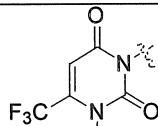
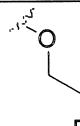
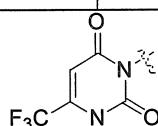
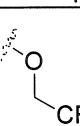
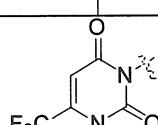
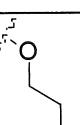
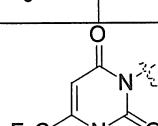
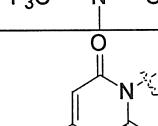
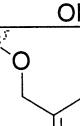
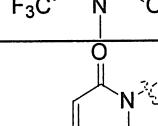
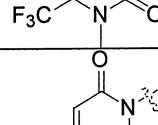
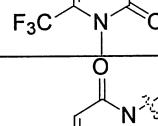
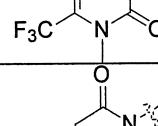
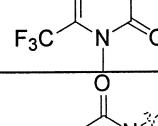
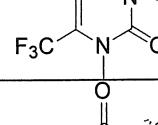
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 259 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 260 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 261 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 262 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 263 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 264 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 265 |  | CH(Me) | O | S |  | Cl | F | CH |
| 266 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 267 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 268 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 269 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 270 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 271 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

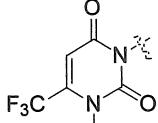
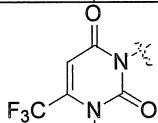
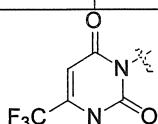
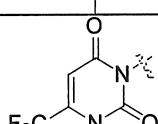
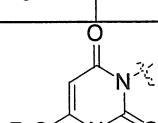
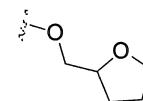
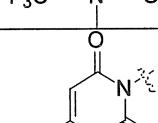
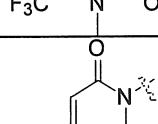
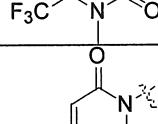
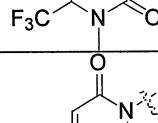
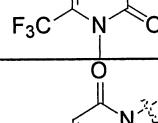
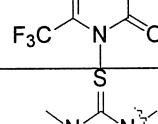
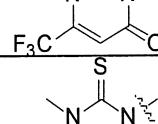
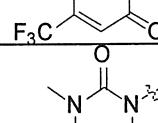
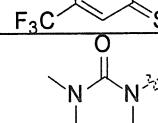
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 272 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 273 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 274 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 275 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 276 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 277 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 278 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 279 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 280 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 281 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 282 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 283 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 284 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

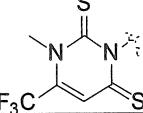
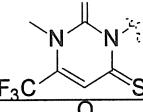
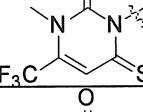
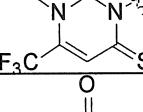
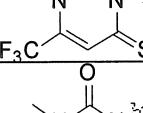
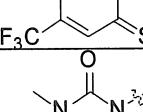
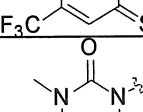
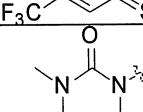
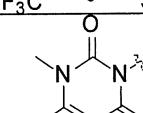
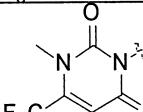
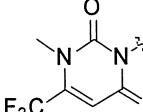
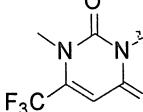
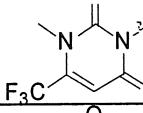
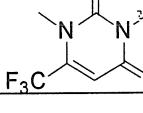
| | | | | | |
|-----|---|--------|--------|---|---------------|
| 285 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 286 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 287 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 288 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 289 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 290 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 291 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 292 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 293 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 294 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 295 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 296 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |
| 297 |  | CH(Me) | O O |  | Cl F CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 298 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 299 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 300 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 301 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 302 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 303 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 304 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 305 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 306 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 307 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 308 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 309 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 310 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

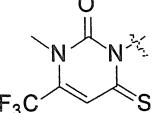
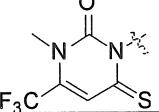
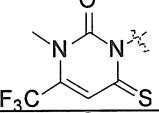
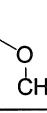
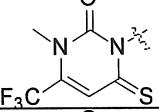
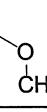
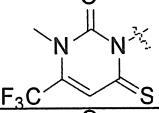
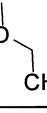
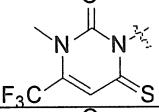
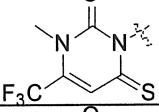
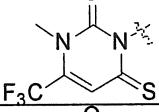
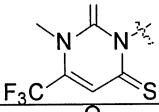
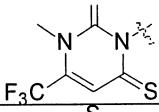
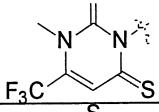
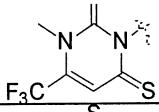
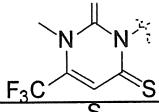
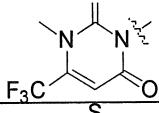
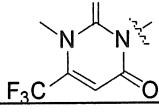
| | | | | | | | | |
|-----|---|----------------------|---|---|---|----|---|----|
| 311 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 312 |  | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 313 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 314 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 315 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 316 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 317 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 318 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 319 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 320 |  | CH(CF ₃) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 321 |  | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 322 |  | CH(OMe) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 323 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|----|
| 324 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 325 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 326 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 327 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 328 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 329 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 330 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 331 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 332 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 333 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 334 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 335 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 336 |  | CH(COOMe) | O | O | OMe | Cl | F | CH |

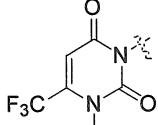
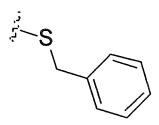
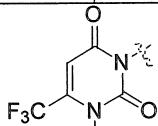
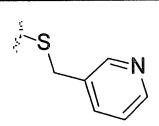
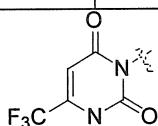
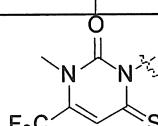
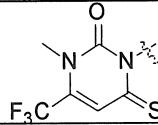
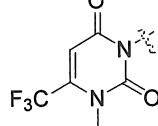
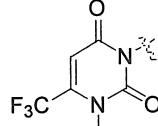
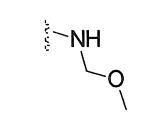
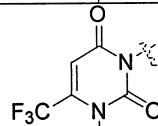
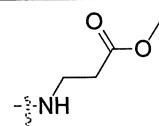
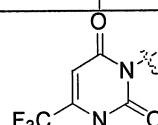
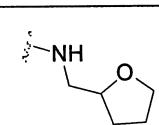
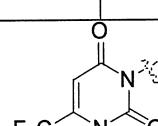
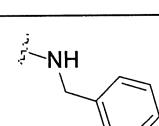
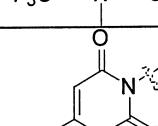
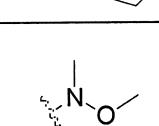
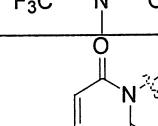
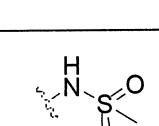
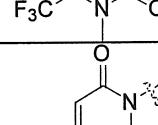
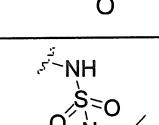
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|-----------------|---|----|
| 337 |  | CH(Ph) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 338 |  | CH(CN) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 339 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | CH |
| 340 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Br | F | CH |
| 341 |  | CH(Me) | O | O |  | Br | F | CH |
| 342 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | CH |
| 343 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CF ₃ | F | CH |
| 344 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | CH |
| 345 |  | CH(Me) | O | O | OEt | CN | F | CH |
| 346 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 347 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 348 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 349 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 350 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |

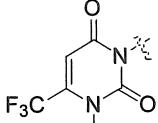
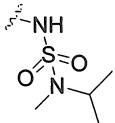
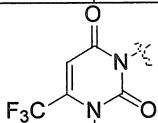
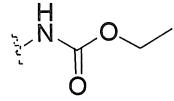
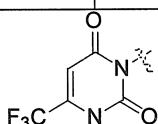
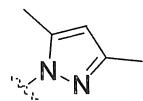
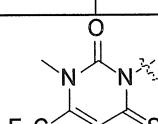
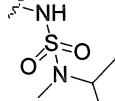
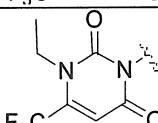
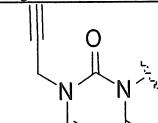
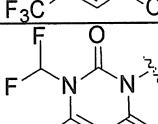
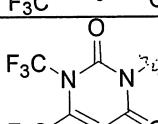
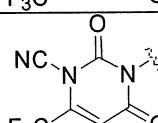
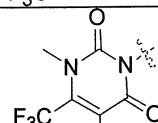
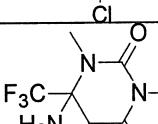
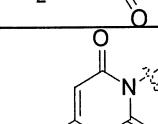
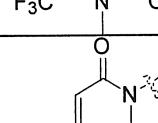
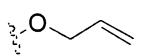
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 351 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 352 |  | CH(Me) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 353 |  | CH(Me) | O | S | OMe | Cl | F | CH |
| 354 |  | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | CH |
| 355 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 356 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 357 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 358 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 359 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 360 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 361 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 362 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 363 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 364 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 365 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|-----------------------------------|---|---|-----|----|---|----|
| 366 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 367 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 368 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 369 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 370 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 371 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 372 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 373 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 374 | | CH(F) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 375 | | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 376 | | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 377 | | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 378 | | CH(CH ₂) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 379 | | CH(CH ₂) ₂ | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 380 | | CH(CH ₂) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |

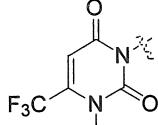
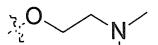
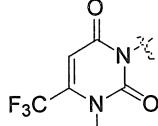
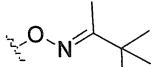
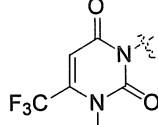
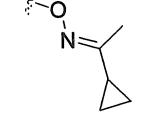
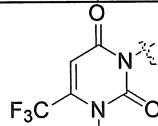
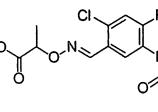
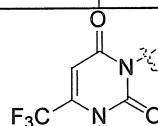
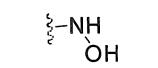
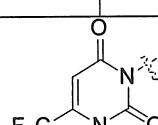
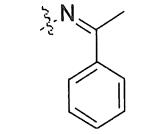
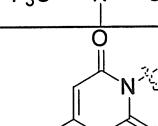
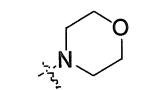
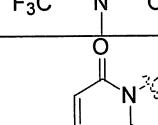
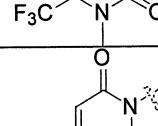
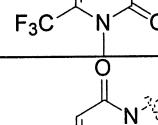
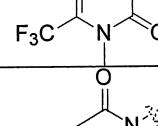
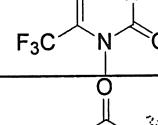
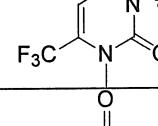
| | | | | | |
|-----|---|---|--------|-----|----------------------------|
| 381 |  |  | O O | OEt | Cl F CH |
| 382 |  |  | O O | OMe | Cl F CH |
| 383 |  |  | O O | OMe | Cl F CH |
| 384 |  |  | O O | OEt | Cl F CH |
| 385 |  |  | O O | OMe | Cl F CH |
| 386 |  |  | O O | OMe | Cl F CH |
| 387 |  |  | O O | OMe | Cl F CH |
| 388 |  |  | O O | OMe | Br F CH |
| 389 |  |  | O O | OMe | CF ₃ F CH |
| 390 |  |  | O O | OMe | CN F CH |
| 391 |  |  | O O | OMe | Br F CH |
| 392 |  |  | O O | OMe | CF ₃ F CH |
| 393 |  |  | O O | OMe | CN F CH |
| 394 |  |  | O O | OMe | Br F CH |
| 395 |  |  | O O | OMe | CF ₃ F CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|
| 396 | | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | CH |
| 397 | | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH |
| 398 | | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH |
| 399 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 400 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 401 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 402 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 403 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 404 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 405 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 406 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 407 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 408 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

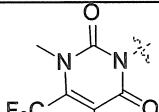
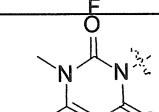
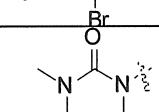
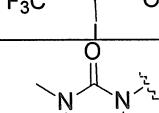
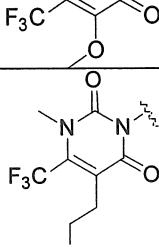
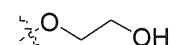
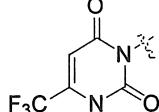
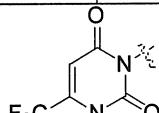
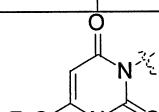
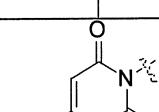
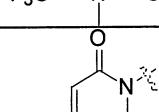
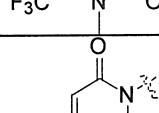
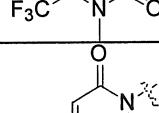
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 409 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 410 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 411 |  | CH(Me) | O | O | SEt | CN | F | CH |
| 412 |  | CH(Me) | O | O | SMe | Cl | F | CH |
| 413 |  | CH(Me) | O | O | SEt | Cl | F | CH |
| 414 |  | CH(Me) | O | O | NHEt | Cl | F | CH |
| 415 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 416 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 417 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 418 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 419 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 420 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 421 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |

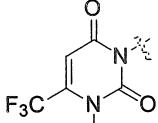
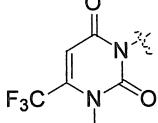
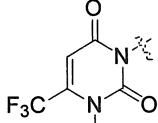
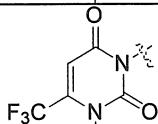
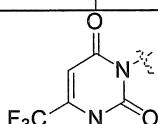
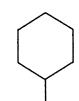
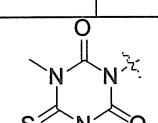
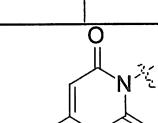
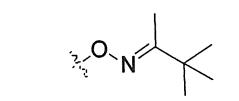
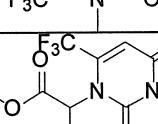
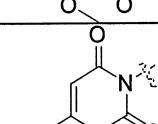
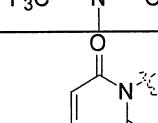
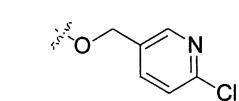
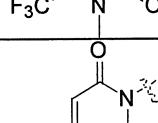
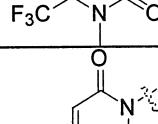
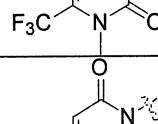
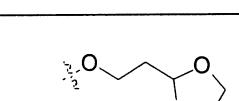
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 422 |  | CH(Me) | O | O |  | CN | F | CH |
| 423 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 424 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 425 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 426 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 427 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 428 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 429 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 430 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 431 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 432 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 433 |  | C(Me)2 | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 434 |  | C(Me)2 | O | O |  | Cl | F | CH |

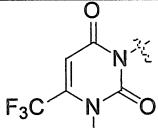
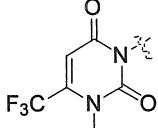
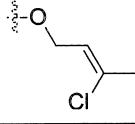
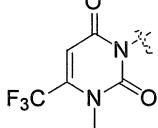
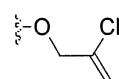
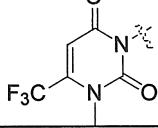
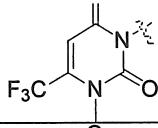
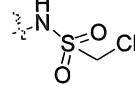
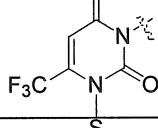
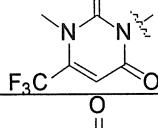
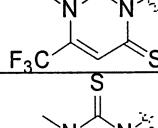
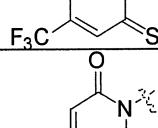
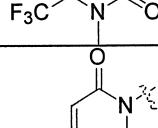
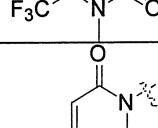
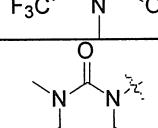
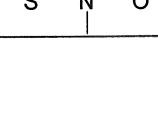
| | | | | | | | | |
|-----|--|---------------------------------|---|---|-----|----|---|----|
| 435 | | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 436 | | C(Me) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 437 | | C(F) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 438 | | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | CH |
| 439 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 440 | | CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 441 | | CH(Me)CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 442 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 443 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 444 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 445 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 446 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |
| 447 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|----|
| 448 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 449 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 450 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 451 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 452 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 453 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 454 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 455 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 456 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 457 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 458 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 459 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 460 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |

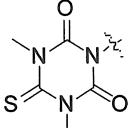
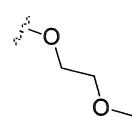
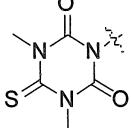
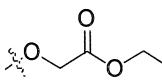
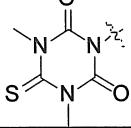
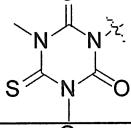
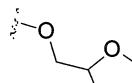
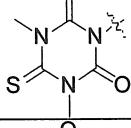
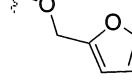
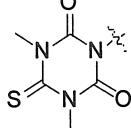
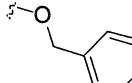
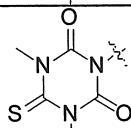
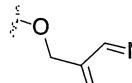
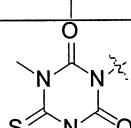
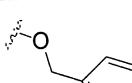
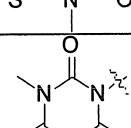
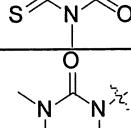
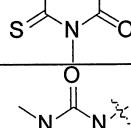
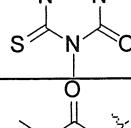
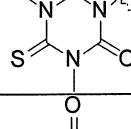
| | | | | | | | | |
|-----|--|-----------|---------|--------|-----|----|---|----|
| 461 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 462 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 463 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 464 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 465 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 466 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 467 | | CH(SMe) | O O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 468 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 469 | | | O CH | O O | OMe | Cl | F | CH |
| 470 | | C(F)2 | O O | OEt | | Cl | F | CH |
| 471 | | C(Me)(Et) | O O | OMe | | Cl | F | CH |
| 472 | | | O O | OMe | | Cl | F | CH |
| 473 | | CH(Me) | O O | OMe | | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|----|
| 474 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 475 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 476 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 477 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 478 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 479 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 480 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 481 |  | CH(Me)CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 482 |  | CH ₂ CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 483 |  | CH(Me)CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 484 |  | CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 485 |  | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | CH |

