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

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

(11) **1-0049519**

(51)[2020.01] **C07C 323/23**; C07D 277/64; A01N 43/54; A01N 43/60; A01N 43/78; C07C 211/52; C07C 251/24; C07C 255/58; C07C 255/61; C07D 213/58; C07D 213/74; C07D 239/42; C07D 241/12; C07D 241/20; A01N 37/52; A01N 43/40

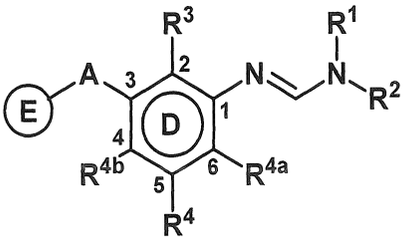
(13) **B**

(21) 1-2021-04308
(22) 13/01/2020
(86) PCT/IB2020/050213 13/01/2020
(87) WO 2020/148617 A1 23/07/2020
(30) 201911001543 14/01/2019 IN
(45) 25/08/2025 449
(43) 25/07/2022 412A
(73) PI INDUSTRIES LTD. (IN)
Post Box No. 20, Udaisagar Road, Udaipur-Rajasthan 313001, India
(72) NAIK, Maruti (IN); MAHAJAN, Vishal A. (IN); SIVAKUMAR, S. (IN); RATHOD, Kishor Singh (IN); GUMME, Sachin Nagnath (IN); AUTKAR, Santosh Shridhar (IN); GARG, Ruchi (IN); VENKATESHA, Hagalavadi M (IN); KLAUSENER, Alexander G.M. (DE).
(74) Công ty TNHH Tư vấn Luật ALIAT (ALIAT LEGAL)

(54) CÁC HỢP CHẤT PHENYLAMIDIN CÓ NHÓM THẾ Ở VỊ TRÍ SỐ 3, CHẾ PHẨM, HỖN HỢP VÀ HẠT GIỐNG CHỨA CHÚNG, PHƯƠNG PHÁP ĐỂ KIỂM SOÁT HOẶC NGĂN NGỪA SỰ XÂM NHẬP CỦA CÁC VI SINH VẬT GÂY BỆNH ĐỐI VỚI CÂY TRỒNG VÀ QUY TRÌNH ĐIỀU CHẾ CHÚNG

(21) 1-2021-04308

(57) Sáng chế đề cập đến các hợp chất phenylamidin có nhóm thế ở vị trí số 3 có công thức chung (I),



Công thức (I)

trong đó R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, A và E có cùng ý nghĩa như được định nghĩa trong mô tả sáng chế. Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm, hỗn hợp và hạt giống của chúng, phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự xâm nhập của các vi sinh vật gây bệnh đối với cây trồng và quy trình điều chế chúng.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế này đề cập đến các hợp chất phenylamidin có nhóm thế ở vị trí số 3. Cụ thể là, sáng chế này đề cập đến các hợp chất phenylamidin có nhóm thế ở vị trí số 3 có công thức chung (I), chế phẩm, hỗn hợp và hạt giống của chúng, phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự xâm nhập của các vi sinh vật gây bệnh đối với cây trồng và quy trình điều chế chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Nấm bệnh tiếp tục đe dọa nghiêm trọng đến sức khỏe cộng đồng và nông nghiệp. Vì vậy, việc kiểm soát các bệnh trên cây trồng do nấm gây ra là vô cùng quan trọng nhằm đạt được năng suất cây trồng cao. Các bệnh trên cây trồng gây hại cho cây cảnh, rau, đồng ruộng, ngũ cốc và cây ăn quả có thể làm giảm năng suất đáng kể và do đó làm tăng chi phí cho người tiêu dùng. Ngoài việc thường có tính phá hoại cao, các bệnh trên cây trồng có thể khó kiểm soát và xuất hiện khả năng kháng thuốc diệt nấm thương mại. Nhiều sản phẩm có sẵn trên thị trường phục vụ cho những mục đích này, nhưng vẫn có nhu cầu đối với các hợp chất diệt nấm mới hiệu quả hơn, ít tốn kém hơn, ít độc hại hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có các vị trí tác dụng khác nhau.

Ví dụ: WO2000046184, WO2003024219, WO2005089547, WO2003093224, WO2007031507, công bố các dẫn xuất phenylamidin và cách dùng chúng, có thể sử dụng đơn lẻ hoặc như một phần của các chế phẩm, làm thuốc diệt nấm.

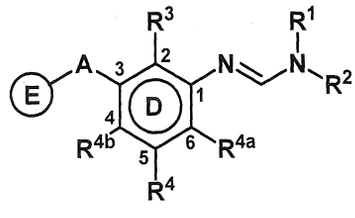
Các dẫn xuất phenylamidin được mô tả trong giải pháp kỹ thuật đã biết có hiệu quả tốt,

nhưng vẫn đặt ra một số kỳ vọng trong nhiều trường hợp khác nhau. Do đó, việc sử dụng các hợp chất thuốc trừ sâu mới để tránh và/hoặc kiểm soát sự phát triển của vi sinh vật như nấm hoặc vi khuẩn gây bệnh hoặc sâu bệnh kháng với các hoạt chất đã biết luôn được quan tâm rất lớn trong ngành nông nghiệp. Do đó, việc sử dụng các hợp chất mới có hoạt tính cao hơn các hợp chất đã biết, với mục đích giảm lượng hợp chất có hoạt tính được sử dụng, đồng thời duy trì hiệu quả ít nhất là tương đương với các hợp chất đã biết thu hút được nhiều sự quan tâm.

Hiện nay, các đòi hỏi về môi trường và kinh tế đối với thuốc diệt nấm đang liên tục tăng lên, ví dụ như về phổ hoạt tính, độc tính, tính chọn lọc, tỷ lệ sử dụng, sự hình thành các chất tồn dư và quy trình sản xuất thuận lợi, và cũng làm tăng khả năng xảy ra, ví dụ như các vấn đề về kháng thuốc, do đó có nhu cầu liên tục về việc cung cấp các hợp chất diệt nấm mới để khắc phục các yêu cầu về môi trường và kinh tế và/hoặc giảm bớt các vấn đề liên quan đến khả năng kháng mầm bệnh. Theo đó, sáng chế này đề xuất một dòng hợp chất mới có các tác dụng hoặc ưu điểm đã đề cập ở trên, sở hữu hoạt tính bất ngờ và cao hơn đáng kể giúp chống lại các vi sinh vật không mong muốn như các mầm bệnh nấm hoặc vi khuẩn.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Theo đó, sáng chế này đề xuất một hợp chất phenylamidin có nhóm thế ở vị trí số 3 có công thức chung (I) hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp, đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình hoặc N-oxit của chúng.



Công thức (I)

trong đó, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, A và E được định nghĩa trong phần mô tả chi tiết.

Theo một phương án, sáng chế này đề xuất quy trình điều chế một hợp chất có công thức chung (I) hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp của chúng.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất một chế phẩm bao gồm ít nhất một hợp chất có công thức chung (I) và tùy ý gồm ít nhất một hợp chất có hoạt tính khác được lựa chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng, thuốc kháng sinh, phân bón hoặc hỗn hợp của chúng.

Theo một phương án khác nữa, sáng chế này đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, để kiểm soát và/hoặc ngăn chặn vi sinh vật gây bệnh cho cây trồng đối với cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn.

Theo một phương án khác, sáng chế này đề xuất sử dụng ít nhất một hợp chất của sáng chế, ở các dạng hỗn hợp hoặc chế phẩm, và các phương pháp sử dụng như nhau, đặc biệt trong lĩnh vực nông nghiệp, chủ yếu để bảo vệ thực vật.

Các hợp chất theo sáng chế đã tăng cường hoạt tính chống lại vi sinh vật, đặc biệt là chống lại nấm gây bệnh cho cây trồng. Các hợp chất theo sáng chế có thể được ứng dụng trong lĩnh vực nông nghiệp hoặc có thể được sử dụng làm chất trung gian để tổng hợp các hợp chất có ứng dụng rộng rãi hơn.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các định nghĩa

Các định nghĩa sau đây được cung cấp cho các thuật ngữ được sử dụng trong sáng chế này chỉ nhằm mục đích minh họa và không giới hạn phạm vi của sáng chế được trình bày trong sáng chế này.

Các cụm từ chuyển tiếp "gồm", "gồm có", "bao gồm", "có", "chứa", "có các đặc điểm" hoặc bất kỳ biến thể nào khác của chúng, có thể được hiểu là một sự bao gồm không loại trừ, theo bất kỳ giới hạn nào được chỉ định một cách rõ ràng. Ví dụ, một chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp gồm có danh sách các thành phần không nhất thiết chỉ giới hạn ở các thành phần đó mà có thể bao gồm các thành phần khác không được liệt kê rõ ràng hoặc gắn liền với chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp đó.

Cụm từ chuyển tiếp "gồm có" sẽ loại trừ bất kỳ thành phần, bước hoặc thành phần nào không được nêu. Nếu được dùng trong yêu cầu bảo hộ, cụm từ này sẽ loại bỏ các chất không phải là các chất được trích dẫn ngoại trừ các tạp chất thông thường đi kèm. Khi cụm từ chuyển tiếp "gồm có" xuất hiện trong một mệnh đề của phần chính của yêu cầu bảo hộ, thay vì ngay sau phần mở đầu, nó chỉ giới hạn thành phần được nêu trong mệnh đề đó; các thành phần khác không bị loại trừ khỏi yêu cầu bảo hộ một cách tổng thể.

Cụm từ chuyển tiếp "gồm có chủ yếu là" được sử dụng để định nghĩa một chế phẩm hoặc phương pháp bao gồm các nguyên liệu, bước, đặc điểm, cấu phần hoặc thành phần, ngoài những yếu tố được nêu cụ thể rõ ràng, với điều kiện là các nguyên liệu, bước, đặc điểm, cấu phần hoặc thành phần bổ sung này không ảnh hưởng nghiêm trọng đến (các) đặc tính cơ bản và mới lạ của sáng chế được yêu cầu bảo hộ này. Thuật ngữ "gồm có chủ yếu là" mang sắc thái trung gian giữa "gồm" và "gồm có".

Hơn nữa, trừ khi được trình bày một cách rõ ràng ngược lại, thì từ "hoặc" mang tính bao gồm chứ không phải mang tính loại trừ. Ví dụ: điều kiện "A" hoặc "B" được hiểu là có ở bất kỳ trường hợp nào dưới đây: A là đúng (hoặc có) và B là sai (hoặc không có), A là sai (hoặc không có) và B là đúng (hoặc có), và cả A và B đều đúng (hoặc có).

Ngoài ra, mạo từ không xác định "một" đứng trước tên một thành phần hoặc cấu phần của sáng chế được hiểu là không hạn chế về số lượng thực thể (tức là số lần xuất hiện) của thành phần hoặc cấu phần đó. Do đó, "một" nên được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của thành phần hoặc cấu phần cũng bao gồm số nhiều trừ khi số đó rõ ràng là số ít.

Như được đề cập trong sáng chế này, thuật ngữ "thuốc trừ sâu" trong mỗi trường hợp cũng luôn gồm có thuật ngữ "thuốc bảo vệ thực vật".

Thuật ngữ "vi sinh vật không mong muốn" hoặc "vi sinh vật gây bệnh cho cây trồng" như nấm hoặc vi khuẩn gây bệnh lần lượt bao gồm *Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes* và *Deuteromycetes và Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae* và *Streptomycetaceae*.

Thuật ngữ "nông học" đề cập đến việc sản xuất các loại cây trồng trên đồng ruộng như thực phẩm, nhiên liệu, nhiên liệu sinh học, bất kỳ vật liệu sinh học nào và sợi và bao gồm việc trồng các loại cây như ngô, đậu nành và các loại cây họ đậu khác, gạo, ngũ cốc (ví dụ: lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, lúa, ngô), các loại rau lá, (ví dụ, rau diếp, bắp cải, và các loại cây có vỏ khác), rau ra quả (ví dụ: cà chua, hạt tiêu, cà tím, cải và dưa chuột), khoai tây, khoai lang, nho, bông, quả (ví dụ: táo, quả hạch và cam quýt), quả nhỏ (quả mọng, anh đào), cây sản xuất nhiên liệu sinh học như ngô, cây cho đường/tinh bột, củ cải đường và cao lương ngọt, cây trồng lấy xenlulo như cỏ kê switchgrass, miscanthus, sản phẩm phụ từ thu hoạch cây ngô, cây dương, cây cải dùng làm nhiên liệu diesel (canola), đậu nành, dầu cọ, mù tạt, camelina, cây rum, hướng dương và dầu mè và cây trồng đặc sản khác (ví dụ, dầu hạt cải, dầu hướng dương, dầu oliu).

Thuật ngữ "phi nông học" đề cập đến các loại khác với các loại cây trồng trên cánh đồng, chẳng hạn như cây trồng làm vườn (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây cảnh không được trồng trên cánh đồng), các cấu trúc dân cư, nông nghiệp, thương mại và công nghiệp, lớp đất cỏ (ví dụ, trang trại cỏ, đồng cỏ, sân gôn, bãi cỏ, sân thể thao, v.v.,), sản phẩm gỗ, sản phẩm được lưu trữ, quản lý nông lâm nghiệp và thực vật, các ứng dụng trong y tế công cộng (tức là con người) và thú y (ví dụ, động vật thuần hóa như vật nuôi, gia súc, gia cầm, động vật chưa thuần hóa như động vật hoang dã).

Các thuật ngữ alkyl, alkenyl, alkynyl, cacboxyclyl, heteroxyclyl, aryl và các nhóm heteroaryl, như được định nghĩa ở đây, được thay thế tùy ý (ví dụ, alkyl "được thế" hoặc

"không được thế", alkenyl "được thế" hoặc "không được thế", alkynyl "được thế" hoặc "không được thế", cacboxyclyl "được thế" hoặc "không được thế", heteroxyclyl "được thế" hoặc "không được thế", aryl "được thế" hoặc "không được thế" hoặc các nhóm heteroaryl "được thế" hoặc "không được thế"). Nói chung, thuật ngữ "được thế", cho dù đứng trước thuật ngữ "tùy ý" hay không, có nghĩa là ít nhất một hydro có trong một nhóm (ví dụ, nguyên tử cacbon hoặc nitơ, v.v.,) được thế bằng một nhóm thế cho phép, ví dụ, một nhóm thế mà khi thay thế tạo ra một hợp chất ổn định, ví dụ, một hợp chất không trải qua sự biến đổi một cách tự phát như bằng cách hoán vị, tạo vòng, loại bỏ, hoặc phản ứng khác trong điều kiện bình thường (nhiệt độ, áp suất, không khí, v.v.,). Trừ khi được trình bày khác, nhóm "được thế" có một nhóm thế ở một hoặc nhiều vị trí có thể thế của nhóm và khi nhiều hơn một vị trí trong bất kỳ cấu trúc nhất định nào được thế, thì nhóm thế này giống nhau hoặc khác nhau ở mỗi vị trí.

Thuật ngữ "alkyl", được sử dụng một mình hoặc trong các từ ghép như "alkylthio" hoặc "haloalkyl" bao gồm alkyl C_1 đến C_{24} mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn là alkyl C_1 đến C_{15}, tốt hơn nữa là alkyl C_1 đến C_{10}, tốt nhất là alkyl C_1 đến C_6 .Các ví dụ không giới hạn của alkyl bao gồm metyl, etyl, propyl, 1-metyletyl, butyl, 1-metylpropyl, 2-metylpropyl, 1,1-dimetyletyl, pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, hexyl, 1,1-dimetylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, 1-metylpentyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 4-metylpentyl, 1,1-dimetylbutyl, 1,2-dimetylbutyl, 1,3-dimetylbutyl, 2,2-dimetylbutyl, 2,3-dimetylbutyl, 3,3-dimetylbutyl, 1-etylbutyl, 2-etylbutyl, 1,1,2-trimetylpropyl, 1,2,2-trimetylpropyl, 1-etyl-1-metylpropyl và l-etyl-2-metylpropyl hoặc các đồng phân khác. Nếu alkyl ở cuối một nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như trong alkylxycloalkyl, thì phần đầu của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như xycloalkyl, có thể là được alkyl thay thế một (mono-) hoặc nhiều (poly-) lần, giống hoặc khác nhau và độc lập. Tương tự cũng áp dụng cho các nhóm thế hỗn hợp có các gốc khác, ví dụ alkenyl, alkynyl, hydroxyl, halogen, cacbonyl, cacbonyloxy và tương tự, ở cuối.

Thuật ngữ "alkenyl" có thể đứng một mình hoặc trong các từ ghép bao gồm các anken C_2 đến C_{24} mạch nhánh hoặc mạch thẳng, tốt hơn là các anken từ C_2 đến C_{15}, tốt hơn nữa là

các anken từ C_2 đến C_{10}, tốt nhất là các anken từ C_2đến C_6. Các ví dụ không giới hạn của alkenyl bao gồm ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-metylethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-metyl-1-propenyl, 2-metyl-l-propenyl, l-metyl-2 -propenyl, 2-metyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-metyl-1-butenyl, 2-metyl-1-butenyl, 3-metyl-1-butenyl, l-metyl-2-butenyl, 2-metyl-2-butenyl, 3-metyl-2-butenyl, l-metyl-3-butenyl, 2-metyl-3-butenyl, 3-metyl-3-butenyl, 1,1-dimetyl-2-propenyl, 1,2-dimetyl-1-propenyl, 1,2-dimetyl-2 -propenyl, 1-etyl-1-propenyl, l-etyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-metyl-1-pentenyl, 2-metyl-1-pentenyl, 3-metyl-1-pentenyl, 4-metyl-1-pentenyl, 1-metyl-2-pentenyl, 2-metyl-2-pentenyl, 3-metyl-2-pentenyl, 4-metyl-2-pentenyl, l-metyl-3-pentenyl, 2-metyl-3-pentenyl, 3-metyl-3-pentenyl, 4-metyl-3-pentenyl, 1-metyl-4-pentenyl, 2-metyl-4-pentenyl, 3-metyl-4-pentenyl, 4-metyl-4-pentenyl, 1,1-dimetyl-2-butenyl, l,l-dimetyl-3-butenyl, 1,2-dimetyl-l-butenyl, 1,2-dimetyl-2-butenyl, 1,2-dimetyl-3-butenyl, 1,3-dimetyl-1-butenyl, l,3-dimetyl-2-butenyl, l,3-dimetyl-3-butenyl, 2,2-dimetyl-3-butenyl, 2,3-dimetyl-1-butenyl, 2,3-dimetyl-2-butenyl, 2,3-dimetyl-3-butenyl, 3,3-dimetyl-l-butenyl, 3,3-dimetyl-2-butenyl, 1-etyl-1-butenyl, 1-etyl-2-butenyl, l-etyl-3-butenyl, 2-etyl- 1-butenyl, 2-etyl-2-butenyl, 2-etyl-3-butenyl, l,l,2-trimetyl-2-propenyl, 1-etyl-l-metyl-2-propenyl, l-etyl-2-metyl-l-propenyl và l-etyl-2-metyl-2-propenyl và các đồng phân khác. "Alkenyl" cũng bao gồm các polyen như 1,2-propadienyl và 2,4-hexadienyl. Định nghĩa này cũng áp dụng cho alkenyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ haloalkenyl và tương tự, trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "alkynyl", có thể đứng một mình hoặc trong các từ ghép bao gồm các alkyne C_2 đến C_{24} mạch nhánh hoặc mạch thẳng, tốt hơn là các alkyne từ C_2 đến C_{15}, tốt hơn nữa là các alkyne từ C_2 đến C_{10}, tốt nhất là các alkyne từ C_2 đến C_6. Các ví dụ không giới hạn của alkyne bao gồm ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butynyl, 2-butynyl, 3-butynyl, 1-metyl-2-propynyl, 1-pentynyl, 2-pentynyl, 3-pentynyl, 4-pentynyl, l-metyl-2-butynyl, l-metyl-3-butynyl, 2-metyl-3-butynyl, 3-metyl-l-butynyl, 1,1-dimetyl-2-propynyl, 1-etyl -2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-metyl-2-pentynyl, l-

metyl-3-pentynyl, 1-metyl-4-pentynyl, 2-metyl-3-pentynyl, 2-metyl-4-pentynyl, 3-metyl-l-pentynyl, 3-metyl-4-pentynyl, 4-metyl-l-pentynyl, 4-metyl-2-pentynyl, 1,1-dimetyl-2-butynyl, l,l-dimetyl-3-butynyl, l,2-dimetyl-3-butynyl, 2,2-dimetyl-3-butynyl, 3,3-dimetyl-l-butynyl, l-etyl-2-butynyl, l-etyl-3-butynyl, 2-etyl-3-butynyl và 1-etyl-l-metyl-2-propynyl và các đồng phân khác nhau. Định nghĩa này cũng áp dụng cho alkynyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ haloalkynyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác. "Alkynyl" cũng có thể bao gồm các nhóm chức gồm có nhiều liên kết ba như 2,5-hexadiynyl.

Thuật ngữ "xycloalkyl" có nghĩa là alkyl đóng để tạo thành một vòng. Các ví dụ không giới hạn bao gồm nhưng không giới hạn đối với xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl. Định nghĩa này cũng áp dụng cho xycloalkyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như xycloalkylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "xycloalkenyl" có nghĩa là alkenyl đóng để tạo thành đơn vòng bao gồm các nhóm hydrocacbyl đơn vòng, không bão hòa một phần. Các ví dụ không giới hạn bao gồm nhưng không giới hạn đối với xyclopentenyl và xyclohexenyl. Định nghĩa này cũng áp dụng cho xycloalkenyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như xycloalkenylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "xycloalkynyl" có nghĩa là alkynyl đóng để tạo thành đơn vòng bao gồm các nhóm đơn vòng, không bão hòa một phần. Định nghĩa này cũng áp dụng cho xycloalkynyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như xycloalkynylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "xycloalkoxy", "xycloalkenyloxy" và thuật ngữ tương tự được định nghĩa tương tự. Các ví dụ không giới hạn của xycloalkoxy bao gồm xyclopropyloxy, xyclopentyloxy và xyclohexyloxy. Định nghĩa này cũng áp dụng cho xycloalkoxy như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như xycloalkoxy alkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "alkoxy" được sử dụng một mình hoặc trong các từ ghép bao gồm alkoxy C_1 đến C_{24}, tốt hơn là alkoxy C_1 đến C_{15}, tốt hơn nữa là alkoxy C_1 đến C_{10}, tốt nhất là alkoxy C_1 đến C_6. Các ví dụ không giới hạn về alkoxy bao gồm metoxy, etoxy, propoxy, 1-metyletoxy, butoxy, 1-metylpropoxy, 2-metylpropoxy, 1,1-dimetyletoxy, pentoxy, 1-metylbutoxy, 2-metylbutoxy, 3-metylbutoxy, 2,2-dimetylpropoxy, 1-etylpropoxy, hexoxy, 1,1-dimetylpropoxy, 1,2-dimetylpropoxy, 1-metylpentoxy, 2-metylpentoxy, 3-metylpentoxy, 4-metylpentoxy, 1,1-dimetylbutoxy, 1,2-dimetylbutoxy, 1,3-dimetylbutoxy, 2,2-dimetylbutoxy, 2,3-dimetylbutoxy, 3,3-dimetylbutoxy, 1-etylbutoxy, 2-etylbutoxy, 1,1,2-trimetylpropoxy, 1,2,2-trimetylpropoxy, 1-etyl-1-metylpropoxy và 1-etyl-2-metylpropoxy và các đồng phân khác. Định nghĩa này cũng áp dụng cho alkoxy như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như haloalkoxy, alkynylalkoxy, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "alkylthio" bao gồm nhóm chức alkylthio mạch nhánh hoặc mạch thẳng như metylthio, etylthio, propylthio, 1-metyletylthio, butylthio, 1-metylpropylthio, 2-metylpropylthio, 1,1-dimetyletylthio, pentylthio, 1-metylbutylthio, 2-metylbutylthio, 3-metylbutylthio, 2,2-dimetylpropylthio, 1-etylpropylthio, hexylthio, 1,1-dimetylpropylthio, 1,2-dimetylpropylthio, 1-metylpentylthio, 2-metylpentylthio, 3-metylpentylthio, 4-metylpentylthio, 1,1-dimetylbutylthio, 1,2-dimetylbutylthio, 1,3-dimetylbutylthio, 2,2-dimetylbutylthio, 2,3-dimetylbutylthio, 3,3-dimetylbutylthio, 1-etylbutylthio, 2-etylbutylthio, 1,1,2-trimetylpropylthio, 1,2,2-trimetylpropylthio, 1-etyl-1-metylpropylthio và l-etyl-2-metylpropylthio và các đồng phân khác.

Các ví dụ không giới hạn của "alkylsulfinyl" bao gồm nhưng không giới hạn đối với metylsulphinyl, etylsulphinyl, propylsulphinyl, 1-metyletylsulphinyl, butylsulphinyl, 1-metylpropylsulphinyl, 2-metylpropylsulphinyl, 1,1-dimetyletylsulphinyl, pentylsulphinyl, 1-metylbutylsulphinyl, 2-metylbutylsulphinyl, 3-metylbutylsulphinyl, 2,2-dimetylpropylsulphinyl, 1-etylpropylsulphinyl, hexylsulphinyl, 1,1-dimetylpropylsulphinyl, 1,2-dimetylpropylsulphinyl, 1-metylpentylsulphinyl, 2-metylpentylsulphinyl, 3-metylpentylsulphinyl, 4-metylpentylsulphinyl, 1,1-

dimetylbutylsulphinyl, 1,2-dimetylbutylsulphinyl, 1,3-dimetylbutylsulphinyl, 2,2-dimetylbutylsulphinyl, 2,3-dimetylbutylsulphinyl, 3,3-dimetylbutylsulphinyl, 1-etylbutylsulphinyl, 2-etylbutylsulphinyl, 1,1,2-trimetylpropylsulphinyl, 1,2,2-trimetylpropylsulphinyl, 1-etyl-1-metylpropylsulphinyl và 1-etyl-2-metylpropylsulphinyl và các đồng phân khác. Thuật ngữ "arylsulfinyl" bao gồm Ar-S(O), trong đó Ar có thể là bất kỳ phân tử vòng cacboxylic hoặc phân tử dị vòng nào. Định nghĩa này cũng áp dụng cho alkylsulphinyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như haloalkylsulphinyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Các ví dụ không giới hạn của "alkylsulfonyl" bao gồm nhưng không giới hạn đối với metylsulphonyl, etylsulphonyl, propylsulphonyl, 1-metyletylsulphonyl, butylsulphonyl, 1-metylpropylsulphonyl, 2-metylpropylsulphonyl, 1,1-dimetyletylsulphonyl, pentylsulphonyl, 1-metylbutylsulphonyl, 2-metylbutylsulphonyl, 3-metylbutylsulphonyl, 2,2-dimetylpropylsulphonyl, 1-etylpropylsulphonyl, hexylsulphonyl, 1,1-dimetylpropylsulphonyl, 1,2-dimetylpropylsulphonyl, 1-metylpentylsulphonyl, 2-metylpentylsulphonyl, 3-metylpentylsulphonyl, 4-metylpentylsulphonyl, 1,1-dimetylbutylsulphonyl, 1,2-dimetylbutylsulphonyl, 1,3-dimetylbutylsulphonyl, 2,2-dimetylbutylsulphonyl, 2,3-dimetylbutylsulphonyl, 3,3-dimetylbutylsulphonyl, 1-etylbutylsulphonyl, 2-etylbutylsulphonyl, 1,1,2-trimetylpropylsulphonyl, 1,2,2-trimetylpropylsulphonyl, 1-etyl-1-metylpropylsulphonyl và l-etyl-2-metylpropylsulphonyl và các đồng phân khác. Thuật ngữ "arylsulfonyl", bao gồm Ar-S$(O)_2$, trong đó Ar có thể là bất kỳ phân tử vòng cacboxylic hoặc phân tử dị vòng nào. Định nghĩa này cũng áp dụng cho alkylsulphonyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như alkylsulphonylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "hydroxy" có nghĩa là –OH, "amino" có nghĩa là –NRR, trong đó R có thể là H hoặc bất kỳ nhóm thế có thể có nào như alkyl; "cacbonyl" có nghĩa là -C(O)- , "cacbonyloxy" có nghĩa là -OC(O)-, "sulfinyl" có nghĩa là SO, "sulfonyl" có nghĩa là S$(O)_2$.

Thuật ngữ "halogen", đứng một mình hoặc trong các từ ghép như "haloalkyl", bao gồm flo, clo, brom hoặc iốt. Hơn nữa, khi được sử dụng trong các từ ghép như từ "haloalkyl", alkyl được nhắc đến có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng các nguyên tử halogen có thể giống hoặc khác nhau.

Các ví dụ không giới hạn của "haloalkyl", bao gồm clometyl, bromometyl, diclometyl, triclometyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, cloflometyl, dicloflometyl, clodiflometyl, 1-cloetyl, 1-bromoetyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 2-clo-2-floetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 2,2-diclo-2-floetyl, 2,2,2-tricloetyl, pentafloetyl, 1,1-diclo-2,2,2-trifloetyl, và 1,1,1-trifloprop-2-yl. Định nghĩa này cũng áp dụng cho haloalkyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như haloalkylaminoalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Các thuật ngữ "haloalkenyl", "haloalkynyl" được định nghĩa tương tự ngoại trừ, thay vì các nhóm alkyl, các nhóm alkenyl và alkynyl được coi là một phần của nhóm thế.