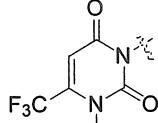
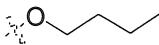
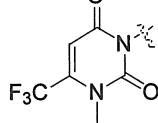
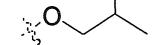
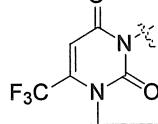
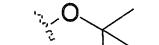
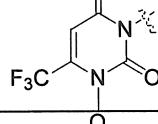
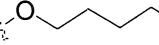
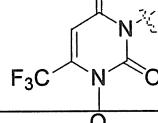
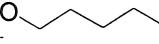
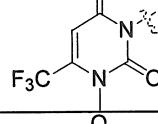
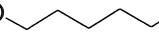
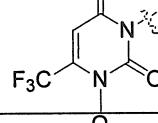
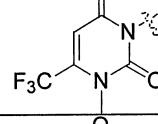
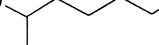
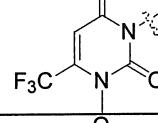
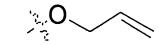
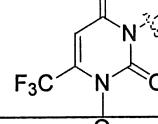
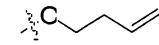
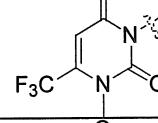
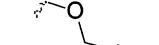
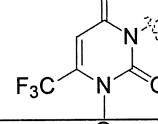
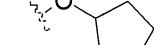
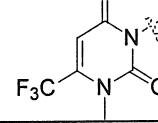
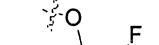
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|--|----|---|----|
| 486 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | CH |
| 487 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 488 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 489 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 490 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 491 |  |  | O | O | SEt | Cl | F | CH |
| 492 |  |  | O | O |  | Cl | F | CH |
| 493 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 494 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 495 |  |  | O | O |  | Cl | F | CH |
| 496 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 497 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | CH |
| 498 |  |  | O | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|-----------------|---|----|
| 499 |  | CH(Me) | O | O | NH ₂ | Cl | F | CH |
| 500 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 501 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 502 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 503 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | CH |
| 504 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 505 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 506 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 507 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 508 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N |
| 509 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF ₃ | F | N |
| 510 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N |
| 511 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |

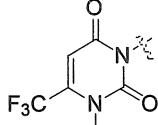
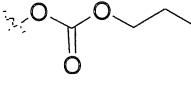
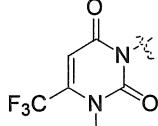
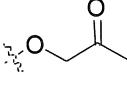
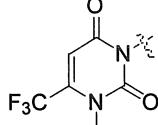
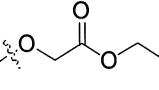
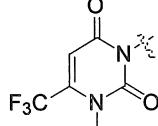
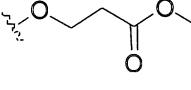
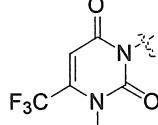
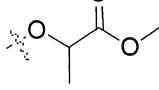
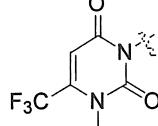
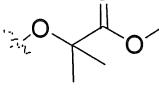
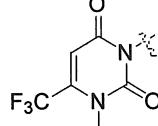
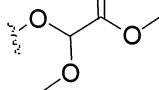
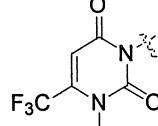
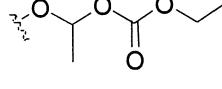
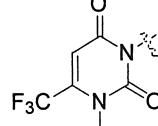
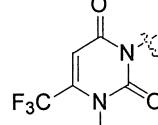
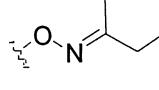
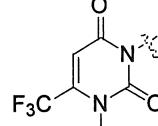
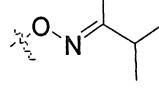
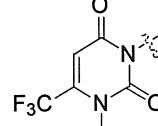
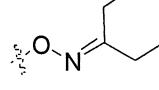
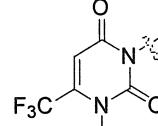
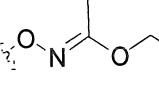
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|-----|---|---|
| 512 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 513 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 514 | | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N |
| 515 | | CH(Me) | O | O | OMe | CF3 | F | N |
| 516 | | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N |
| 517 | | CH(Me) | O | S | OEt | Cl | F | N |
| 518 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 519 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 520 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 521 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 522 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 523 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 524 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |

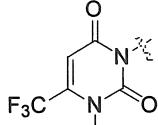
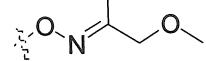
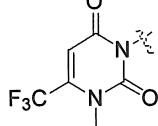
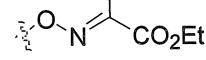
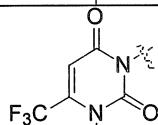
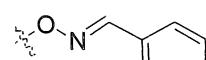
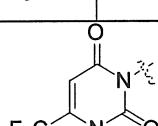
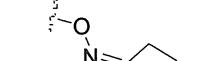
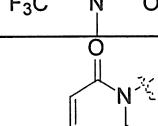
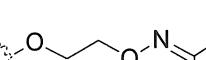
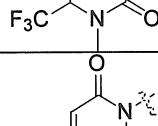
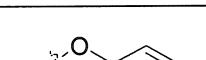
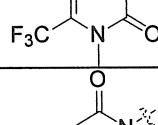
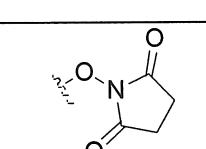
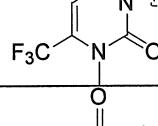
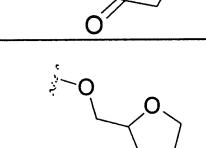
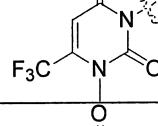
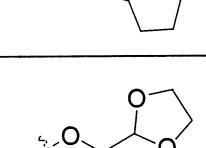
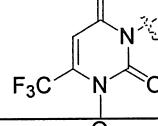
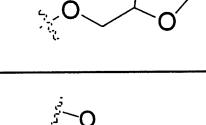
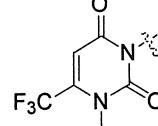
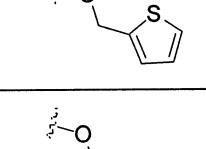
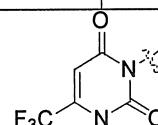
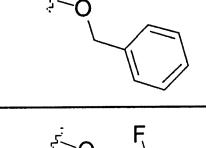
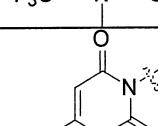
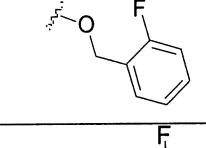
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|---|
| 525 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 526 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 527 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 528 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 529 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 530 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 531 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 532 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 533 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 534 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 535 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 536 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 537 |  |  | O | O | OEt | Cl | F | N |

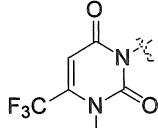
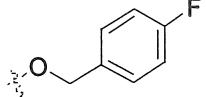
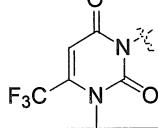
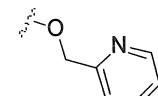
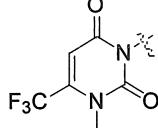
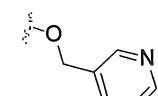
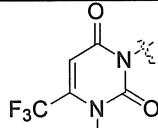
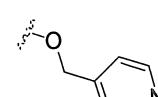
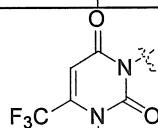
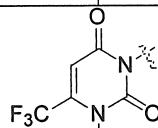
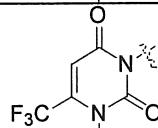
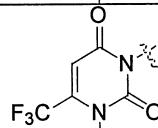
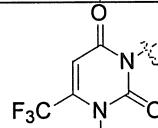
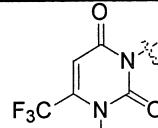
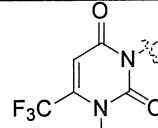
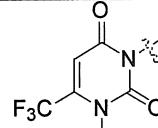
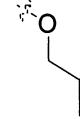
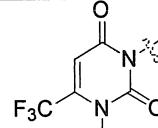
| | | | | | | | | |
|-----|--|--|---|---|-----|-----|---|---|
| 538 | | | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 539 | | | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 540 | | | O | O | OEt | Br | F | N |
| 541 | | | O | O | OEt | CF3 | F | N |
| 542 | | | O | O | OEt | CN | F | N |
| 543 | | | O | O | OEt | Br | F | N |
| 544 | | | O | O | SEt | Cl | F | N |
| 545 | | | O | O | | Cl | F | N |
| 546 | | | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 547 | | | O | O | OH | Cl | F | N |
| 548 | | | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 549 | | | O | O | | Cl | F | N |
| 550 | | | O | O | | Cl | F | N |

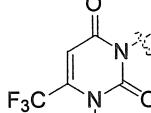
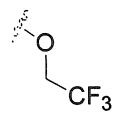
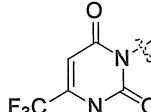
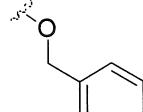
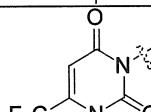
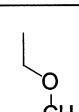
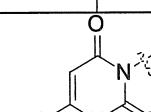
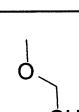
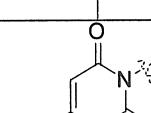
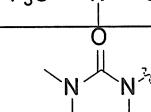
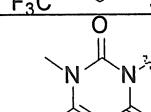
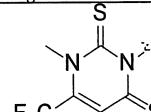
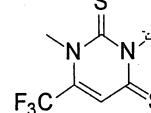
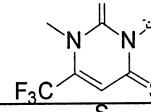
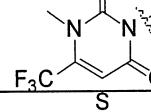
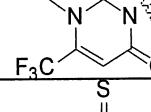
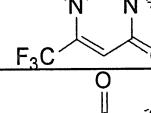
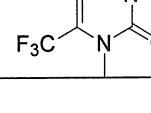
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|---|
| 551 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 552 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 553 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 554 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 555 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 556 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 557 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 558 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 559 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 560 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 561 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 562 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 563 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|---|
| 564 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 565 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 566 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 567 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 568 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 569 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 570 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 571 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 572 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 573 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 574 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 575 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 576 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |

| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|---|
| 577 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 578 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 579 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 580 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 581 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 582 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 583 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 584 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 585 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 586 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 587 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 588 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 589 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |

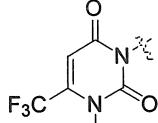
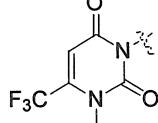
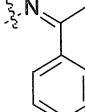
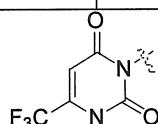
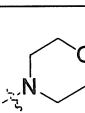
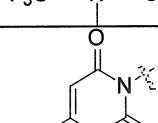
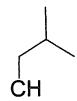
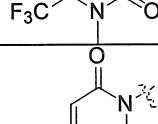
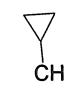
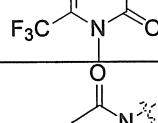
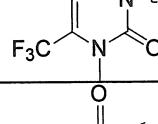
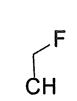
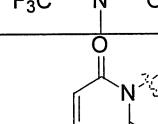
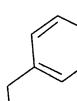
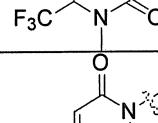
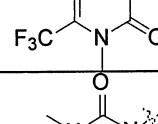
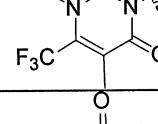
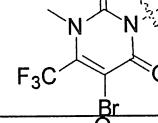
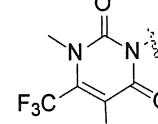
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|---|
| 590 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 591 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 592 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 593 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 594 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 595 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 596 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 597 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 598 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 599 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 600 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 601 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 602 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |

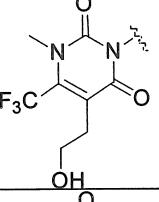
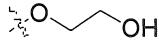
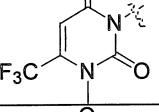
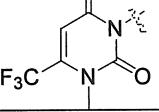
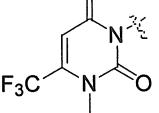
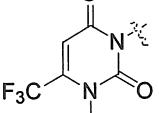
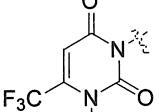
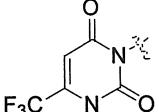
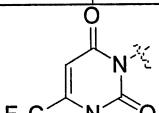
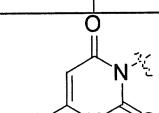
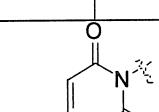
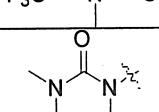
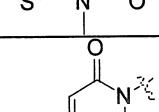
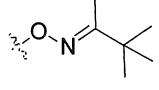
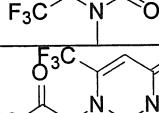
| | | | | | | | | |
|-----|---|---------|---|---|---|----|---|---|
| 603 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 604 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 605 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 606 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 607 |  | CH(F) | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 608 |  | CH(Et) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 609 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 610 |  | CH | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 611 |  | CH | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 612 |  | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 613 |  | CH(OMe) | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 614 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N |
| 615 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N |

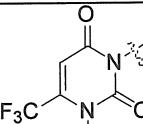
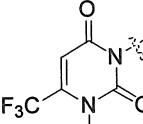
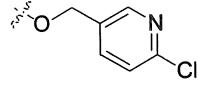
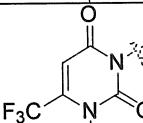
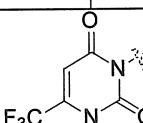
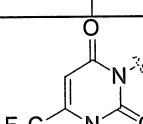
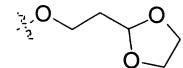
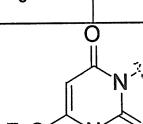
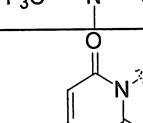
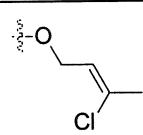
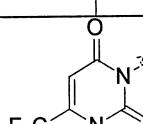
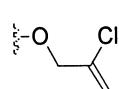
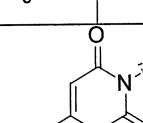
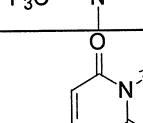
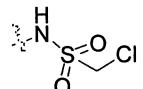
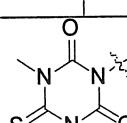
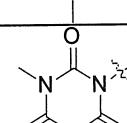
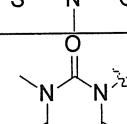
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|-----|---|---|
| 616 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N |
| 617 |  | CH(OMe) | O | O |  | Cl | F | N |
| 618 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 619 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 620 |  | CH(Ph) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 621 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N |
| 622 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N |
| 623 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N |
| 624 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF3 | F | N |
| 625 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N |
| 626 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Br | F | N |
| 627 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CF3 | F | N |
| 628 |  | CH(Me) | O | O | OMe | CN | F | N |
| 629 |  | CH(Me) | O | O | SET | Cl | F | N |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|---|
| 630 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 631 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 632 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 633 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 634 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 635 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 636 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 637 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 638 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 639 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 640 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 641 | | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 642 | | C(Me)2 | O | O | OMe | Cl | F | N |

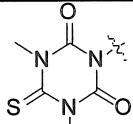
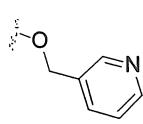
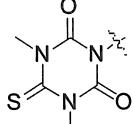
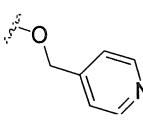
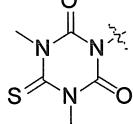
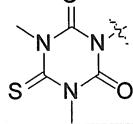
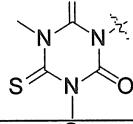
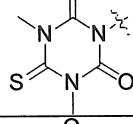
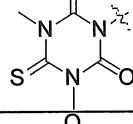
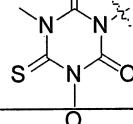
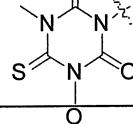
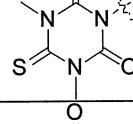
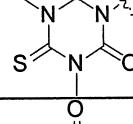
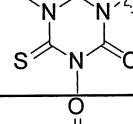
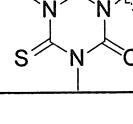
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------------------|---|---|----|----|---|---|
| 643 | | C(Me) ₂ | O | O | | Cl | F | N |
| 644 | | CH(Me) | O | O | OH | Cl | F | N |
| 645 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 646 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 647 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 648 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 649 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 650 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 651 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 652 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 653 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 654 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |
| 655 | | CH(Me) | O | O | | Cl | F | N |

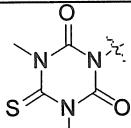
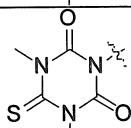
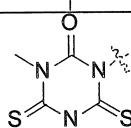
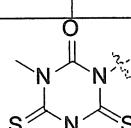
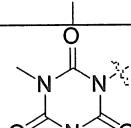
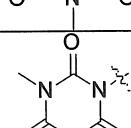
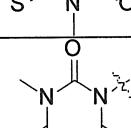
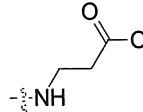
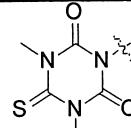
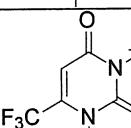
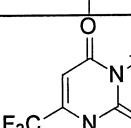
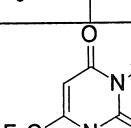
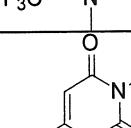
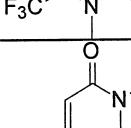
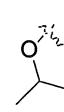
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|---|
| 656 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 657 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 658 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 659 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 660 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 661 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 662 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 663 |  |  | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 664 |  | C(Me)(Et) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 665 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 666 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 667 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 668 |  | CH(Me) | O | O | OMe | Cl | F | N |

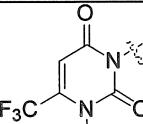
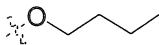
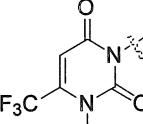
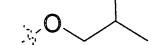
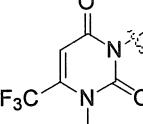
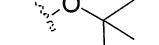
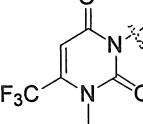
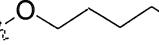
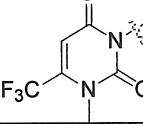
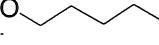
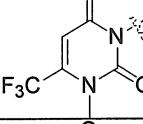
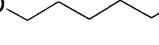
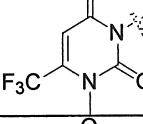
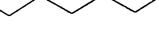
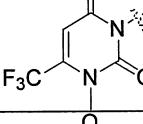
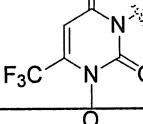
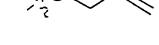
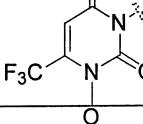
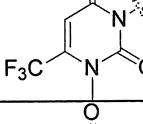
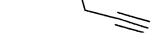
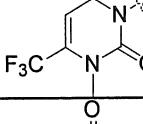
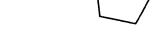
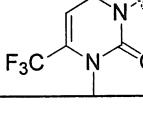
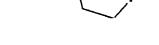
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|---|
| 669 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 670 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 671 |  | CH ₂ CH ₂ | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 672 |  | CH(Me)CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 673 |  | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 674 |  | CH(CF ₃) ₂ | O | O | OEt | Cl | F | N |
| 675 |  | CH=CH ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 676 |  | CH(CH ₂ CH ₂) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 677 |  | CH(CH ₂ CH ₂ CH ₂) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 678 |  | CH(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 679 |  | CH(Me) | O | O | SET | Cl | F | N |
| 680 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 681 |  | CH(OMe) | O | O | OMe | Cl | F | N |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---------------------|---|---|---|----|---|----|
| 682 |  | C(OMe) ₂ | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 683 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 684 |  | CH(OH) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 685 |  | CH(Cl) | O | O | OMe | Cl | F | N |
| 686 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 687 |  | CH(Me) | O | O | NH ₂ | Cl | F | N |
| 688 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 689 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 690 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 691 |  | CH(Me) | O | O |  | Cl | F | N |
| 692 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 693 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 694 |  | CH(Me) | S | S | OEt | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 695 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 696 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 697 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 698 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 699 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 700 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 701 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 702 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 703 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 704 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 705 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 706 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 707 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |

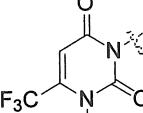
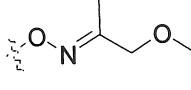
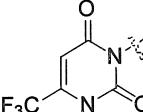
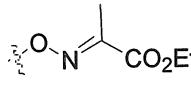
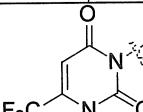
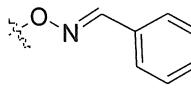
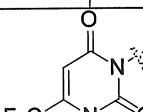
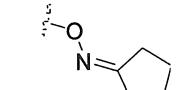
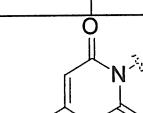
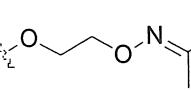
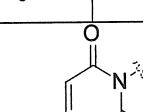
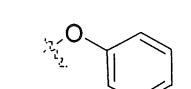
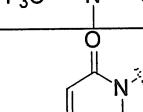
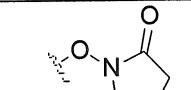
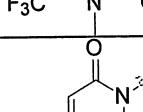
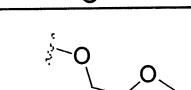
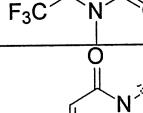
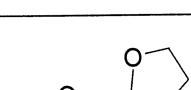
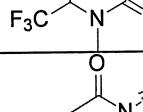
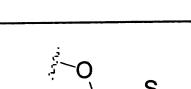
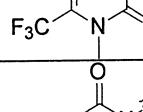
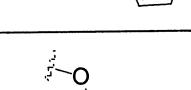
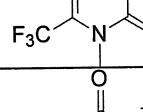
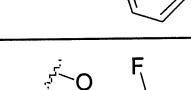
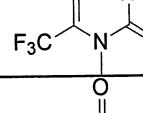
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|-----|---|----|
| 708 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 709 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 710 |  | CH(F) | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 711 |  | CH(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 712 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 713 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 714 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 715 |  | CH | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 716 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 717 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Br | F | CH |
| 718 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Br | F | CH |
| 719 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 720 |  | CH(Me) | S | O | OEt | CF3 | F | CH |

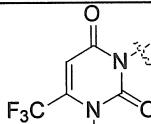
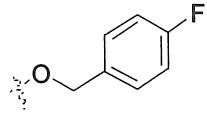
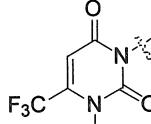
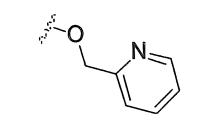
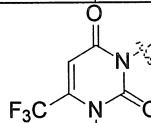
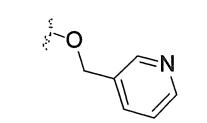
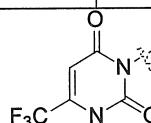
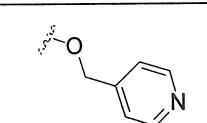
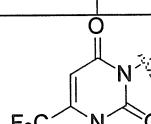
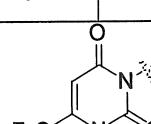
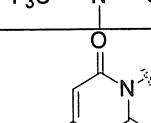
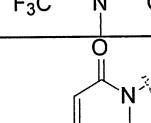
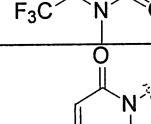
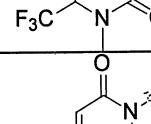
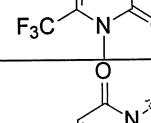
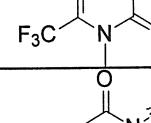
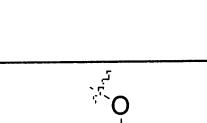
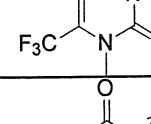
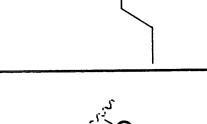
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------------------|---|---|---|----|---|----|
| 721 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH |
| 722 |  | CH(Me) | S | O | OEt | CN | F | CH |
| 723 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 724 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Br | F | CH |
| 725 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 726 |  | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH |
| 727 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 728 |  | C(Me) ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 729 |  | CH(Me) | S | O | OH | Cl | F | CH |
| 730 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 731 |  | CH(Me) | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 732 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 733 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |

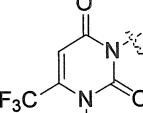
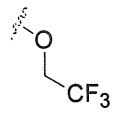
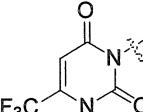
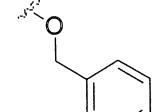
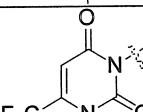
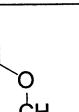
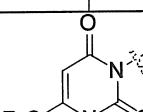
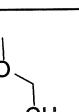
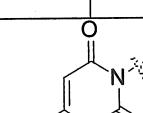
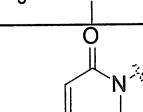
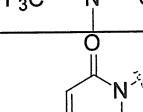
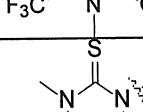
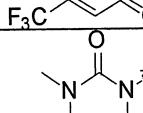
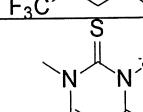
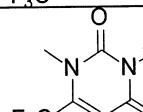
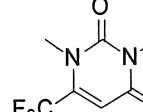
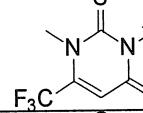
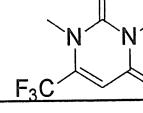
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|---|----|---|----|
| 734 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 735 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 736 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 737 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 738 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 739 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 740 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 741 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 742 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 743 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 744 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 745 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 746 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 747 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 748 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 749 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 750 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 751 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 752 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 753 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 754 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 755 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 756 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 757 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 758 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 759 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|--|----|---|----|
| 760 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 761 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 762 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 763 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 764 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 765 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 766 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 767 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 768 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 769 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 770 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 771 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 772 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |

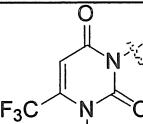
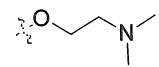
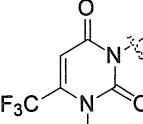
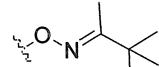
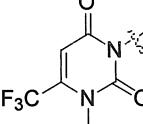
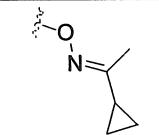
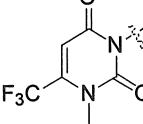
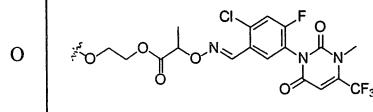
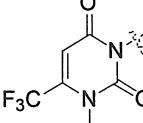
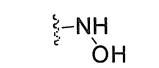
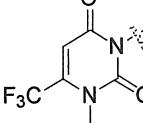
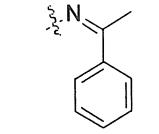
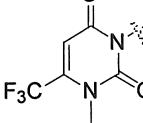
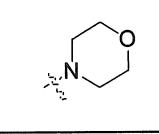
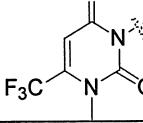
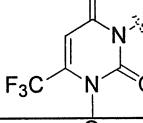
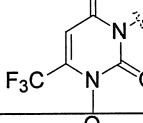
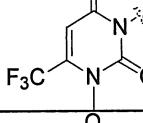
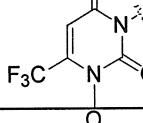
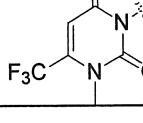
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|---|---|--|----|---|----|
| 773 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 774 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 775 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 776 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 777 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 778 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 779 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 780 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 781 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 782 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 783 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 784 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 785 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |

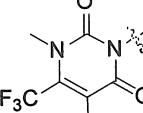
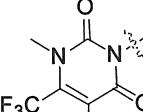
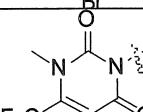
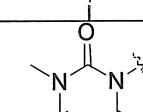
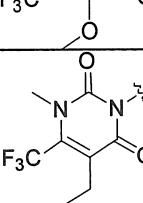
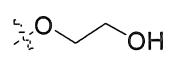
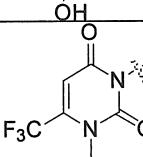
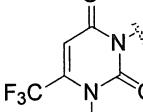
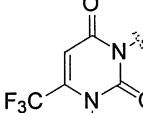
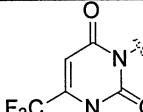
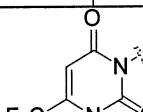
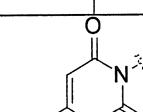
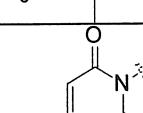
| | | | | | | | | |
|-----|---|-------------------------------------|---|---|--|----|---|----|
| 786 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 787 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 788 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 789 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 790 |  | CH(F) | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 791 |  | CH(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 792 |  | CH C ₂ H ₅ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 793 |  | CH C ₃ H ₇ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 794 |  | CH C ₃ H ₅ | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 795 |  | CH(OMe) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 796 |  | CH(OMe) | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 797 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 798 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH |

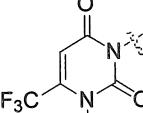
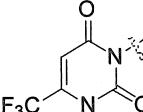
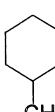
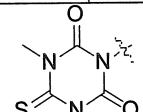
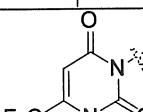
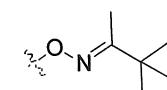
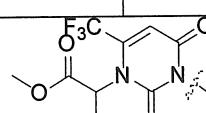
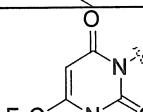
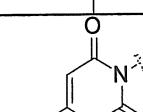
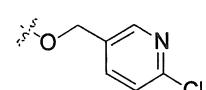
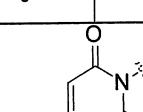
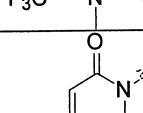
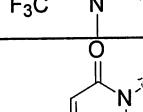
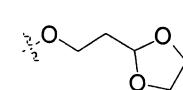
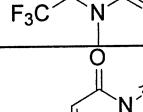
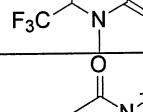
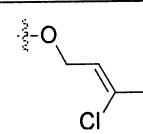
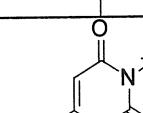
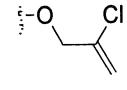
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|-----|---|----|
| 799 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 800 |  | CH(OMe) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 801 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 802 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 803 |  | CH(Ph) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 804 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 805 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH |
| 806 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 807 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 808 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 809 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Br | F | CH |
| 810 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH |
| 811 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Br | F | CH |
| 812 |  | CH(Me) | S | O | OMe | CF3 | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|-----|---|----|
| 813 | | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH |
| 814 | | CH(Me) | S | O | OMe | Br | F | CH |
| 815 | | CH(Me) | S | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 816 | | CH(Me) | S | O | OMe | CN | F | CH |
| 817 | | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH |
| 818 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 819 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 820 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 821 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 822 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 823 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 824 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 825 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 826 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |

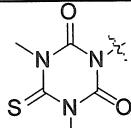
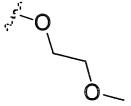
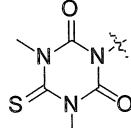
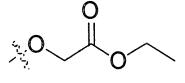
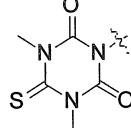
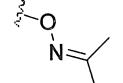
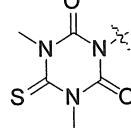
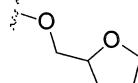
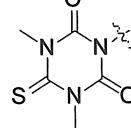
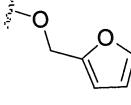
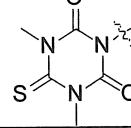
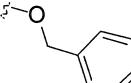
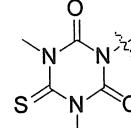
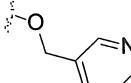
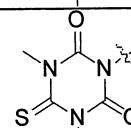
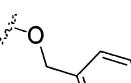
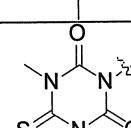
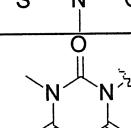
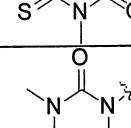
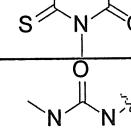
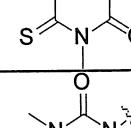
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|---|---|-----|----|---|----|
| 827 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 828 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 829 | | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 830 | | C(Me)2 | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 831 | | C(Me)2 | S | O | | Cl | F | CH |
| 832 | | CH(Me) | S | O | OH | Cl | F | CH |
| 833 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 834 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 835 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 836 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 837 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 838 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 839 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |

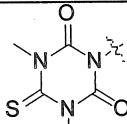
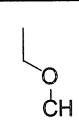
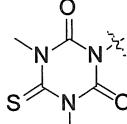
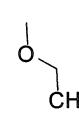
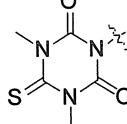
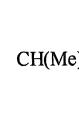
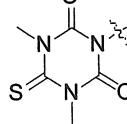
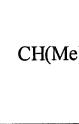
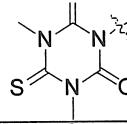
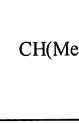
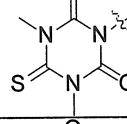
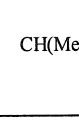
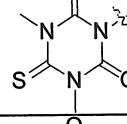
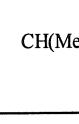
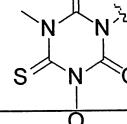
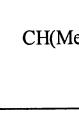
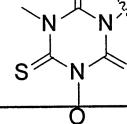
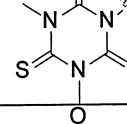
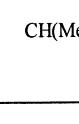
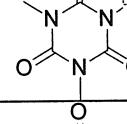
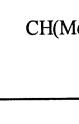
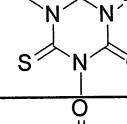
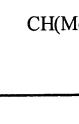
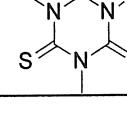
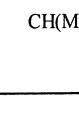
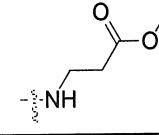
| | | | | | | | | |
|-----|---|-----------|---|---|---|----|---|----|
| 840 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 841 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 842 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 843 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 844 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 845 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 846 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 847 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 848 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 849 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 850 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 851 |  | CH | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 852 |  | C(Me)(Et) | S | O | OMe | Cl | F | CH |

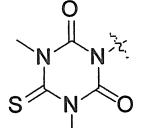
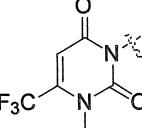
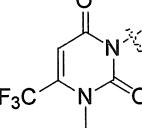
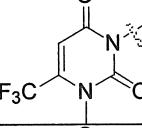
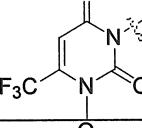
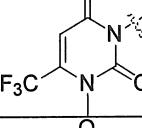
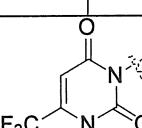
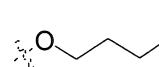
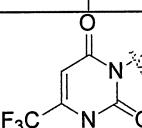
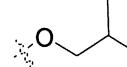
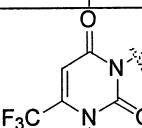
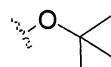
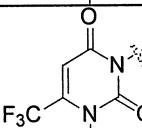
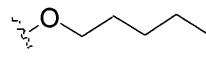
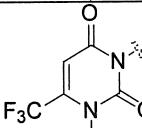
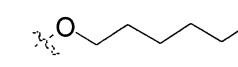
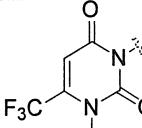
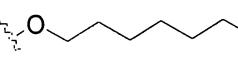
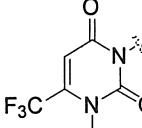
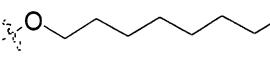
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|----|
| 853 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 854 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 855 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 856 |  | CH(Me) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 857 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 858 |  | CH ₂ CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 859 |  | CH ₂ CH ₂ | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 860 |  | CH(Me)CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 861 |  | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 862 |  | CH  | S | O | OEt | Cl | F | CH |
| 863 |  | CH  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 864 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|---|---|---|----|---|----|
| 865 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 866 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 867 |  | CH(Me) | S | O | SEt | Cl | F | CH |
| 868 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 869 |  | CH(OMe) | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 870 |  | C(OMe) ₂ | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 871 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 872 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 873 |  |  | S | O | OMe | Cl | F | CH |
| 874 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 875 |  | CH(Me) | S | O | NH ₂ | Cl | F | CH |
| 876 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |
| 877 |  | CH(Me) | S | O |  | Cl | F | CH |

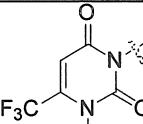
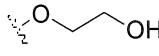
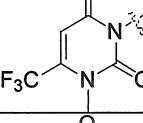
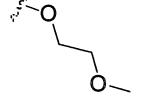
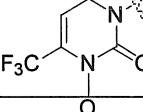
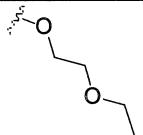
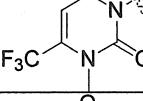
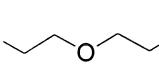
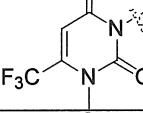
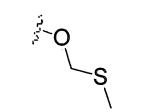
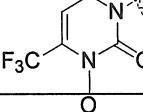
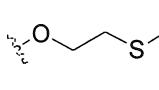
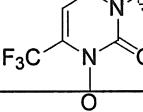
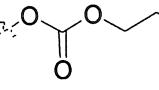
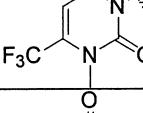
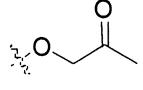
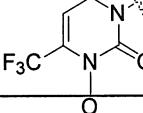
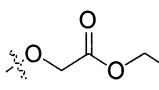
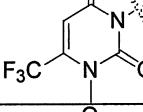
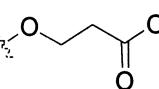
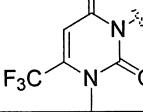
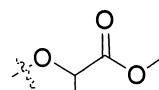
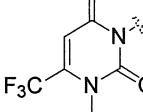
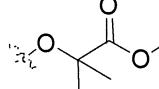
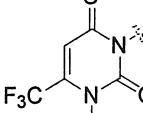
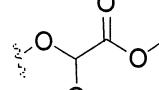
| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|------|---|--|----|---|----|
| 878 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 879 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | CH |
| 880 | | CH(Me) | S | O | | Cl | F | N |
| 881 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 882 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 883 | | CH(Me) | NH | S | | Cl | F | CH |
| 884 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 885 | | CH(Me) | N Me | O | | Cl | F | CH |
| 886 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 887 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 888 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 889 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 890 | | CH(Me) | N Me | O | | Cl | F | CH |

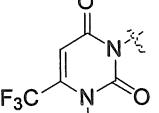
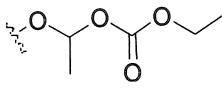
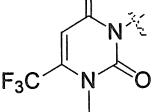
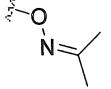
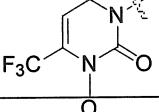
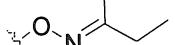
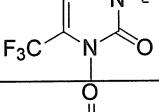
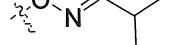
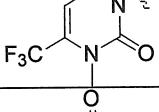
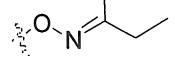
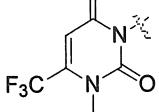
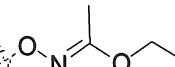
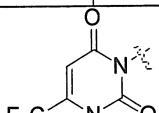
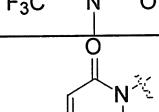
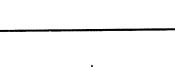
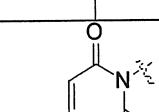
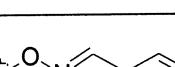
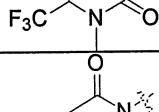
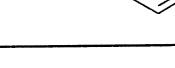
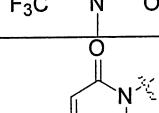
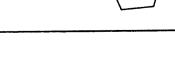
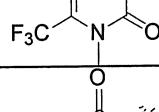
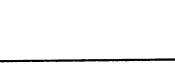
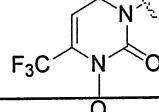
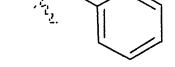
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|-----|---|---|----|---|----|
| 891 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 892 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 893 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 894 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 895 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 896 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 897 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 898 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 899 |  | CH(F) | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 900 |  | CH(Et) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 901 |  | CH | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 902 |  | CH | NEt | O | OMe | Cl | F | CH |
| 903 |  | CH | NH | O | OEt | Cl | F | CH |