Thuật ngữ "haloalkoxy" có nghĩa là các nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh trong đó một số hoặc tất cả các nguyên tử hydro trong các nhóm này có thể được thay thế bằng các nguyên tử halogen như được liệt kê ở trên. Các ví dụ không giới hạn của haloalkoxy bao gồm clometoxy, bromometoxy, diclometoxy, triclometoxy, flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, cloflometoxy, dicloflometoxy, clodiflometoxy, 1-cloetoxy, 1-bromoetoxy, 1-floetoxy, 2-floetoxy, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-clo-2-floetoxy, 2-clo-2,2-difloetoxy, 2,2-diclo-2-floetoxy, 2,2,2-tricloetoxy, pentafloetoxy và l,l,l-trifloprop-2-oxy. Định nghĩa này cũng áp dụng cho haloalkoxy như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như haloalkoxyalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "haloalkylthio" hoặc "haloalkylsulfanyl" có nghĩa là các nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh trong đó một số hoặc tất cả các nguyên tử hydro trong các nhóm này có thể được thay thế bằng các nguyên tử halogen như được liệt kê ở trên. Các ví dụ không giới hạn của haloalkylthio bao gồm clometylthio, bromometylthio, diclometylthio, triclometylthio, flometylthio, diflometylthio, triflometylthio, cloflometylthio,

dicloflometylthio, clodiflometylthio, 1-cloetylthio, 1-bromoetylthio, 1- floetylthio, 2-floetylthio, 2,2-difloetylthio, 2,2,2-trifloetylthio, 2-clo-2- floetylthio, 2-clo-2,2-difloetylthio, 2,2-diclo-2-floetylthio, 2,2,2-tricloetylthio, pentafloetylthio và l,l,l-trifloprop-2-ylthio. Định nghĩa này cũng áp dụng cho haloalkylthio như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như haloalkylthioalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Các ví dụ của "haloalkylsulfinyl" bao gồm $CF_3S(O)$, $CCl_3S(O)$, $CF_3CH_2S(O)$ và $CF_3CF_2S(O)$. Các ví dụ của "haloalkylsulfonyl" bao gồm $CF_3S(O)_2$, $CCl_3S(O)_2$, $CF_3CH_2S(O)_2$ và $CF_3CF_2S(O)_2$.

Thuật ngữ "hệ thống vòng hoặc vòng đôi" biểu thị một hệ thống vòng gồm có hai hoặc nhiều nguyên tử phổ biến.

Thuật ngữ "thơm" biểu thị rằng quy tắc Hueckel được thỏa mãn và thuật ngữ "không thơm" có nghĩa là quy tắc Hueckel không được thỏa mãn.

Các thuật ngữ "phân tử vòng cacboxylic" hoặc "cacboxyclic" hoặc "cacboxyclyl" bao gồm "hệ thống vòng cacboxyclic thơm" và "hệ thống vòng cacboxylic không thơm" hoặc các hợp chất vòng đa vòng hoặc hai vòng (vòng spiro, ngưng tụ, vòng cầu, không ngưng tụ), trong đó có thể là vòng thơm hoặc không thơm (trong đó vòng thơm biểu thị rằng quy tắc Huckel được thỏa mãn và vòng không thơm biểu thị rằng quy tắc Huckel không được thỏa mãn).

Các ví dụ không giới hạn về hệ vòng cacboxyclic không thơm là xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, norbornyl và các chất tương tự.

Các ví dụ không giới hạn về hệ thống vòng cacboxyclic thơm là phenyl, naphtyl và các chất tương tự.

Thuật ngữ "aryl" như được sử dụng ở đây là nhóm chứa bất kỳ nhóm thơm gốc cacbon nào bao gồm, nhưng không giới hạn đối với phenyl, naphtalen, biphenyl, anthracen, và các chất

tương tự. Nhóm aryl có thể được thế hoặc không được thế. Ngoài ra, nhóm aryl có thể là một cấu trúc vòng đơn hoặc bao gồm nhiều cấu trúc đa vòng là cấu trúc vòng ngưng tụ hoặc được gắn qua một hoặc nhiều nhóm vòng cầu như liên kết cacbon-cacbon.

Thuật ngữ "aralkyl" dùng để chỉ các gốc aryl hydrocacbon bao gồm một phần alkyl như được định nghĩa ở trên. Các ví dụ không hạn chế bao gồm benzyl, phenyletyl và 6-napthylhexyl. Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ "aralkenyl" dùng để chỉ các gốc aryl hydrocacbon bao gồm một phần alkenyl, như được định nghĩa ở trên và một phần aryl, như được định nghĩa ở trên. Các ví dụ không giới hạn bao gồm styryl, 3-(benzyl) prop-2-enyl, và 6-napthylhex-2-enyl.

Thuật ngữ "hetero" liên quan đến các vòng dùng để chỉ một vòng trong đó ít nhất một nguyên tử vòng không phải là cacbon và có thể chứa 1 đến 4 dị nguyên tử được chọn độc lập từ nhóm gồm có nitơ, oxy và lưu huỳnh, với điều kiện là mỗi vòng không chứa nhiều hơn 4 nguyên tử nitơ, không quá 2 nguyên tử oxy và không quá 2 nguyên tử lưu huỳnh.

Thuật ngữ "phân tử dị vòng" hoặc "dị vòng" bao gồm "phân tử dị vòng thơm" hoặc "hệ thống vòng heteroaryl" và "hệ thống vòng phân tử dị vòng không thơm" hoặc hợp chất vòng đa vòng hoặc hai vòng (vòng spiro, ngưng tụ, vòng cầu, không ngưng tụ), trong đó có thể là vòng thơm hoặc không thơm, trong đó vòng phân tử dị vòng chứa ít nhất một dị nguyên tử được chọn từ N, O, $S(O)_{0-2}$, và/hoặc phần tử vòng C của phân tử dị vòng có thể được thay thế bằng C(=O), C(=S), C(=CR*R*) và C=NR*, * biểu thị số nguyên.

Thuật ngữ "phân tử dị vòng không thơm" hoặc "dị vòng không thơm" có nghĩa là phân tử dị vòng có ba đến mười lăm phần tử, tốt nhất là ba đến mười hai phần tử, bão hòa hoặc không bão hòa một phần có chứa một đến bốn dị nguyên tử từ nhóm oxy, nitơ và lưu huỳnh: các phân tử dị vòng đơn vòng, hai vòng hoặc ba vòng có chứa, ngoài các phần tử vòng cacbon, một đến ba nguyên tử nitơ và/hoặc một nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh hoặc một hoặc hai nguyên tử oxy và/hoặc lưu huỳnh; nếu vòng chứa nhiều hơn một nguyên tử oxy, chúng không liên kết trực tiếp với nhau; ví dụ (nhưng không giới hạn) như oxiranyl, aziridinyl, oxetanyl, azetidinyl, thietanyl, 2-tetrahydrofuranyl, 3-tetrahydrofuranyl, 2-

tetrahydrothienyl, 3-tetrahydrothienyl, 1-pyrrolidinyl, 2-pyrrolidinyl, 3-pyrrolidinyl, 3-isoxazolidinyl, 4-isoxazolidinyl, 5-isoxazolidinyl, 3-isothiazolidinyl, 4-isothiazolidinyl, 5-isothiazolidinyl, 1-pyrazolidinyl, 3-pyrazolidinyl, 4-pyrazolidinyl, 5-pyrazolidinyl, 2-oxazolidinyl, 4-oxazolidinyl, 5-oxazolidinyl, 2-thiazolidinyl, 4-thiazolidinyl, 5-thiazolidinyl, 1-imidazolidinyl, 2-imidazolidinyl, 4-imidazolidinyl, 1,2,4-oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-triazolidin-1-yl, 1,2,4-triazolidin-3-yl, 1,3,4-oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-triazolidin-1-yl, 1,3,4-triazolidin-2-yl, 2,3-dihydrofur-2-yl, 2,3-dihydrofur-3-yl, 2,4-dihydrofur-2-yl, 2,4-dihydrofur-3-yl, 2,3-dihydrothien-2-yl, 2,3-dihydrothien-3-yl, 2,4-dihydrothien-2-yl, 2,4-dihydrothien-3-yl, pyrrolinyl, 2-pyrrolin-2-yl, 2-pyrrolin-3-yl, 3-pyrrolin-2-yl, 3-pyrrolin-3-yl, 2-isoxazolin-3-yl, 3-isoxazolin-3-yl, 4-isoxazolin-3-yl, 2-isoxazolin-4-yl, 3-isoxazolin-4-yl, 4-isoxazolin-4-yl, 2-isoxazolin-5-yl, 3-isoxazolin-5-yl, 4-isoxazolin-5-yl, 2-isothiazolin-3-yl, 3-isothiazolin-3-yl, 4-isothiazolin-3-yl, 2-isothiazolin-4-yl, 3-isothiazolin-4-yl, 4-isothiazolin-4-yl, 2-isothiazolin-5-yl, 3-isothiazolin-5-yl, 4-isothiazolin-5-yl, 2,3-dihydropyrazol-l-yl, 2,3-dihydropyrazol-2-yl, 2,3-dihydropyrazol-3-yl, 2,3-dihydropyrazol-4-yl, 2,3-dihydropyrazol-5-yl, 3,4-dihydropyrazol-l-yl, 3,4-dihydropyrazol-3-yl, 3,4-dihydropyrazol-4-yl, 3,4-dihydropyrazol-5-yl, 4,5-dihydropyrazol-l-yl, 4,5-dihydropyrazol-3-yl, 4,5-dihydropyrazol-4-yl, 4,5-dihydropyrazol-5-yl, 2,3-dihydrooxazol-2-yl, 2,3-dihydrooxazol-3-yl, 2,3-dihydrooxazol-4-yl, 2,3-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, 3,4-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, piperidinyl, 2-piperidinyl, 3-piperidinyl, 4-piperidinyl, pyrazynyl, morpholinyl, thiomorphlinyl, l,3-dioxan-5-yl, 2-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydropyranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-hexahydropyridazinyl, 4-hexahydropyridazinyl, 2-hexahydropyrimidinyl, 4-hexahydropyrimidinyl, 5-hexahydropyrimidinyl, 2-piperazinyl, xycloserin. Định nghĩa này cũng áp dụng cho heteroxyclyl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như heteroxyclylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "heteroaryl" có nghĩa là hệ thống vòng có 5 hoặc 6 phần tử, đơn vòng không bão hòa hoàn toàn có chứa một đến bốn dị nguyên tử từ nhóm oxy, nitơ và lưu huỳnh; nếu vòng chứa nhiều hơn một nguyên tử oxy, chúng không liên kết trực tiếp với nhau; heteroaryl 5 phần tử có chứa một đến bốn nguyên tử nitơ hoặc một đến ba nguyên tử nitơ và một nguyên tử lưu huỳnh hoặc oxy: Các nhóm heteroaryl 5 phần tử, ngoài các nguyên tử cacbon, có thể chứa một đến bốn nguyên tử nitơ hoặc một đến ba nguyên tử nitơ và một nguyên tử lưu huỳnh hoặc oxy như là các phần tử của vòng, ví dụ (nhưng không giới hạn) như furyl, thienyl, pyrrolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl, oxazolyl, thiazolyl, imidazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,3,4-triazolyl, tetrazolyl; heteroaryl 5 phần tử liên kết với nitơ có chứa một đến bốn nguyên tử nitơ, hoặc heteroaryl 5 phần tử liên kết với nitơ ngưng tụ benzen có chứa một đến ba nguyên tử nitơ: Các nhóm heteroaryl 5 phần tử, ngoài các nguyên tử cacbon, có thể chứa một đến bốn nguyên tử nitơ hoặc một đến ba nguyên tử nitơ như là các phần tử của vòng và trong đó hai phần tử vòng cacbon liền kề nhau hoặc một nguyên tử nitơ và một phần tử vòng cacbon liền kề có thể được tạo vòng cầu với một nhóm buta-1,3-diene-1,4-diyl, trong đó một hoặc hai nguyên tử cacbon có thể được thay thế bằng các nguyên tử nitơ, mà ở đó các vòng này được gắn vào khung thông qua một trong các phần tử vòng nitơ, ví dụ (nhưng không giới hạn) như 1-pyrrolyl, 1-pyrazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1-imidazolyl, 1,2,3-triazolyl và 1,3,4-triazolyl.

Heteroaryl 6 phần tử có chứa một đến bốn nguyên tử nitơ: Các nhóm heteroaryl 6 phần tử, ngoài các nguyên tử cacbon, có thể chứa lần lượt một đến ba và một đến bốn nguyên tử nitơ như các phần tử vòng, ví dụ (nhưng không giới hạn) như 2-pyridinyl, 3-pyridinyl, 4-pyridinyl, 3-pyridazinyl, 4-pyridazinyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl, 2-pyrazinyl, 1,3,5-triazin-2-yl, 1,2,4-triazin-3-yl và 1,2,4,5-tetrazin-3-yl; heteroaryl 5 phần tử ngưng tụ benzen chứa một đến ba nguyên tử nitơ hoặc một nguyên tử nitơ và một nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh: ví dụ (nhưng không giới hạn) như indol-1-yl, indol-2-yl, indol-3-yl, indol-4-yl, indol-5-yl, indol-6-yl, indol-7-yl, benzimidazol-1-yl, benzimidazol-2-yl, benzimidazol-4-yl, benzimidazol-5-yl, indazol-1-yl, indazol-3-yl, indazol-4-yl, indazol-5-

yl, indazol-6-yl, indazol-7-yl, indazol-2-yl, l-benzofuran-2-yl, l-benzofuran-3-yl, l-benzofuran-4-yl, l-benzofuran-5-yl, 1-benzofuran- 6-yl, l-benzofuran-7-yl, l-benzothiophen-2-yl, l-benzothiophen-3-yl, l-benzothiophen-4-yl, 1- benzothiophen-5-yl, l-benzothiophen-6-yl, l-benzothiophen-7-yl, l,3-benzothiazol-2-yl, 1,3- benzothiazol-4-yl, l,3-benzothiazol-5-yl, l,3-benzothiazol-6-yl, l,3-benzothiazol-7-yl, l,3-benzoxazol-2-yl, l,3-benzoxazol-4-yl, l,3-benzoxazol-5-yl, 1,3-benzoxazol-6-yl và l,3-benzoxazol-7-yl; heteroaryl 6 phần tử ngưng tụ benzen có chứa một đến ba nguyên tử nitơ: ví dụ (nhưng không giới hạn) như quinolin-2-yl, quinolin-3-yl, quinolin-4-yl, quinolin-5-yl, quinolin-6-yl, quinolin-7-yl, quinolin-8-yl, isoquinolin-l-yl, isoquinolin-3-yl, isoquinolin-4-yl, isoquinolin-5-yl, isoquinolin-6-yl, isoquinolin-7-yl và isoquinolin-8-yl.

Các ví dụ không giới hạn về heteroaryl có 6-5 phân tử ngưng tụ bao gồm Indolizinyl; pyrazolo[1,5-a]pyridinyl; imidazo[1,2-a]pyridinyl; pyrrolo[1,2-a]pyrimidinyl; pyrazolo[1,5-a]pyrimidinyl; imidazo[1,2-a]pyrimidinyl; pyrrolo[1,2-a]pyrazinyl; pyrazolo[1,5-a]pyrazinyl; imidazo[1,2-a]pyrazinyl và các chất tương tự.

Định nghĩa này cũng áp dụng cho heteroaryl như là một phần của nhóm thế hỗn hợp, ví dụ như heteroarylalkyl, v.v., trừ khi được định nghĩa cụ thể ở phần khác.

Thuật ngữ "amit" có nghĩa là A-R'C=ONR"-B, trong đó R' và R" chỉ các nhóm thế và A và B là bất kỳ nhóm nào.

Thuật ngữ "thioamit" có nghĩa là A-R'C=SNR"-B, trong đó R' và R" chỉ các nhóm thế và A và B là bất kỳ nhóm nào.

Thuật ngữ "nhóm xuất" có nghĩa là, tất cả các nhóm thế có đủ tính nucleophin trong các điều kiện phản ứng phổ biến hoặc nhóm có thể thay thế nucleophin; ví dụ, halogen, triflat, mesylat, tosylat hoặc SO_2-Me có thể được đề cập là các nhóm xuất phù hợp.

Tổng số nguyên tử cacbon trong một nhóm thế được biểu thị bằng tiền tố "C_i-C_j", trong đó i và j là những con số từ 1 đến 21. Ví dụ, C_1-C_3 alkylsulfonyl chỉ metylsulfonyl đến propylsulfonyl; C_2 alkoxyalkyl chỉ CH_3OCH_2; C_3 alkoxyalkyl chỉ, ví dụ, $CH_3CH(OCH_3)$,

$CH_3OCH_2CH_2$ hoặc $CH_3CH_2OCH_2$; và C_4 alkoxyalkyl chỉ các đồng phân khác nhau của một nhóm alkyl được thay thế bằng một nhóm alkoxy chứa tổng cộng bốn nguyên tử cacbon, ví dụ bao gồm $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ và $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. Trong các nội dung trên, khi một hợp chất có Công thức I gồm có một hoặc nhiều vòng dị vòng, tất cả các nhóm thế được gắn vào các vòng này thông qua bất kỳ nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bằng cách thay thế một nguyên tử hydro cho nguyên tử cacbon hoặc nitơ đã đề cập.

Khi một hợp chất được thế bằng một nhóm thế mang một số cho biết số lượng các nhóm thế nói trên có thể lớn hơn 1, các nhóm thế nói trên (khi chúng lớn hơn 1) được chọn độc lập từ nhóm các nhóm thế được xác định. Hơn nữa, khi số m trong $(R)_m$ chỉ một số nguyên nằm trong khoảng, ví dụ, từ 0 đến 4 thì số nhóm thế có thể được chọn từ các số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4.

Khi một nhóm có chứa một nhóm thế có thể là hydro, thì sau đó khi đó nhóm thế này được coi là hydro, và người ta công nhận rằng nhóm này không được thay thế.

Các phương án trong sáng chế này, các đặc điểm khác nhau và các chi tiết có lợi của chúng được giải thích với sự tham chiếu đến các phương án không giới hạn trong bản mô tả. Mô tả về các cấu phần phổ biến và kỹ thuật xử lý được bỏ qua để tập trung vào các nội dung phương án trong sáng chế này. Các ví dụ được sử dụng ở đây chỉ nhằm mục đích giải thích một cách dễ hiểu về phương thức thực hiện các phương án trong sáng chế này và nhằm cho phép những người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực kỹ thuật tương ứng thực hiện tốt các phương án trong sáng chế này. Theo đó, các ví dụ không nên được hiểu là giới hạn phạm vi của các phương án trong sáng chế này.

Việc mô tả đã đề cập về các phương án cụ thể sẽ cho thấy đầy đủ bản chất chung của các phương án ở đây mà phương án khác có thể, bằng cách áp dụng kiến thức hiện tại, dễ dàng sửa đổi và/hoặc điều chỉnh cho các ứng dụng khác nhau như các phương án cụ thể mà không xa rời khái niệm chung, và do đó, nhưng chỉnh sửa và sửa đổi như vậy nên và được nhằm để được hiểu theo ý nghĩa và trong phạm vi tương tự của các phương án được đề cập trong sáng chế. Cần phải hiểu rằng cụm từ hoặc thuật ngữ được sử dụng ở đây là nhằm

mục đích mô tả và không nhằm mục đích giới hạn. Do đó, trong khi các phương án này đã được mô tả theo các phương án được ưu tiên, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ nhận ra rằng các phương án ở đây có thể được thực hiện với sự sửa đổi trong tinh thần và phạm vi của các phương án như được mô tả trong sáng chế này.

Bất kỳ thảo luận về tài liệu, hoạt động, vật liệu, thiết bị, bài viết và tương tự đã được đưa vào mô tả sáng chế này chỉ nhằm mục đích cung cấp bối cảnh cho sáng chế này. Không được thừa nhận rằng bất kỳ hoặc tất cả các vấn đề này là một phần của giải pháp kỹ thuật đã biết hoặc là kiến thức chung trong lĩnh vực liên quan đến sáng chế này vì nó tồn tại ở bất cứ đâu trước ngày ưu tiên của đơn đăng ký sáng chế này.

Mặc dù các giá trị số học được đề cập trong mô tả này và các yêu cầu bảo hộ đề cập ở trên có thể tạo nên một phần quan trọng của sáng chế trong mô tả sáng chế này, nhưng bất kỳ sự chênh lệch nào so với các giá trị số học đó vẫn sẽ nằm trong phạm vi của sáng chế này nếu sự chênh lệch đó tuân theo cùng một nguyên tắc khoa học như của sáng chế được trình bày trong sáng chế này.

Thuật ngữ "sâu bệnh" với mục đích của sáng chế này bao gồm nhưng không giới hạn ở nấm, stramenopile (sinh vật nhân chuẩn), vi khuẩn, tuyến trùng, mạt, ve, côn trùng và động vật gặm nhấm.

Thuật ngữ "thực vật" ở đây được hiểu là tất cả các loài thực vật và quần thể thực vật, chẳng hạn như thực vật hoang dã hoặc cây trồng mong muốn và không mong muốn (bao gồm cả cây trồng tự nhiên). Cây trồng có thể là cây có thể thu được bằng phương pháp nhân giống và tối ưu hóa thông thường hoặc bằng phương pháp công nghệ sinh học và di truyền hoặc kết hợp các phương pháp này, bao gồm cả cây chuyển gen và bao gồm cả các giống cây trồng có thể được bảo vệ và không được bảo vệ theo quyền của nhà tạo giống cây trồng.

Với mục đích của sáng chế này, thuật ngữ "thực vật" có nghĩa là một sinh vật sống bao gồm các loại cây, cây bụi, thảo mộc, cỏ, dương xỉ và rêu, thường mọc trong một khu vực,

hấp thụ nước và các chất cần thiết thông qua rễ của nó, và tổng hợp chất dinh dưỡng trong lá thông qua quang hợp.

Ví dụ về "thực vật" cho mục đích của sáng chế này bao gồm nhưng không giới hạn ở các loại cây nông nghiệp như lúa mì, lúa mạch đen, lúa mạch, tiểu hắc mạch, yến mạch hoặc lúa; củ dền, ví dụ củ cải đường hoặc củ cải bò; quả và cây ăn quả, chẳng hạn như táo, quả cây cứng hoặc quả không hạt, ví dụ táo, lê, mận, đào, hạnh nhân, anh đào, dâu tây, quả mâm xôi, hoặc mận gai; cây họ đậu, như đậu lăng, đậu Hà Lan, cỏ linh lăng hoặc đậu nành; cây dầu, như cây cải dầu, mù tạt, ô liu, hoa hướng dương, dừa, hạt ca cao, cây thầu dầu, cây cọ dầu, hạt lạc hoặc đậu nành; họ bầu bí, chẳng hạn như bí, dưa chuột hoặc dưa; cây sợi, như bông, lanh, cây gai hoặc đay; cây ăn quả và cây có múi, như cam, chanh, bưởi hoặc quýt; bất kỳ loại cây trồng, rau, như cải bó xôi, rau diếp, măng tây, cải bắp, cà rốt, hành tây, cà chua, khoai tây, dưa chuột hoặc ~~ớt bột~~ cây ớt; cây nguyệt quế, chẳng hạn như bơ, quế hoặc long não; họ bầu bí; cây có dầu; các cây tạo năng lượng và nguyên liệu, như ngũ cốc, ngô, đậu tương, các loại cây họ đậu khác, cải dầu, mía hoặc cọ dầu; thuốc lá; quả hạch; cà phê; trà; cacao; chuối; ớt; cây nho (nho khô và nước nho); cây hoa bia; lớp cỏ; đường (còn gọi là Stevia); cây cao su tự nhiên hoặc cây cảnh và lâm nghiệp, như hoa, cây bụi, cây lá rộng hoặc cây thường xanh, ví dụ cây lá kim; và trên các vật liệu nhân giống cây trồng, chẳng hạn như hạt giống, và vật liệu cây trồng của những cây này.

Tốt hơn là, thực vật cho mục đích của sáng chế bao gồm nhưng không giới hạn ở ngũ cốc, ngô, lúa, đậu tương và các cây họ đậu khác, quả và cây ăn quả, nho, hạt và cây hạt, họ cam và cây có múi, bất kỳ cây trồng nào, họ bầu bí, cây có dầu, thuốc lá, cà phê, trà, cacao, củ cải đường, mía, bông, khoai tây, cà chua, hành tây, ớt và rau, cây cảnh, bất kỳ cây trồng hoa và thực vật khác để sử dụng cho người và động vật.

Thuật ngữ "bộ phận thực vật" được hiểu là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất. Với mục đích của sáng chế này, thuật ngữ "bộ phận thực vật" bao gồm nhưng không giới hạn ở cành giâm, lá, cành, củ, hoa, hạt, cành, rễ bao gồm rễ cái, rễ

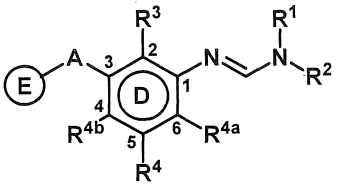
bên, lông rễ, đỉnh rễ, chóp rễ, thân rễ, cành ghép, cành non, quả, thân quả, vỏ cây, thân, chồi, chồi phụ, mô phân sinh, đốt và gióng.

Thuật ngữ "vị trí xung quanh" bao gồm đất, môi trường xung quanh của cây trồng hoặc các bộ phận thực vật và các thiết bị hoặc công cụ được sử dụng trước, trong hoặc sau khi gieo/trồng cây hoặc một bộ phận thực vật.

Việc sử dụng các hợp chất của sáng chế này hoặc hợp chất của sáng chế này trong một chế phẩm tùy ý gồm có các hợp chất tương thích khác cho thực vật hoặc nguyên liệu thực vật hoặc vị trí xung quanh bao gồm việc áp dụng kỹ thuật đã được biết đến bởi những người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này, trong đó bao gồm nhưng không giới hạn ở phun, phủ hạt giống, nhúng thuốc, hun khói, tẩm thuốc, tiêm thuốc và phủ bột.

Thuật ngữ "được ứng dụng" có nghĩa là được áp dụng trên một thực vật hoặc bộ phận thực vật theo phương pháp vật lý hoặc hóa học bao gồm cả việc ngâm tẩm.

Theo quan điểm trên, sáng chế này đề xuất một hợp chất có công thức chung (I),



Công thức (I)

trong đó,

R^1 được chọn từ nhóm gồm có hydro, xyano, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, C_1-C_{12}-alkoxy, C_3-C_8-xycloalkyl và C_4-C_8-xycloalkylalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc (=S);

R^2 được chọn từ nhóm gồm có C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S); hoặc

R^1 và R^2 cùng với các nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng không thơm từ ba đến bảy phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thế bởi một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

mỗi nhóm R^1 và R^2 có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

R^3 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

R^4 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″, C_3-C_8-xycloalkyl và C_7-C_{12}-aralkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xyclic có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

R^{4a} và R^{4b} được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, C_1-C_4-alkyl, C_2-C_4-alkenyl, C_2-C_4-alkynyl, C_1-C_4-haloalkyl, OR″, $S(O)_nR'$, và C_3-C_5-xycloalkyl;

mỗi nhóm R^3 và R^4 có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

A tương ứng với -{[C(R^6R^7)]$_{0-2}$-(B)$_{0-1}$}-, -{[B-C(R^6R^7)]$_{0-1}$-C(=Y)}-; trong đó B tương ứng với O, S, NR^5 hoặc CR^6R^7; và Y tương ứng với O hoặc S;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_8-alkyl, C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-haloalkyl, S(O)$_n$R‴, OR″, NR′R″, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, S(O)$_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O), C(=S);

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, C_1-C_8-alkyl, C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-haloalkyl, N(R″)$_2$, OR″, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, S(O)$_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S); hoặc

R^6 và R^7 cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, S(O)$_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng có từ ba đến sáu phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thế bởi một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, N(R′)$_2$, COOR′ và CON(R′)$_2$;

mỗi nhóm R^5, R^6 và R^7 có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, N(R′)$_2$, COOR′ và CON(R′)$_2$;

vòng E được chọn từ nhóm gồm có C_3-C_{18}-cacboxyclyl và C_3-C_{18}-heteroxyclyl ngưng tụ hoặc không ngưng tụ, có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm R^8;

R^8 được chọn từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, nitro, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, C_2-C_{12}-haloalkenyl, C_2-C_{12}-haloalkynyl, C_3-C_8-xycloalkyl, C_4-C_8-xycloalkenyl, C_4-C_8-xycloalkynyl, C_7-C_{19}-aralkyl, C_5-C_{12}-bixycloalkyl, C_6-C_{10}-aryl, C_3-C_6-heteroxyclyl, SCN, SF_5, N(R′R‴), OR″, S(O)$_n$R‴, (C=O)-R‴, C_1-C_8-alkyl-S(O)$_n$R″, C_1-C_8-alkyl-(C=O)-R″, CR′=NR″, -S(R^9)=N(R^{10}), -S(R^9)(O)=N(R^{10}), S(R^9)$_2$=N-,

$S(R^9)_2(O)=N-$ và $S(R^9)_2(O)=N-C(R^{6a}R^{7a})-$; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xyclic có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

R^{6a} và R^{7a} được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, C_1-C_8-alkyl, C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_1-C_8-haloalkyl, C_2-C_8-haloalkenyl, $(NR'')_2$, OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; hoặc

R^{6a} và R^{7a} cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng có từ ba đến sáu phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thế bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$; hoặc

R^{6a} và R^{7a} cùng với nguyên tử mà chúng gắn vào có thể tạo thành nhóm =O hoặc =S;

R^9 được chọn lọc độc lập từ nhóm gồm có C_1-C_8-alkyl và C_3-C_8-xycloalkyl;

R^{10} được chọn từ nhóm gồm có hydro, xyano, C_1-C_8-alkyl, C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, (C=O)-R″, $S(O)_nR'''$ và C_3-C_8-xycloalkyl; hoặc

R^9 và R^{10} cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng có từ ba đến bảy phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thế bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$; hoặc

R^8 và R^9 hoặc R^{10} cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng

được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng có từ ba đến bảy phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thế bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

R^5 hoặc R^6 hoặc R^7 và R^8 hoặc hai R^8 cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S) có thể tạo thành một vòng có từ ba đến mười phần tử, trong đó thành phần của nó có thể được thay thế bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

mỗi nhóm R^8, R^9 hoặc R^{10} có thể được thế tùy ý bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, N(R′R″), COOR′ và CON(R′R″);

X tương ứng với halogen;

R′ được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_8-alkyl và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó nhóm alkyl và xycloalkyl có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều X;

R″ được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_8-alkyl, C_1-C_8-haloalkyl, C_3-C_8-xycloalkyl, $N(R')_2$, OR′ và C_6-C_{18}-aryl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xyclic có thể được thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

R‴ được chọn từ các nhóm gồm có xyano, R″, C_2-C_8-alkenyl, C_2-C_8-alkynyl, C_3-C_8-xycloalkyl, C_4-C_8-xycloalkenyl, C_4-C_8-xycloalkynyl, OR′, (C=O)-R′, COOR′, $CON(R')_2$, C_6-C_{18}-aryl và C_7-C_{19}-aralkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xyclic có thể được thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

mỗi nhóm R″ và R‴ có thể được thế bằng một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, $N(R')_2$, COOR′ và $CON(R')_2$;

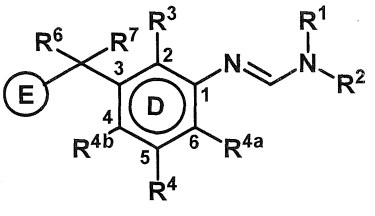
n tương ứng với số nguyên 0, 1 hoặc 2;

m tương ứng với một số nguyên 0, 1 hoặc 2;

hoặc các muối chấp nhận được về mặt nông hóa học, các đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, đa hình, phức kim loại hoặc N-oxit của chúng;

với điều kiện là các hợp chất sau đây bị loại khỏi định nghĩa về hợp chất có công thức (I); N'-(2-xyano-3-((3,3-diflo-1-metylpiperidin-4-yl)oxy)-5-metoxyphenyl)-N,N-dimetylformimidamit và N'-(5-bromo-2-xyano-3-((2,4-dimetoxybenzyl)oxy)phenyl)-N,N-dimetylformimidamit.