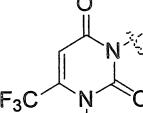
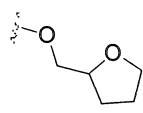
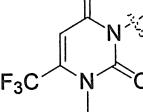
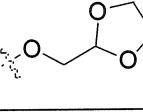
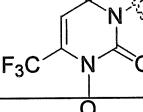
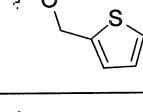
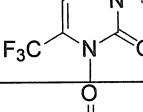
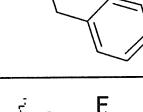
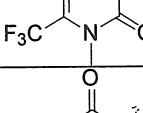
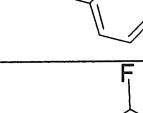
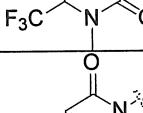
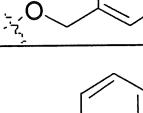
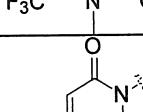
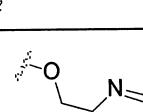
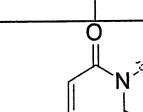
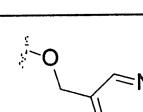
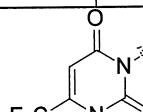
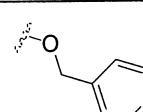
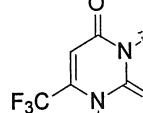
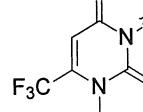
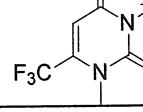
| | | | | | | | | |
|-----|---|---|----|---|---|-----|---|----|
| 904 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 905 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 906 |  |  | NH | O | OMe | Br | F | CH |
| 907 |  |  | NH | O | OEt | Br | F | CH |
| 908 |  |  | NH | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 909 |  |  | NH | O | OEt | CF3 | F | CH |
| 910 |  |  | NH | O | OMe | CN | F | CH |
| 911 |  |  | NH | O | OEt | CN | F | CH |
| 912 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 913 |  |  | NH | O | OEt | Br | F | CH |
| 914 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 915 |  |  | NH | O | SEt | Cl | F | CH |
| 916 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH |

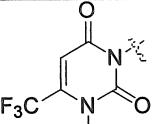
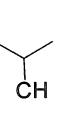
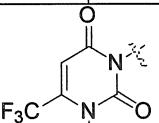
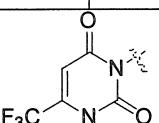
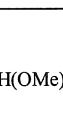
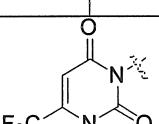
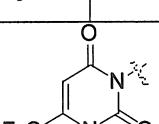
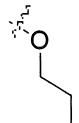
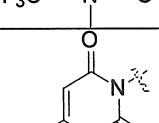
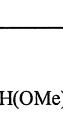
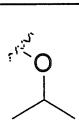
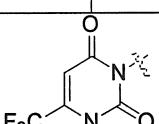
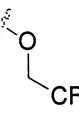
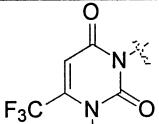
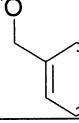
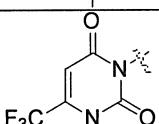
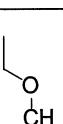
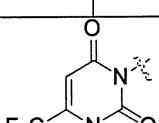
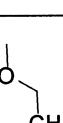
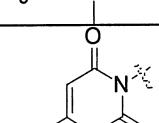
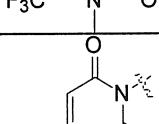
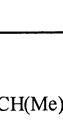
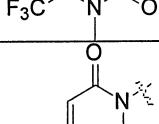
| | | | | | | | | |
|-----|---|---------------------|-----|---|---|----|---|----|
| 917 |  | CH(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 918 |  | CH(Me) | NH | O | OH | Cl | F | CH |
| 919 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 920 |  | CH(Me) | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 921 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 922 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 923 |  | CH(Me) | NEt | O |  | Cl | F | CH |
| 924 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 925 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 926 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 927 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 928 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 929 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|--|--------|-----|---|--|----|---|----|
| 930 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 931 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 932 | | CH(Me) | NMe | O | | Cl | F | CH |
| 933 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 934 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 935 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 936 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 937 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 938 | | CH(Me) | NEt | O | | Cl | F | CH |
| 939 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 940 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 941 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 942 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |

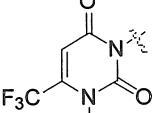
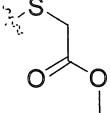
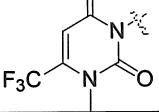
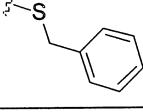
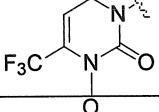
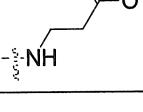
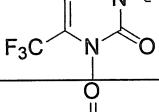
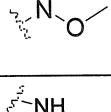
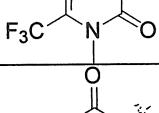
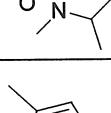
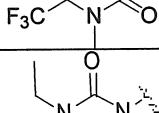
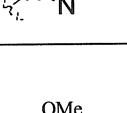
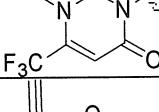
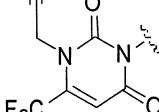
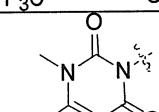
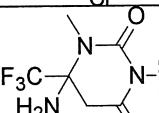
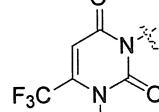
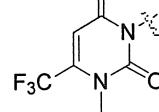
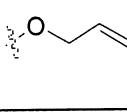
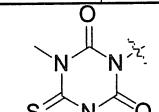
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|----|---|---|----|---|----|
| 943 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 944 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 945 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 946 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 947 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 948 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 949 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 950 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 951 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 952 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 953 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 954 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 955 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |

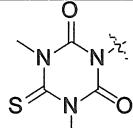
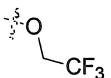
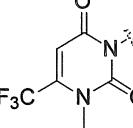
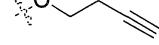
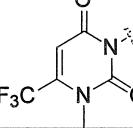
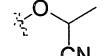
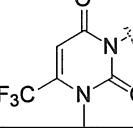
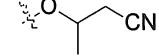
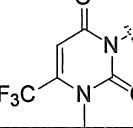
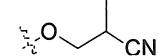
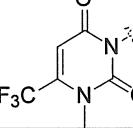
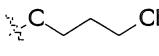
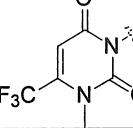
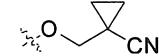
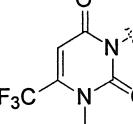
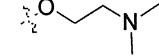
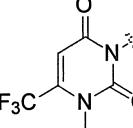
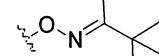
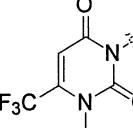
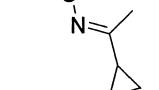
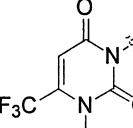
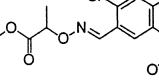
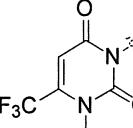
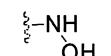
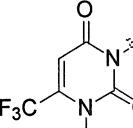
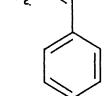
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|----|---|---|----|---|----|
| 956 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 957 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 958 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 959 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 960 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 961 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 962 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 963 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 964 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 965 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 966 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 967 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 968 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |

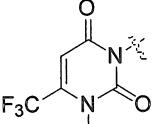
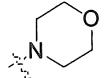
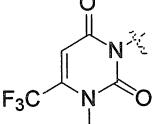
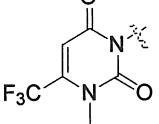
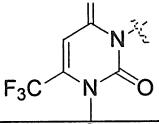
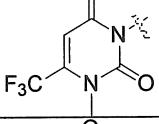
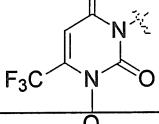
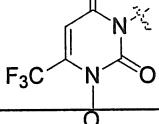
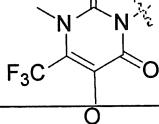
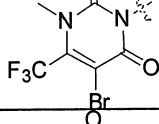
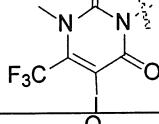
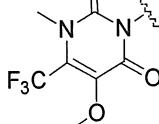
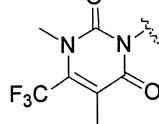
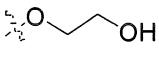
| | | | | | | | | |
|-----|---|--------|----|---|---|----|---|----|
| 969 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 970 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 971 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 972 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 973 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 974 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 975 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 976 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 977 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 978 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 979 |  | CH(F) | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 980 |  | CH(Et) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 981 |  | CH | NH | O | OMe | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|-----|---|---|----|---|---|-----|---|----|
| 982 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 983 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 984 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 985 |  |  | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 986 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 987 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 988 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 989 |  |  | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 990 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 991 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 992 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 993 |  |  | NH | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 994 |  |  | NH | O | OMe | CN | F | CH |