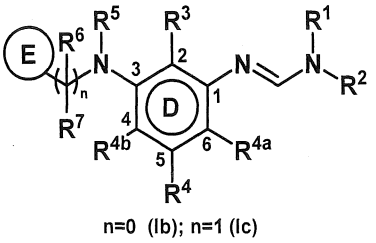
Theo một phương án khác, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (Ia),



Công thức (Ia)

trong đó, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, R^6, R^7 và E như được định nghĩa ở trên.

Theo một phương án khác, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (Ib và Ic),

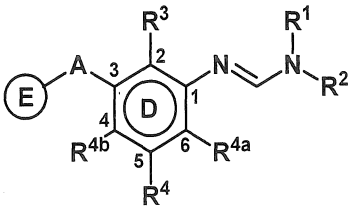


n=0 (Ib); n=1 (Ic)

Công thức (Ib/Ic)

trong đó, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, R^5, R^6, R^7 và E như được định nghĩa ở trên.

Theo một phương án khác nữa, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (Id và Ie),

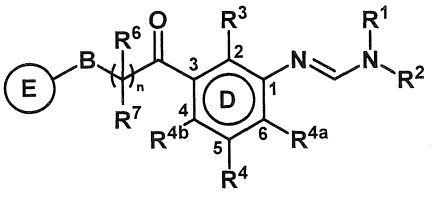


A=O (Id); A= S (Ie)

Công thức (Id/Ie)

trong đó, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, A và E như được định nghĩa ở trên.

Theo một phương án khác nữa, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (If và Ig),



n =0 (If); n= 1 (Ig)

Công thức (If/Ig)

trong đó, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, R^6, R^7, B và E như được định nghĩa ở trên.

Theo một phương án được ưu tiên của sáng chế này, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I), trong đó,

R^1 được chọn từ nhóm gồm có C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_1-C_6-alkoxy, C_3-C_5-xycloalkyl và C_4-C_8-xycloalkylalkyl;

R^2 được chọn từ nhóm gồm có C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_3-C_8-xycloalkyl và C_1-C_6-haloalkyl;

R^3 và R^4 được chọn độc lập từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_3-C_8-xycloalkyl và OR′;

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, C_1-C_4-alkyl, C_2-C_4-alkenyl, C_2-C_4-alkynyl, C_1-C_4-haloalkyl và C_3-C_4-xycloalkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S);

vòng E được chọn từ nhóm gồm có C_3-C_{10}-cacboxyclyl và C_5-C_{10}-heteroxyclyl ngưng tụ hoặc không ngưng tụ, có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều nhóm R^8;

hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp, đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình hoặc N-oxit của chúng.

Theo một phương án được ưu tiên hơn của sáng chế này, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I), trong đó,

R^1 và R^2 được chọn độc lập từ nhóm gồm có C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_3-C_5-xycloalkyl và C_4-C_8-xycloalkylalkyl;

R^3 và R^4 được chọn độc lập từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_3-C_5-xycloalkyl và OR″;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_3-C_5-xycloalkyl và OR′.

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, C_1-C_4-alkyl, C_2-C_4-alkenyl, C_2-C_4-alkynyl, C_1-C_4-haloalkyl, OR″ và C_3-C_5-xycloalkyl;

vòng E được chọn từ xyclopropyl, xyclobutyl, phenyl, napthalenyl, furyl, thienyl, pyrrolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, thiadiazolyl, pyrazolyl, oxazolyl, imidazolyl, oxadiazolyl, triazolyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, indolyl, benzimidazolyl, indazolyl, benzofuranyl, benzothiophenyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolinyl, isoquinolinyl, iquinazolinyl, cinnonyl, indolizinyl, pyrazolo[1,5-a]pyridinyl, imidazo[1,2-a]pyridinyl, pyrrolo[1,2-a]pyrimidinyl, pyrazolo[1,5-a]pyrimidinyl, imidazo[1,2-a]pyrimidinyl, pyrrolo[1,2-a]pyrazinyl, pyrazolo[1,5-a]pyrazinyl, imidazo[1,2-a]pyrazinyl; trong đó mỗi nhóm thế của E được thế tùy ý với một hoặc nhiều R^8;

hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp, đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình hoặc N-oxit của chúng.

phương án được ưu tiên, hợp chất có công thức (I) được chọn từ nhóm gồm có N'-(2-clo-5-metyl-3-(p-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2,5-dimetyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2,5-dimetyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-

metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(2-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-clophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-

N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(2-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3,5-dimetylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3-clo-2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-isopropylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-isopropylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)(metyl)amino)-5-

metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(3,5-diflo-4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-flo-3,5-dimetylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(2-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(2,6-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(2-clo-6-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-

etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(3-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(2-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-clobenzyl)-2-

metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-clo-3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((4-clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-

metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-((3-bromophenyl)amino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2-(diflometoxy)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometyl)benzyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((4-flo-3-metylbenzyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-clobenzyl)amino)-2-metylphenyl)-

N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-bromo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metyl-2-(metylthio)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(o-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-clo-3-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2,5-dimetyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-bromo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-

(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metoxybenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-

(metylthio)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(4-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-(3-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-

metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3,4-diflobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(3-flo-5-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit , N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-

metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-xyano-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(5-clo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(3-benzyl-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-xyano-3-(3-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-xyano-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(4-clobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(5-xyano-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit và N'-(5-xyano-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidami.

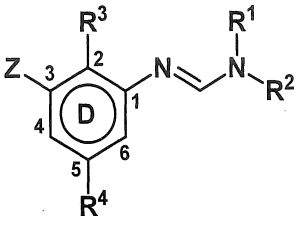
Bất kỳ hợp chất nào theo sáng chế đều có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng đồng phân quang học, hình học hoặc đối hình tùy thuộc vào số lượng tâm không đối xứng trong hợp chất. Do đó, sáng chế đề cập một cách ngang nhau đến tất cả các đồng phân quang học và hỗn hợp raxemic hoặc scalemic (thuật ngữ "scalemic" biểu thị hỗn hợp các đồng phân đối quang theo các tỷ lệ khác nhau), và hỗn hợp của tất cả các đồng phân lập thể có thể có, theo mọi tỷ lệ. Các chất đồng phân không đối quang và/hoặc các chất đồng phân đối quang có thể được phân tách theo các phương pháp mà người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này đã biết.

Bất kỳ hợp chất nào theo sáng chế cũng có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng đồng phân

hình học tùy thuộc vào số lượng liên kết đôi trong hợp chất. Do đó, sáng chế đề cập đến tất cả các đồng phân hình học và tất cả các hỗn hợp có thể có, theo mọi tỷ lệ một cách ngang nhau. Các đồng phân hình học có thể được phân tách theo các phương pháp chung, mà người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực kỹ thuật tương ứng đã biết.

Bất kỳ hợp chất nào theo sáng chế này, cũng có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng không định hình hoặc đồng hình hoặc đa hình, tùy thuộc vào việc điều chế, bảo quản tinh chế và nhiều yếu tố ảnh hưởng khác. Do đó, sáng chế đề cập đến tất cả các dạng không định hình, đồng hình và đa hình có thể có, theo mọi tỷ lệ. Các dạng không định hình, đồng hình và đa hình có thể được điều chế và/hoặc tách và/hoặc tinh chế theo các phương pháp thông thường, mà người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này đã biết.

Theo một phương án, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (A);



Công thức (A)

trong đó,

Z tương ứng với OH, NH_2, SH, X, hoặc nhóm xuất;

R^1 được chọn từ nhóm gồm có C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, và C_3-C_8-xycloalkyl;

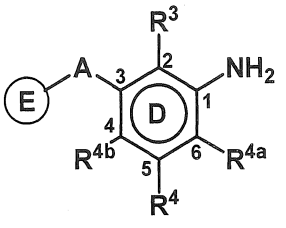
R^2 được chọn từ nhóm gồm có xyano, C_2-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, (C=O)-R″, C_3-C_8-xycloalkyl và C_3-C_8-xycloalkyl-C_1-C_3-alkyl;

R^3 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl; trong đó một hoặc

nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xycloalkyl có thể được thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm bao gồm C(=O) và C(=S);

R^4 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_{12}-alkyl, C_2-C_{12}-alkenyl, C_2-C_{12}-alkynyl, C_1-C_{12}-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″, C_3-C_8-xycloalkyl và C_7-C_{12}-aralkyl; trong đó một hoặc nhiều nguyên tử cacbon trong vòng xyclic có thể được thay thế bằng các dị nguyên tử được chọn từ nhóm gồm có N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm từ 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) và C(=S).

Theo một phương án, sáng chế này đề xuất hợp chất có công thức (B);



Công thức (B)

trong đó, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, A và E như được định nghĩa ở trên.

Trong phương án được ưu tiên, hợp chất có công thức (B) được lựa chọn từ 2-clo-5-metyl-N^1-(p-tolyl)benzen-1,3-diamin, 2,5-dimetyl-3-(4-metylbenzyl)anilin, 3-(3-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 2,5-dimetyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin, N^1-(2-flophenyl)-2,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(2-flophenyl)-N^1,2,5-trimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 2-clo-3-(2-clobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(2-flobenzyl)-5-metylanilin, 5-flo-2-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(4-((triflometyl)thio)phenyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin, 2-clo-5-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin, 5-flo-N^1-(2-flophenyl)-2-

metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(4-(tert-butyl)phenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin, 2-clo-3-(3-flobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-N^1-(2-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin, N^1-(4-(tert-butyl)phenyl)-2-clo-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(4-((triflometyl)thio)phenyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-3-(3-clobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(3-metoxybenzyl)-5-metylanilin, 5-flo-N^1-(3-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3-clophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, N^1-(3-clophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-3-(4-flobenzyl)-5-metylanilin, 3-(2-bromobenzyl)-2-clo-5-metylanilin, 4-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril, 2-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril, 3-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril, 2-clo-N^1-(3-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin, 2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin, 2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)anilin, 2-clo-5-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin, 2-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(3,5-dimetylbenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(3-clo-2-flobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-N^1-(3-isopropylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-clophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-clophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-isopropylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-3-(4-flo-2-metylbenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-5-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin, 2-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-N^1-(4-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 3-

benzyl-2-clo-5-metylanilin, 2-clo-3-(3,5-diflo-4-metoxybenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-N^1-(3,4-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3,4-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3,5-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2,4-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(2,4-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3,5-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3,5-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 3-benzyl-5-clo-2-metylanilin, N^1-(2,4-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3,4-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2,4-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3,4-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3,5-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(3-metylpyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-3-(4-flo-3,5-dimetylbenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 5-clo-3-(2-clobenzyl)-2-metylanilin, 3-(2-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin, 2-clo-3-(2,6-diflobenzyl)-5-metylanilin, 2-clo-3-(2-clo-6-flobenzyl)-5-metylanilin, 3-(4-bromobenzyl)-2-clo-5-metylanilin, 5-clo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin, 5-flo-2-metyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clo-5-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-3-(3-clobenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-3-(3-flobenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-3-(2-flobenzyl)-2-metylanilin, 2-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril, 5-clo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin, N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(3-metylpyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(5-clo-3-metylpyridin-2-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin,

N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(5-clo-3-metylpyridin-2-yl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-3-(4-flobenzyl)-2-metylanilin, 3-(4-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin, 5-clo-3-(4-clobenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin, 5-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-2-metylanilin, 5-clo-3-(4-clo-3-flobenzyl)-2-metylanilin, 5-flo-2-metyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-3-(2-flobenzyl)-2-metylanilin, 3-(2-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin, 3-(3-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin, 5-flo-3-(3-flobenzyl)-2-metylanilin, 5-flo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 3-benzyl-5-flo-2-metylanilin, 2-clo-3-(4-metoxybenzyl)-5-metylanilin, 3-(2-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-clo-2-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin, N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-clophenyl)-2-metylbenzen-1,3-

diamin, N^1-(3-bromophenyl)-5-clo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(2-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril, 2-clo-N^1-(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin, 5-flo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin, 3-(4-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin, 3-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril, 3-(4-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)anilin, 2-clo-N^1-(2-(diflometoxy)phenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(2-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-clophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(2-(triflometyl)benzyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-clobenzyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin, 2-bromo-3-(3-flobenzyl)-5-metylanilin, 3-(3-flobenzyl)-5-metyl-2-(metylthio)anilin, 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin, 4-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril, 5-flo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylanilin, 5-flo-3-(4-flobenzyl)-2-metylanilin, 3-(3-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 3-(4-clo-3-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 3-benzyl-2,5-dimetylanilin, 2,5-dimetyl-3-(3-metylbenzyl)anilin, 2-bromo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-

1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin , 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 3-(2-bromo-4-flobenzyl)-2-clo-5-metylanilin, 3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-2-clo-5-metylanilin, 3-(4-bromo-2-flobenzyl)-2-clo-5-metylanilin, 2-clo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-5-metylanilin, 3-(2-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 3-(2-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 3-(2-bromobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 3-(4-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 3-(4-bromobenzyl)-2,5-dimetylanilin, 3-(4-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin, N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-2-clo-5-metylbenzen-1,3-diamin, 3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 3-(2-bromo-4-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-2-metylanilin, 3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 3-(2-bromo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-2-metylanilin, 5-flo-3-(3-flo-5-metylbenzyl)-2-metylanilin, 3-(4-bromo-2-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin, 5-flo-3-(3-flo-5-metoxybenzyl)-2-metylanilin, N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-2-clo-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)anilin, N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-clo-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin, 3-(3-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin, 4-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril, 5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin, 5-clo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin, 5-clo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin, 3-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril, 5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin, 5-clo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)anilin, 5-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-

3-(3-nitrobenzyl)anilin, 5-flo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin, 3-(4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin, 3-(3-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(2-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(2-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 5-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-metoxy-N^1-(2-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metoxy-2-metylbenzen-1,3-diamin, 5-metoxy-N^1-(2-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metoxy-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-metoxy-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin, N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metoxy-2-metylbenzen-1,3-diamin, 3-(3-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin, 3-(4-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)anilin, 3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 2-clo-5-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metoxy-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-metoxy-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 3-(3,4-diflobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(4-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 2-clo-N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin, 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin, 3-(3-flo-5-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 3-(2-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin, 3-amino-5-(3-flobenzyl)-4-metylbenzonitril, 3-benzyl-5-metoxy-2-metylanilin, 5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin, 5-metoxy-2-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin, 5-clo-2-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin, 2-clo-5-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin, 5-flo-2-metyl-N^1-(2-

(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin, 1-(3-amino-5-flo-2-metylphenyl)-2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)ethan-1-one, 5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin, 3-(3-amino-5-metoxy-2-metylbenzyl)benzonitril, 5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin, 3-amino-5-benzyl-4-metylbenzonitril, 3-amino-5-(3-xyanobenzyl)-4-metylbenzonitril, 3-amino-5-(4-flobenzyl)-4-metylbenzonitril, 3-amino-5-(4-clobenzyl)-4-metylbenzonitril, 3-amino-4-metyl-5-(3-nitrobenzyl)benzonitril, 3-amino-5-(3-bromobenzyl)-4-metylbenzonitril và 3-amino-4-metyl-5-(2-(triflometoxy)benzyl)benzonitril.

Có một số lượng lớn các phương pháp tiêu chuẩn thích hợp đã biết, chẳng hạn như alkyl hóa, halogen hóa, axyl hóa, amit hóa, oxime hóa, oxy hóa và khử. Việc lựa chọn phương pháp điều chế phù hợp tùy thuộc vào tính chất (khả năng phản ứng) của các nhóm thế trong chất trung gian. Các phản ứng này có thể được thực hiện một cách thuận lợi trong dung môi. Các phản ứng này có thể được thực hiện một cách thuận lợi ở nhiều nhiệt độ khác nhau. Các phản ứng này có thể được thực hiện một cách thuận lợi trong môi trường trơ. Các chất phản ứng có thể phản ứng khi có bazơ.

Các chất phản ứng có thể phản ứng với nhau, tức là không cần thêm dung môi hoặc chất pha loãng. Tuy nhiên, trong hầu hết các trường hợp, sẽ có lợi nếu thêm dung môi trơ hoặc chất pha loãng hoặc hỗn hợp của những chất này. Nếu phản ứng được thực hiện khi có mặt của bazơ, thì các bazơ dư, chẳng hạn như trietylamin, pyridin, N-metylmorpholin hoặc N, N-dietylanilin, cũng có thể hoạt động như dung môi hoặc chất pha loãng. Phản ứng được thực hiện một cách thuận lợi trong phạm vi nhiệt độ từ khoảng -80°C đến khoảng +140°C, tốt hơn là từ khoảng -30°C đến khoảng +100°C, trong nhiều trường hợp trong phạm vi giữa nhiệt độ môi trường xung quanh và khoảng +80°C.

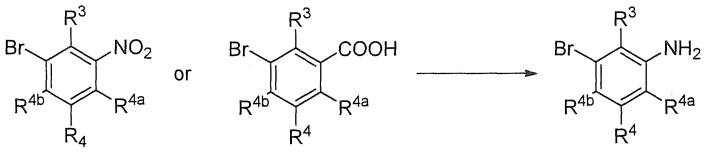
Một hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển đổi theo cách đã biết thành một hợp chất khác có công thức (I) bằng cách thay thế một hoặc nhiều nhóm thế của hợp chất ban đầu có công thức (I) theo cách thông thường bằng một/các nhóm thế khác theo sáng chế. Tùy thuộc vào việc lựa chọn các điều kiện phản ứng và nguyên liệu ban đầu phù hợp trong từng

trường hợp, ví dụ, trong một bước phản ứng chỉ có thể thay thế một nhóm thế bằng một nhóm thế khác theo sáng chế, hoặc có thể thay thế nhiều nhóm thế bằng các nhóm thế khác theo sáng chế trong cùng một bước phản ứng. Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế theo cách đã biết. Do đó, ví dụ, muối thêm axit của các hợp chất có công thức (I) thu được bằng cách xử lý với một axit thích hợp hoặc thuốc thử trao đổi ion thích hợp và các muối với bazơ thu được bằng cách xử lý với một bazơ thích hợp hoặc với một thuốc thử trao đổi ion thích hợp. Muối được chọn tùy thuộc vào khả năng chống chịu của nó đối với việc sử dụng hợp chất, chẳng hạn như khả năng chống chịu trong nông nghiệp hoặc sinh lý. Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển đổi theo cách thông thường thành các hợp chất tự do (I), muối thêm axit, ví dụ, bằng cách xử lý với một hợp chất bazơ thích hợp hoặc bằng một thuốc thử trao đổi ion thích hợp và các muối với bazơ, ví dụ, bằng cách xử lý với một axit thích hợp hoặc bằng một thuốc thử trao đổi ion thích hợp. Muối của các hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển đổi theo cách đã biết thành các muối khác của hợp chất có công thức (I), muối thêm axit, ví dụ, thành muối thêm axit khác, ví dụ bằng cách xử lý một muối của axit vô cơ như hydrochlorit bằng một muối kim loại thích hợp như natri, bari hoặc muối bạc, của một axit, ví dụ với bạc axetat, trong dung môi thích hợp, trong đó muối vô cơ tạo thành, ví dụ bạc clorua, không hòa tan và do đó kết tủa từ hỗn hợp phản ứng.

Theo một phương án, sáng chế này đề xuất một quy trình điều chế các hợp chất có công thức (I).

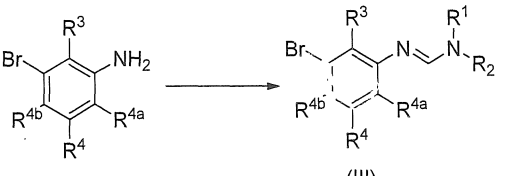
Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất một quy trình điều chế hợp chất phenylamidin có nhóm thế ở vị trí số 3 có công thức (I), trong đó quy trình này gồm có ít nhất một trong các bước sau từ (a) đến (h):

a) chuyển đổi hợp chất có công thức (XXVI) hoặc (XXIV) thành hợp chất có công thức (XXIII) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



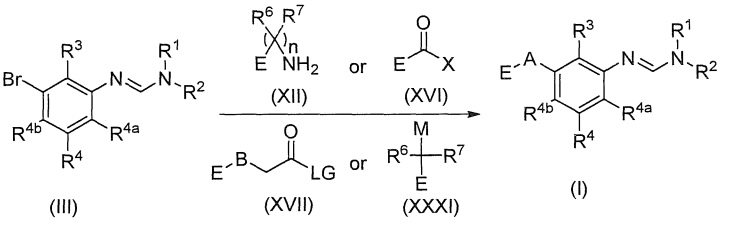
(XXVI) (XXIV) (XXIII)

b) cho một hợp chất có công thức (XXIII) phản ứng với một amin bậc hai thích hợp (HNR^1R^2) để thu được một hợp chất có công thức (III) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



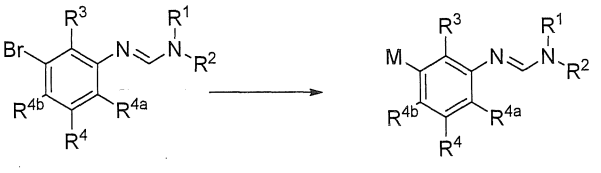
(XXIII) (III)

c) cho hợp chất có công thức (III) phản ứng với hợp chất có công thức (XII), (XVI), (XVII) hoặc (XXXI) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:



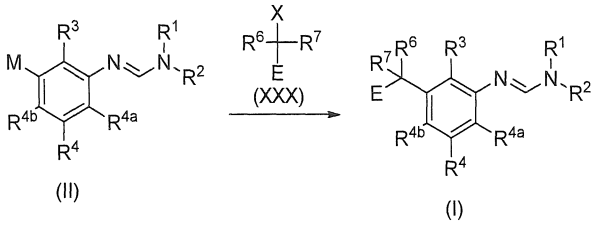
(III) (XII) (XVI) (XVII) (XXXI) (I)

d) chuyển đổi hợp chất có công thức (III) thành hợp chất có công thức (II) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:

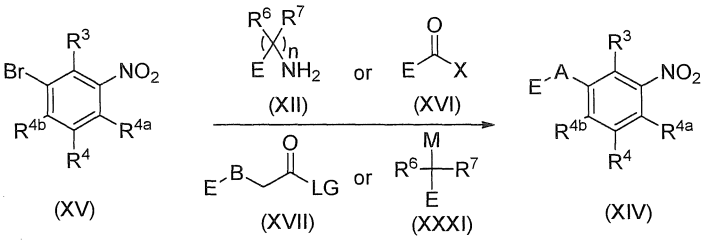


(III) (II)

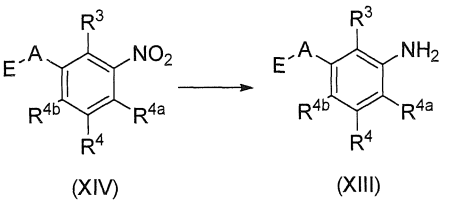
e) cho hợp chất có công thức (II) phản ứng với hợp chất có công thức (XXX) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:



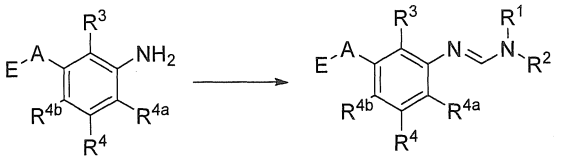
f) cho hợp chất có công thức (XV) phản ứng với hợp chất có công thức (XII), (XVI), (XVII) hoặc (XXXI) để thu được hợp chất có công thức (XIV) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:



g) chuyển đổi hợp chất có công thức (XIV) thành hợp chất có công thức (XIII) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



h) cho hợp chất có công thức (XIII) phản ứng với một amin bậc hai thích hợp (HNR^1R^2) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:

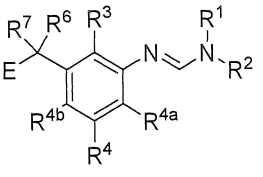


(XIII) (I)

trong đó trong các sơ đồ trên, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, A, X và E có cùng ý nghĩa như đã định nghĩa ở trên và M được chọn từ nhóm gồm có dẫn xuất liti, este boronic, axit boronic, MgX và ZnX.

Các hợp chất theo sáng chế được xác định theo công thức chung (I) và/hoặc trong Bảng I có thể được điều chế, theo cách đã biết, theo nhiều cách khác nhau như được mô tả trong các lược đồ 1-21:

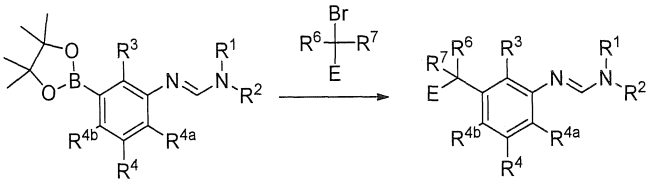
A. Tổng hợp dẫn xuất amidin vòng cầu C:



Ia

Theo một trong các phương án theo sáng chế, arylamidin có công thức (Ia), trong đó R^1 đến R^7 như được định nghĩa trong sáng chế có thể thu được bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong các lược đồ 1-8 sau đây.

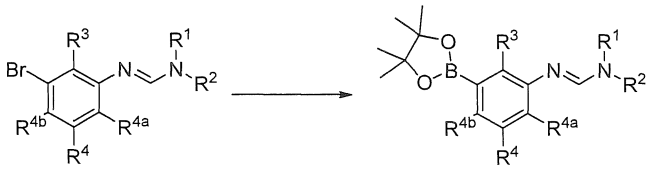
Lược đồ-1



(II) **(Ia)**

Amidin vòng cầu C có công thức (Ia), có thể thu được bằng cách ghép chéo, có xúc tác paladi, các dẫn xuất este boronat tương ứng có công thức (II) với các aryl halit thích hợp khi có mặt một bazơ như kali cacbonat hoặc natri bicacbonat theo quy trình tương tự được công bố trong giải pháp kỹ thuật đã biết WO2018069841 như trong lược đồ 1.

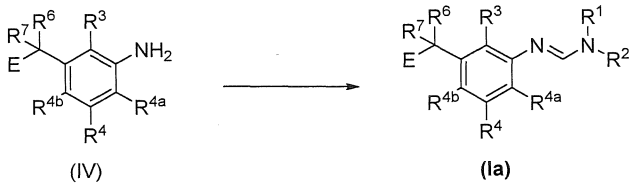
Lược đồ-2



Este boronat của dẫn xuất amidin có công thức (II) là một chất trung gian quan trọng và có thể thu được (Lược đồ-2) từ các dẫn xuất halogen tương ứng của amidin có công thức (III) bằng cách sử dụng bispinacolato diborane với sự có mặt của chất xúc tác paladi, theo phương pháp boryl hóa miyaura như được công bố trong *J. Org. Chem.*, 1995, *60*, 7508-7510.

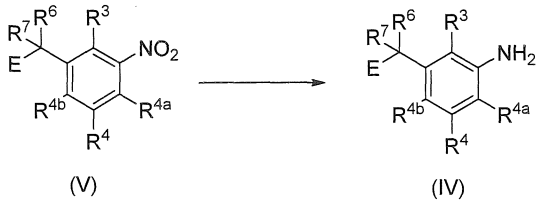
Arylamidin có công thức (Ia) trong đó R^1-R^7 được định nghĩa ở trên trong sáng chế này cũng có thể thu được từng bước bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong lược đồ 3-8 sau đây.

Lược đồ: 3



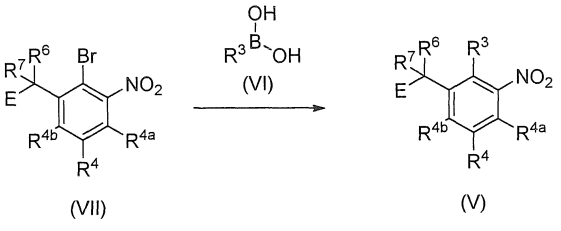
Amidin vòng cầu C có công thức (Ia), có thể thu được bằng cách xử lý các dẫn xuất anilin tương ứng có công thức (IV) bằng N-(dimetoxymetyl)-N-metylethanamin trong 1,4-dioxan sử dụng một lượng xúc tác là axit *p*-toluenesulphonic khan theo quy trình tương tự được công bố trong US20110130282.

Lược đồ: 4



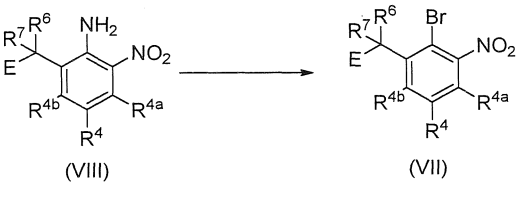
Dẫn xuất anilin có công thức (IV) có thể thu được bằng cách khử chất trung gian nitro tương ứng có công thức (V) bằng cách sử dụng các phương pháp khử khác nhau được công bố trong tài liệu, ví dụ bột sắt với sự có mặt của amoni clorua ngậm nước hoặc hydro hóa với sự có mặt của Pd/C, theo quy trình tương tự được công bố trong US20061948 01A1.

Lược đồ: 5



Hợp chất có công thức (V), trong đó R^3 tốt nhất là các nhóm alkyl; có thể thu được bằng cách ghép chéo, có xúc tác paladi, axit boronic alkyl tương ứng có công thức (VI) với dẫn xuất bromo có công thức (VII) với sự có mặt của một bazơ, ví dụ như kali cacbonat hoặc kali photphat theo quy trình tương tự được công bố trong US2017355679A1.