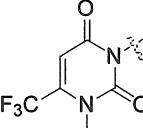
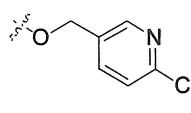
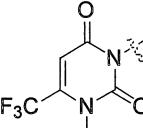
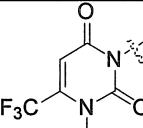
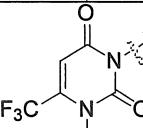
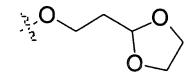
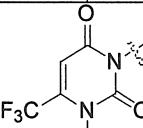
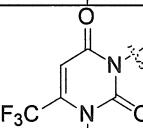
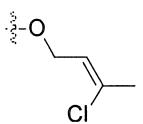
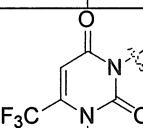
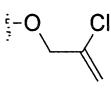
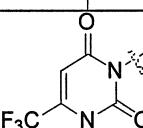
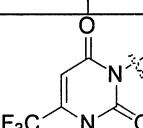
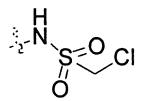
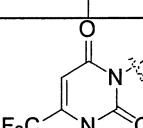
| | | | | | | | | |
|------|--|--------|----|---|-----|-----|---|----|
| 995 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 996 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 997 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 998 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH |
| 999 | | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH |
| 1000 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH |
| 1001 | | CH(Me) | NH | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 1002 | | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH |
| 1003 | | CH(Me) | NH | O | OMe | Br | F | CH |
| 1004 | | CH(Me) | NH | O | OMe | CF3 | F | CH |
| 1005 | | CH(Me) | NH | O | OMe | CN | F | CH |
| 1006 | | CH(Me) | NH | O | SET | Cl | F | CH |
| 1007 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 1008 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|------|---|--------------------|----|---|---|----|---|----|
| 1009 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1010 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1011 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1012 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1013 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1014 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1015 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1016 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1017 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1018 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1019 |  | C(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1020 |  | C(Me) ₂ | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1021 |  | CH(Me) | NH | O | OH | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|------|---|--------|----|---|---|----|---|----|
| 1022 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1023 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1024 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1025 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1026 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1027 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1028 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1029 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1030 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1031 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1032 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1033 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1034 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|---|----|---|----|
| 1035 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1036 |  | CH(CH ₃) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1037 |  | CH(C ₃ H ₅) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1038 |  | CH(C ₃ H ₅) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1039 |  | CH(CF ₃) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1040 |  | CH(C ₆ H ₅) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1041 |  | C(Me)(Et) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1042 |  | CH(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1043 |  | CH(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1044 |  | CH(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1045 |  | CH(Me) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1046 |  | CH(Me) ₂ | NH | O |  | Cl | F | CH |

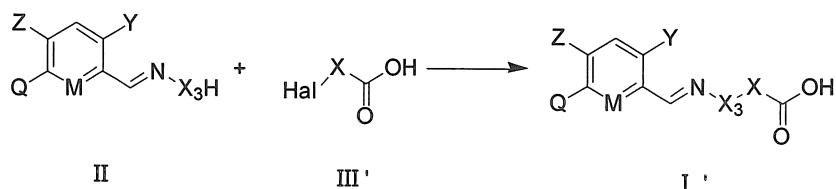
| | | | | | | | | |
|------|--|---|----|---|-----|----|---|----|
| 1047 | | CH ₂ CH ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1048 | | CH ₂ CH ₂ | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 1049 | | CH(Me)CH ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1050 | | CH ₂ CH ₂ CH ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1051 | | CH(CF ₃) | NH | O | OEt | Cl | F | CH |
| 1052 | | CH=CH | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1053 | | CH(Cyclobutyl) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1054 | | CH(Cyclopentyl) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1055 | | CH(Cyclohexyl) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1056 | | CH(Me) | NH | O | SEt | Cl | F | CH |
| 1057 | | CH(Me) | NH | O | | Cl | F | CH |
| 1058 | | CH(OMe) | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1059 | | C(OMe) ₂ | NH | O | OMe | Cl | F | CH |

| | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|---|----|---|----|
| 1060 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1061 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1062 |  |  | NH | O | OMe | Cl | F | CH |
| 1063 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1064 |  | CH(Me) | NH | O | NH ₂ | Cl | F | CH |
| 1065 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1066 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1067 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1068 |  | CH(Me) | NH | O |  | Cl | F | CH |
| 1069 |  | CH(Me) | NH | O | OMe | Cl | F | N |

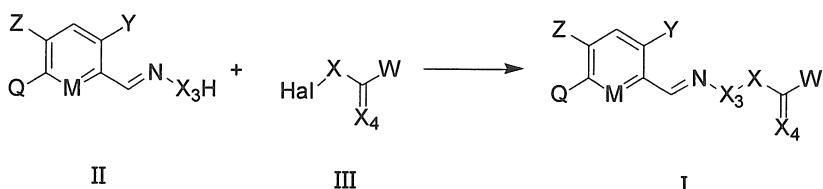
và các cấu hình R của các hợp chất 1-188, 193-432, 438-439, 441-469, 471-478, 481-484, 486-493, 495-545, 547-641, 644-669, 672, 674-681, 683-727, 729-829, 832-857, 860, 862-869, 871-916, 918-1018, 1021-1046, 1049, 1051-1058 và 1060-1069 với các nguyên tử cacbon được kết nối với X₁ và X₂ trong các hợp chất là các trung tâm bất đối.

7. Phương pháp điều chế hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6, bao gồm các bước sau:

cho hợp chất được biểu diễn bởi công thức tổng quát II và hợp chất được biểu diễn bởi công thức tổng quát III' tham gia phản ứng khử để thu được hợp chất có công thức tổng quát I', với phương trình phản ứng hóa học như sau:



hoặc, cho hợp chất được biểu diễn bởi công thức tổng quát II và hợp chất được biểu diễn bởi công thức tổng quát III tham gia phản ứng khử để thu được hợp chất có công thức tổng quát I, với phương trình phản ứng hóa học như sau:

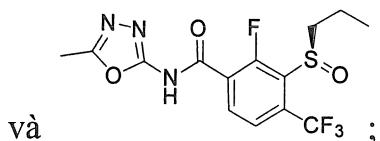


trong đó, Hal là halogen, các nhóm thế khác Q, M, W, Y, Z, X, X_3 và X_4 là như được xác định trong điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6;

tốt hơn, phản ứng được thực hiện với sự có mặt của một bazơ và một dung môi; tốt hơn nữa là bazơ ít nhất là một bazơ được chọn từ bazơ vô cơ và bazơ hữu cơ; tốt hơn nữa, dung môi ít nhất là một dung môi được chọn từ DMF, metanol, etanol, azetonitril, dicloetan, DMSO, Dioxan, diclometan và etyl axetat.

8. Chế phẩm diệt cỏ, khác biệt ở chỗ, chế phẩm này chứa (i) ít nhất một trong các hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit carboxylic theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 với hàm lượng diệt cỏ hiệu quả; tốt hơn, chế phẩm còn bao gồm (ii) một hoặc nhiều chất diệt cỏ khác với hàm lượng diệt cỏ hiệu quả và/hoặc chất an toàn; tốt hơn nữa, chế phẩm còn bao gồm (iii) một công thức phụ trợ được chấp nhận trong hóa nông nghiệp; tốt hơn nữa, chất diệt cỏ khác là một hoặc nhiều chất được chọn từ các hợp chất sau đây và axit, muối và este của nó:

(1) chất úc chế HPPD được chọn từ: topramezon, isoxaflutol, tembotrion, tefuryltrion, shuangzuocaotong, huanbifucaotong, sanzuohuangcaotong, benzuofucaotong



(2) chất úc ché PDS được chọn từ: flurtamón, diflufenican và picolinafen;

(3) chất úc ché DOXP được chọn từ: clomazon và bixlozon;

(4) chất úc ché ALS được chọn từ: tribenuron-metyl, thifensulfuron methyl, pyrazosulfuron-etyl, thiencarbazone-metyl, halosulfuron methyl, rimsulfuron, nicosulfuron và imazamox;

(5) chất úc ché ACCase được chọn từ: clethodim, sethoxydim và quizalofop-P-metyl;

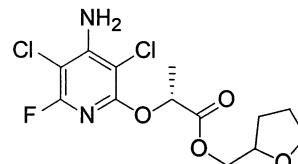
(6) chất úc ché PPO được chọn từ: oxyfluorfen, oxadiazon, oxadiargyl, sulfentrazone, pyraclonil, flumioxazin, saflufenacil, carfentrazone-etyl và trifludimoxazin;

(7) chất úc ché PSII được chọn từ: metribuzin, terbutylazin, amicarbazone, clotoluron, isoproturon, bromacil, propanil, desmedipham, phenmedipham, bentazon và bromoxynil;

(8) chất úc ché của tập hợp vi ống được chọn từ: butralin và pendimethalin;

(9) chất úc ché VLCFA được chọn từ: butaclor, pretilaclor, mefenacet, s-metolaclor, flufenacet, pyroxasulfon và anilofos;

(10) chất úc ché tổng hợp lipid (non-axetyl-CoA carboxylase): prosulfocarb;



(11) Các hormon tổng hợp được chọn từ: floxypyrr,

florpyrauxifen benzyl, halauxifen-metyl, triclopyr, clopyralid, picloram, aminopyralid, dicamba, axit 2-metyl-4-clophenoxyaxetic và axit 2,4-diclophenoxy axetic;

(12) chất úc ché EPSPS: glyphosate;

(13) chất úc ché GS được chọn từ: glufosinat amonium và glufosinat-P-amonium;

(14) chất úc ché PSI được chọn từ: paraquat diclorua và diquat dibromua monohydrat;

(15) Chất úc ché tổng hợp xenluloza được chọn từ: triaziflam và indaziflam;

(16) các chất diệt cỏ khác: cinmetylin.

9. Phương pháp để kiểm soát thực vật không mong muốn, khác biệt ở chỗ nó bao gồm việc áp dụng ít nhất một trong các hợp chất iminoaryl được thể dẫn xuất bởi axit

cacboxylic theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 hoặc chế phẩm diệt cỏ theo điểm 8 với một lượng hiệu quả diệt cỏ trên thực vật hoặc trong khu vực của nó hoặc đất hoặc nước để kiểm soát sự xuất hiện hoặc phát triển của thực vật không mong muốn; tốt hơn là, thực vật không mong muốn bao gồm các loài cỏ dại kháng hoặc chịu được thuốc diệt cỏ.