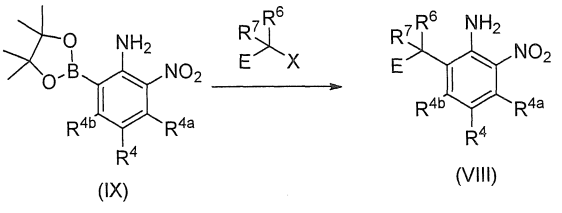
Lược đồ: 6



Các dẫn xuất halogen tương ứng của công thức (VII) có thể thu được bằng phản ứng Sandmeyer của các dẫn xuất anilin tương ứng có công thức (VIII) theo quy trình tương tự

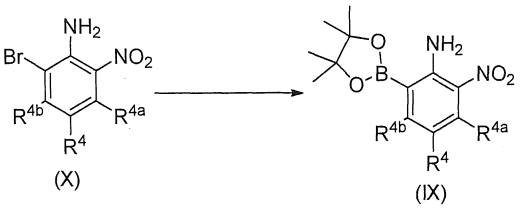
được công bố trong *J. Org. Chem.*, 1980, 45, 2570-2575, Cách tiếp cận này mang đến các cơ hội chức năng hóa khác nhau tại vị trí này bằng cách chuyển đổi nhóm amino tương ứng thành các halogen khác nhau, nitril, hydroxy, triflometyl, v.v., như được công bố trong *J. Florin Chem.,* 2001, *107*, 31-34 và *Synthesis*, 2007, 81-84.

Lược đồ: 7



Dẫn xuất vòng cầu C có công thức (VIII) có thể thu được từ chất trung gian este boronat có công thức (IX) theo phản ứng ghép cặp suzuki với các benzyl, hetero aryl hoặc alkyl bromit khác nhau với sự có mặt của chất xúc tác paladi theo quy trình tương tự được công bố trong WO2018069841.

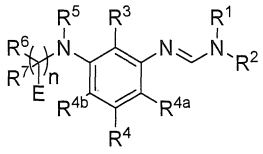
Lược đồ: 8



Dẫn xuất este boronat có công thức (IX) có thể thu được từ dẫn xuất bromo tương ứng có sẵn trên thị trường có công thức (X) bằng cách sử dụng bispinacolato diboran với sự có mặt của chất xúc tác paladi theo phản ứng boryl hóa miyaura sử dụng bazơ thích hợp như được công bố trong WO 2016210234.

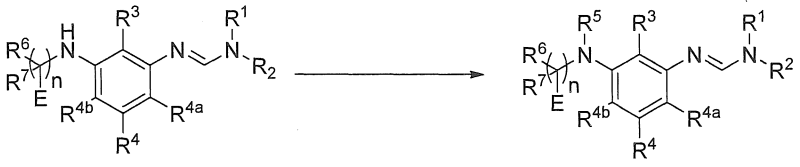
B. Tổng hợp dẫn xuất amidin vòng cầu N có công thức (Ib và Ic):

Theo một trong các phương án theo sáng chế, arylamidin có công thức (Ib), trong đó R^1-R^7 như được định nghĩa ở trên trong công bố này có thể thu được bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong lược đồ 9-10 sau đây.



n=0 (Ib); n=1 (Ic)

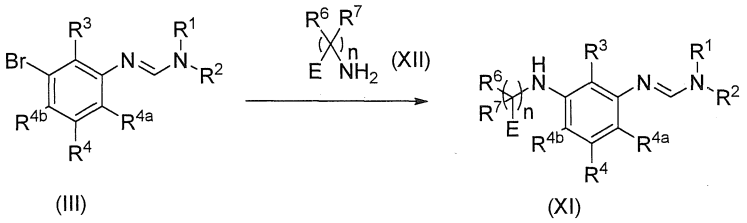
Lược đồ: 9



(XI) (Ib, Ic)

Amidin vòng cầu N có công thức (Ib), có thể thu được bằng cách N-alkyl hóa dẫn xuất amidin có công thức (XI) với sự có mặt của bazơ thích hợp và ankyl halit phù hợp, trong đó R^5 được định nghĩa ở trên trong công bố này, theo quy trình tương tự được công bố trong WO2018069842.

Lược đồ: 10

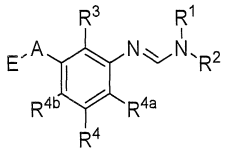


(III) (XI)

Dẫn xuất amidin có công thức (XI) được điều chế bằng cách ghép chéo với xúc tác paladi dẫn xuất amin tương ứng có công thức (XII) với sự có mặt của bazơ thích hợp theo phản ứng ghép cặp Buchwald-Hartwig như được công bố trong *J. Med. Chem*, 2012, *55*,19, 8538-48 và *J. Org. Chem.*, 2010, *75*, 19, 6477-88.

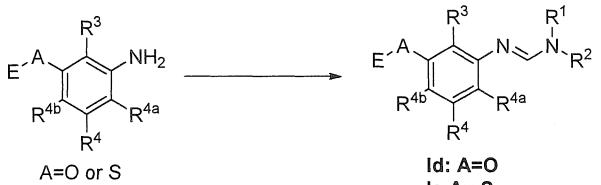
C. Tổng hợp dẫn xuất amidin vòng cầu O và S có công thức (Id và Ie)

Theo một trong các phương án theo sáng chế, arylamidin có công thức (Id và Ie), trong đó R^1-R^7 như được định nghĩa ở trên trong công bố này có thể thu được bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong lược đồ 11-13 sau đây.



Id: A=O, Ie A= S

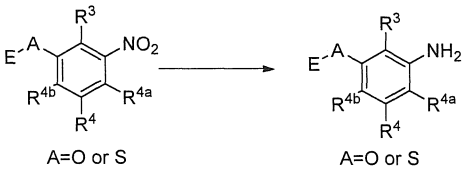
Lược đồ: 11



A=O or S (XIII) → **Id: A=O** **Ie A= S**

Theo một phương án, hợp chất có công thức (Id và Ie) có thể được điều chế bằng cách xử lý các dẫn xuất anilin tương ứng có công thức (XIII) với trimetyl orthoformat dư sử dụng xúc tác là axit *p*-toluenesulphonic (lược đồ 11). Chất trung gian tạo thành được đun nóng với amin bậc hai (HNR^1R^2) trong dioxan để thu được các dẫn xuất amidin mong muốn theo quy trình tương tự như được công bố trong US20110130282.

Lược đồ: 12

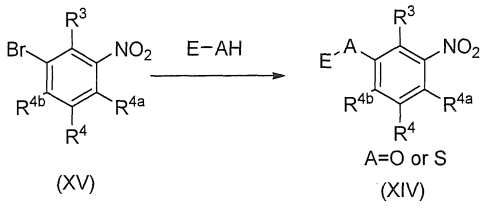


A=O or S (XIV) → A=O or S (XIII)

Dẫn xuất amin có công thức (XIII) là một chất trung gian chính được điều chế bằng cách khử chất trung gian nitro có công thức (XIV) bằng cách sử dụng sắt và amoni clorua ngậm

nước hoặc thiếc (II) clorua trong axit hydrochloric trong dung môi và nhiệt độ thích hợp theo quy trình tương tự như được công bố trong US2006194801A1.

Lược đồ 13:

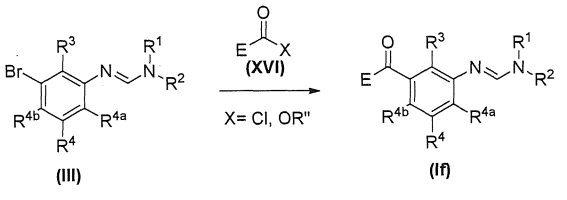


Dẫn xuất nitro có công thức (XIV) là một chất trung gian quan trọng và có thể được điều chế bằng phản ứng ghép cặp của dẫn xuất halo có công thức (XV) và các phenol hoặc thiophenol được thế tương ứng bằng cách sử dụng thuốc thử đồng (I) và dung môi thích hợp theo quy trình tương tự được công bố trong WO2018069842.

D. Tổng hợp dẫn xuất amidin vòng cầu Cacbonyl của Loại (If)

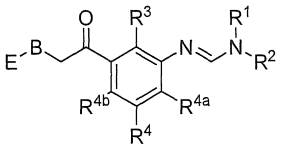
Theo một trong các phương án theo sáng chế, dẫn xuất formamidin có công thức (If) có thể thu được bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong lược đồ 14 sau đây.

Lược đồ: 14



Dẫn xuất amidin có công thức (If) được điều chế bằng phản ứng axyl hóa sử dụng trao đổi halogen kim loại của các hợp chất có công thức (III) với sự có mặt của các thuốc thử được xử lý bằng liti grignard thích hợp, sau đó xử lý với dẫn xuất amit tương ứng của este hoặc wienreb có công thức (XVI) và theo quy trình tương tự như được công bố trong *Angew.Chem. Int. Ed.*, 56(43), 13319-13323 và *J. Org. Chem.*, 67(11), 3585-3594; 2002.

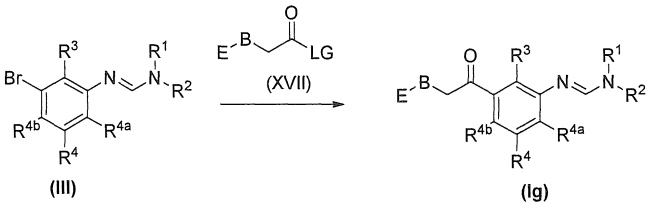
E. Tổng hợp dẫn xuất amidin vòng cầu cacbonyl metyl có công thức (Ig)



(Ig)

Theo một trong các phương án theo sáng chế, dẫn xuất amidin có công thức (Ig), trong đó R^1-R^7 như được định nghĩa ở trên trong công bố này, trong đó B là O, S, N, có thể thu được theo quy trình được mô tả trong lược đồ 15 sau đây.

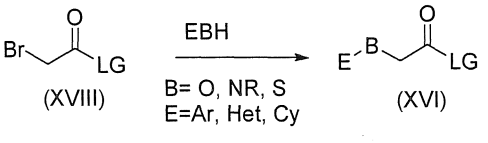
Lược đồ: 15



(III) (Ig)

Dẫn xuất amidin có công thức (Ig) được điều chế bằng sử dụng trao đổi halogen kim loại của các hợp chất có công thức (III) với sự có mặt của các thuốc thử được xử lý bằng liti grignard thích hợp, sau đó xử lý với dẫn xuất amit tương ứng của este hoặc wienreb có công thức (XVI) và theo quy trình tương tự như được công bố trong *Chem. Pharma. Bull.*, 2001, 49(2), 173-182, WO 2012029942 và *Eur. J. Med. Chem.*, 2013, 69, 244 – 261.

Lược đồ: 16



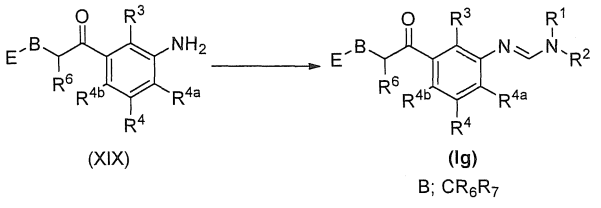
(XVIII) (XVI)

Chất trung gian chính có công thức (XVI) được điều chế bằng phản ứng alkyl hóa sử dụng etyl bromo axetat với các phenol, thiophenol và anilin tương ứng với sự có mặt của bazơ thích hợp theo quy trình tương tự như đã công bố ở *Tet. Lett.*, 2012, 53, 15, 2001–2004 và

J.Med.Chem., 2012, 55, 1, 515 – 527.

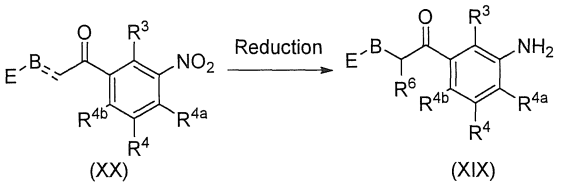
Theo một trong các phương án theo sáng chế, các arylamidin có công thức (Ig) trong đó R^1-R^7 được định nghĩa ở trên trong công bố này, và B là CR^6R^7 có thể thu được bằng một quy trình được mô tả trong lược đồ 17-20 sau đây.

Lược đồ: 17



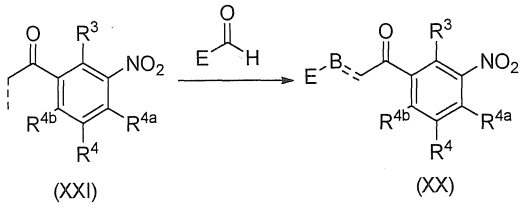
Hợp chất có công thức (Ig) có thể được điều chế bằng cách xử lý các dẫn xuất anilin tương ứng có công thức (XIX) với trimetyl orthoformat dư sử dụng xúc tác là axit *p*-toluenesulphonic (lược đồ 17). Chất trung gian tạo thành được đun nóng với amin bậc hai (HNR^1R^2) trong dioxan để thu được hợp chất có công thức (Ig) theo quy trình tương tự như được công bố trong US20110130282.

Lược đồ: 18



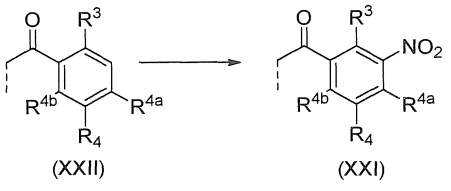
Dẫn xuất amin có công thức (XIX) là một chất trung gian chính được điều chế bằng cách khử chất trung gian nitro có công thức (XX) bằng cách sử dụng sắt và amoni clorua ngậm nước hoặc thiếc (II) clorua trong axit hydrochloric trong dung môi và nhiệt độ thích hợp theo quy trình tương tự như được công bố trong US2006194801A1.

Lược đồ: 19



Chất trung gian nitro có công thức (XX) có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ aldol của chất trung gian keton có công thức (XXI) với các dẫn xuất andehit/keton tương ứng với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ natri hoặc kali hydroxit ngậm nước theo quy trình tương tự như được công bố trong *Tổng hợp*, 1980, 8, 647 - 650.

Lược đồ: 20

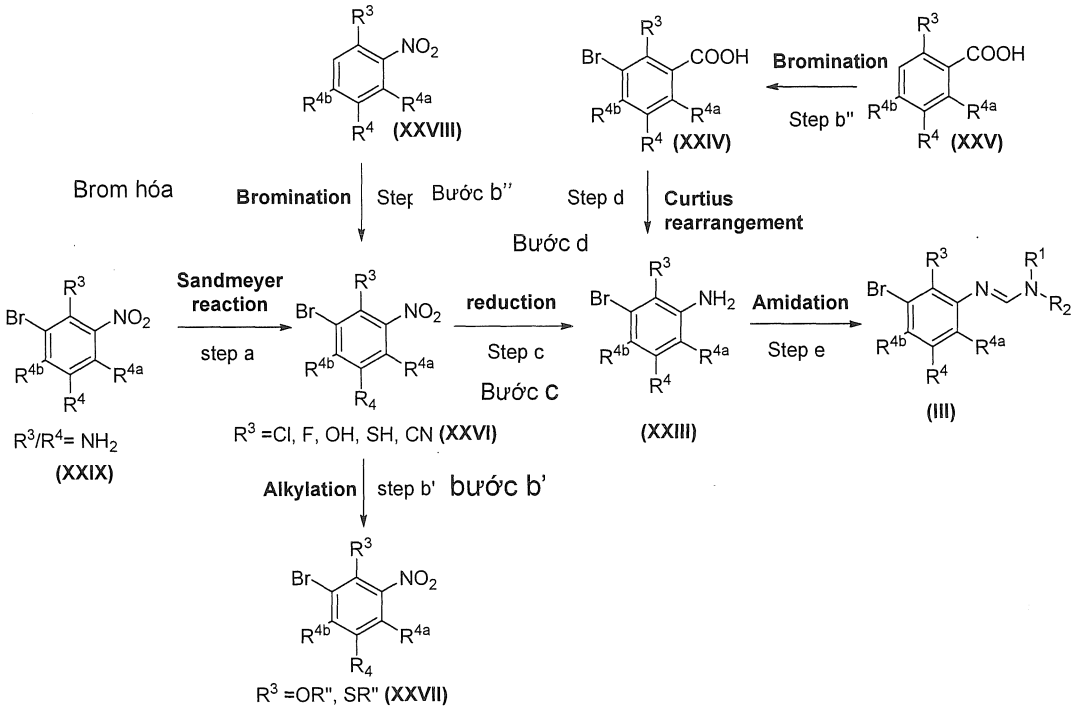


Chất trung gian nitro có công thức (XXI) có thể được điều chế bằng cách nitro hóa axetophenon tương ứng có sẵn trên thị trường theo quy trình tương tự được công bố trong *J.Org. Chem.*, 1986, 51, 3439 – 3446.

F. Tổng hợp dẫn xuất 3-bromoamidin có công thức (III):

Theo một trong các phương án theo sáng chế, một arylamidin trung gian chính quan trọng có công thức (III), trong đó R^1-R^4 như được định nghĩa ở trên trong công bố này có thể thu được bằng cách sử dụng quy trình được mô tả trong lược đồ 21 sau đây.

Lược đồ: 21



Hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế bằng cách xử lý các dẫn xuất anilin tương ứng có công thức (XXIII) với trimetyl orthoformat dư sử dụng xúc tác là axit *p*-toluenesulphonic (lược đồ 21, bước e). Chất trung gian tạo thành được đun nóng với amin bậc hai (HNR^1R^2) trong dioxan để thu được hợp chất có công thức (III) theo quy trình tương tự như được công bố trong US20110130282.

Chất trung gian anilin có công thức (XXIII) có thể được thu được bằng một trong các phương pháp như được mô tả trong lược đồ 21.

Theo một phương án, chất trung gian anilin có công thức (XXIII) thu được từ axit 3-bromobenzoic được thế tương ứng có công thức (XXIV) bằng phản ứng hoán vị curtius (lược đồ 21, bước-d) với sự có mặt của azit diphenylphosphoryl, sau đó được xử lý bằng axit theo quy trình tương tự như được công bố trong *J. Am. Chem. Soc.,* 2005, 127, 16408 và *Org. Lett.,* 2012, 14, 608-611. Chất trung gian axit 3-bromobenzoic có công thức (XXIV) có thể thu được bằng cách brom hóa (lược đồ 21, bước b") axit 2,5-benzoic không được thế có sẵn trên thị trường (XXV) theo phương pháp trong tài liệu được công bố trong *J.Org. Chem.*, 2013, 78, 2589-2599.

Các chất trung gian anilin có công thức (XXIII) (Lược đồ 21, Bước c) thu được một cách khác từ chất trung gian nitro có công thức (XXVI) bằng cách khử chức năng nitro tương ứng của công thức (XXVI) với sự có mặt của chất khử thích hợp, ví dụ như sắt và amoni clorua ngậm nước hoặc thiếc (II) clorua trong axit hydrohloric trong dung môi thích hợp theo quy trình tương tự như được công bố trong US2006194801 A1 và *J. Am. Chem. Soc.*, 2003, 125, 40, 12074 - 12075.

Chất trung gian nitro có công thức (XXVI) có thể thu được một cách khác từ chất trung gian nitroanilin có sẵn trên thị trường có công thức (XXIX) bằng phản ứng Sandmeyer (lược đồ 21, bước a) sau đó là sự thay thế gốc-neuclophilic như được công bố trong tài liệu *JOC*, 1980, 45, 2570-2575; *Synlett*, 2012, 23, 13, 1893 – 1896 và *Org Pro Res và Dev*, 2003, 7, 5, p. 762 – 768.

Chất trung gian nitro có công thức (XXVI) trong đó nhóm R^3/R^4 tốt nhất là OH, SH có thể được alkyl hóa bằng chất alkyl hóa thích hợp (lược đồ 21, bước b') để cung cấp các chất trung gian nitro có công thức (XXVII) với nhóm R" thích hợp.

Chất trung gian nitro có công thức (XXVI) có thể thu được bằng cách khác từ chất trung gian nitrobenzen có sẵn trên thị trường có công thức (XXVIII) bằng phản ứng brom hóa (lược đồ 21, bước b") để cung cấp dẫn xuất nitrobenzen 3-bromo và nhóm thế ở vị trí 2 và 5 (3-bromo 2,5-disubstituted nitrobenzen) như được công bố trong phương pháp trong tài liệu *Chem Comm.* 2012, 48, 3442-3444; *Bio. Org. Med.* Chem 2014, 22, 1156-1162.

Theo một phương án, sáng chế này đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, để kiểm soát và/hoặc ngăn chặn nấm gây bệnh cho cây trồng đối với cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn.

Theo một phương án khác, sáng chế này đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng để kiểm soát bệnh rỉ trên cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn.

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế này đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, mà đặc biệt thích hợp để kiểm soát và/hoặc phòng ngừa bệnh trên các cây nông nghiệp như ngũ cốc, ngô, đậu tương và các cây họ đậu khác; quả và cây ăn quả; các loại hạt và cây cho hạt; giống cam quýt và cây thuộc giống cam quýt; bất kỳ cây trồng tại vườn nào; thực vật có dầu; cà phê, trà, và các loại rau khác, và cây cảnh.

Theo phương án được ưu tiên hơn, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để điều trị một số loại nấm gây bệnh. Các ví dụ không giới hạn về mầm bệnh nấm có thể được điều trị theo sáng chế bao gồm:

các bệnh do mầm bệnh phấn trắng, ví dụ loài *Blumeria*, ví dụ *Blumeria graminis*; loài *Podosphaera*, ví dụ *Podosphaera leucotricha*; loài *Sphaerotheca*, ví dụ *Sphaerotheca fuliginea*; loài *Uncinula*, ví dụ *Uncinula necator*; loài *Erysiphe*, ví dụ *Erysiphe cichoracearu*;

các bệnh do mầm bệnh rỉ, chẳng hạn như loài *Gymnosporangium*, ví dụ *Gymnosporangium sabinae*; loài *Hemileia*, ví dụ *Hemileia vastatrix*; loài *Phakopsora*, ví dụ *Phakopsora pachyrhizi* hoặc *Phakopsora meibomiae*; loài *Puccinia*, ví dụ *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* hoặc *Puccinia striiformis, và Puccinia melanocephala*; loài *Uromyces*, ví dụ *Uromyces appendiculatus*;

Trong đó, Cronartium ribicola (bệnh rỉ thông trắng); *Gymnosporangium juniperi-virginianae* (bệnh rỉ tuyết tùng); *Hemileia vastatrix* (bệnh rỉ cà phê); *Phakopsora meibomiae* và *P. pachyrhizi* (bệnh rỉ đậu tương); *Puccinia coronata* (bệnh rỉ trên lúa mạch đen và yến mạch); *Puccinia graminis* (bệnh rỉ lúa mì và cỏ xanh Kentucky, hoặc đốm đen của ngũ cốc); *Puccinia hemerocallidis* (bệnh rỉ hoa hiên); *Puccinia persistens subsp. triticina* (bệnh rỉ lúa mì hoặc 'rỉ nâu hoặc rỉ đỏ'); *Puccinia sorghi* (bệnh rỉ ở ngô); *Puccinia striiformis* ('bệnh rỉ vàng' trong ngũ cốc); *Puccinia melanocephala*; *Uromyces appendiculatus* (bệnh rỉ ở đậu); *Uromyces phaseoli* (bệnh rỉ đậu); *Puccinia melhanocephala* ('bệnh rỉ nâu' ở cây mía); *Puccinia kuehnii* ('bệnh rỉ cam' ở cây mía).

bệnh do mầm bệnh từ nhóm Oomycetes, chẳng hạn như loài *Albugo*, ví dụ *Albugo candida*; loài *Bremia*, ví dụ *Bremia lactucae*; loài *Peronospora*, ví dụ *Peronospora pisi* hoặc *P. brassicae*; loài *Phytophthora*, ví dụ *Phytophthora infestans*; loài *Plasmopara*, ví dụ *Plasmopara viticola*; loài *Pseudoperonospora*, ví dụ *Pseudoperonospora humuli* hoặc *Pseudoperonospora cubensis*; loài *Pythium*, ví dụ *Pythium ultimum*;

các bệnh đốm lá và bệnh héo lá do, chẳng hạn như loài *Alternaria*, ví dụ *Alternaria solani*; loài *Cercospora*, ví dụ *Cercospora beticola*; loài *Cladiosporium*, ví dụ *Cladiosporium cucumerinum*; loài *Cochliobolus*, ví dụ *Cochliobolus sativus* (dạng bào tử dính: Drechslera, syn: Helminthosporium) hoặc *Cochliobolus miyabeanus*; các loài *Colletotrichum*, ví dụ *Colletotrichum lindemuthanium, Colletotrichum capsici*; loài *Cycloconium*, ví dụ *Cycloconium oleaginum*; loài *Diaporthe*, ví dụ *Diaporthe citri*; loài *Elsinoe*, ví dụ *Elsinoe fawcettii*; loài *Gloeosporium*, ví dụ *Gloeosporium laeticolor*; loài *Glomerella*, ví dụ *Glomerella cingulata*; loài *Guignardia*, ví dụ *Guignardia bidwelli*; loài *Leptosphaeria*, ví dụ *Leptosphaeria maculans*; loài *Magnaporthe*, ví dụ *Magnaporthe grisea*; loài *Microdochium*, ví dụ *Microdochium nivale*; loài *Mycosphaerella*, ví dụ *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* hoặc *Mycosphaerella fijiensis*; loài *Phaeosphaeria*, ví dụ *Phaeosphaeria nodorum;* các loài *Pyrenophora*, ví dụ *Pyrenophora teres* hoặc *Pyrenophora tritici repentis*; loài *Ramularia*, ví dụ *Ramularia collo-cygni* hoặc *Ramularia areola*; loài *Rhynchosporium*, ví dụ *Rhynchosporium secalis*; loài *Septoria*, ví dụ *Septoria apii*, *Septoria tritici* hoặc *Septoria lycopersici*; loài *Stagonospora*, ví dụ *Stagonospora nodorum*; loài *Typhula*, ví dụ *Typhula incarnata*; loài *Venturia*, ví dụ *Venturia inaequalis*;

các bệnh ở rễ và thân do, chẳng hạn như loài *Corticium*, ví dụ *Corticium graminearum*; loài *Fusarium*, ví dụ *Fusarium oxysporum*; loài *Gaeumannomyces*, ví dụ *Gaeumannomyces graminis*; loài *Plasmodiophora*, ví dụ *Plasmodiophora brassicae*; loài *Rhizoctonia*, ví dụ *Rhizoctonia solani*; loài *Sarocladium*, ví dụ *Sarocladium oryzae*; loài *Sclerotium*, ví dụ *Sclerotium oryzae*; loài *Tapesia*, ví dụ *Tapesia acuformis*; loài *Thielaviopsis*, ví dụ *Thielaviopsis basicola*; loài *Ganoderma*, ví dụ *Ganoderma lucidum*;

các bệnh về bông và hoa (bao gồm cả lõi ngô) gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Alternaria*, ví dụ *Alternaria spp.*; loài *Aspergillus*, ví dụ *Aspergillus flavus*; loài *Cladosporium*, ví dụ *Cladosporium cladosporioides*; loài *Claviceps*, ví dụ *Claviceps purpurea*; loài *Fusarium*, ví dụ *Fusarium culmorum*; loài *Gibberella*, ví dụ *Gibberella zeae*; loài *Monographella*, ví dụ *Monographella nivalis*; loài *Stagnospora*, ví dụ *Stagnospora nodorum*;

bệnh do nấm than, chẳng hạn như loài *Sphacelotheca*, ví dụ *Sphacelotheca reiliana*; loài *Tilletia*, ví dụ *Tilletia caries* hoặc *Tilletia controversa*; loài *Urocysti*s, ví dụ *Urocystis occulta*; loài *Ustilago*, ví dụ *Ustilago nuda*;

bệnh thối quả gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Aspergillus*, ví dụ *Aspergillus flavus*; loài *Botrytis*, ví dụ *Botrytis cinerea*; loài *Penicillium*, ví dụ *Penicillium expansum* hoặc *Penicillium purpurogenum*; loài *Rhizopus*, ví dụ *Rhizopus stolonifer*; loài *Sclerotinia*, ví dụ *Sclerotinia sclerotiorum*; loài *Verticilium*, ví dụ *Verticilium alboatrum*;

các bệnh thối và héo do hạt và đất, và cả các bệnh của cây con gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Alternaria*, ví dụ *Alternaria brassicicola*; loài *Aphanomyces*, ví dụ *Aphanomyces euteiches*; loài *Ascochyta*, ví dụ *Ascochyta lentis*; loài *Aspergillus*, ví dụ *Aspergillus flavus*; loài *Cladosporium*, ví dụ *Cladosporium herbarum*; loài *Cochliobolus*, ví dụ *Cochliobolus sativus* (dạng bào tử dính: Drechslera, Bipolaris Syn: Helminthosporium); *loài Colletotrichum*, ví dụ *Colletotrichum coccodes*; loài *Fusarium*, ví dụ *Fusarium culmorum*; *loài Gibberella*, ví dụ *Gibberella zeae*; loài*Macrophomina*, ví dụ *Macrophomina phaseolina*; *loài Microdochium*, ví dụ *Microdochium nivale*; *loài Monographella*, ví dụ *Monographella nivalis*; *loài Penicillium* , ví dụ *Penicillium expansum*; *loài Phoma*, ví dụ *Phoma lingam*; *loài Phomopsis*, ví dụ *Phomopsis sojae*; *loài Phytophthora*, ví dụ *Phytophthora cactorum*; *loài Pyrenophora*, ví dụ *Pyrenophora graminea*; *loài Pyricularia*, ví dụ *Pyricularia oryzae*; *loài Pythium* , ví dụ *Pythium ultimum*; *loài Rhizoctonia*, ví dụ *Rhizoctonia solani*; *loài Rhizopus*, ví dụ *Rhizopus oryzae*; *loài Sclerotiu*m, ví dụ *Sclerotium rolfsii*; *loài Septoria*, ví dụ *Septoria nodorum*; *loài Typhula*, ví dụ *Typhula incarnata*; *loài Verticillium* , ví dụ *Verticillium dahliae*;

ung thư, mụn cây và bệnh chổi rồng gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Nectria*, ví dụ *Nectria galligena*;

bệnh héo gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Monilinia*, ví dụ *Monilinia laxa*;

các biến dạng của lá, hoa và quả gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Exobasidium*, ví dụ *Exobasidium vexans*; loài *Taphrina*, ví dụ *Taphrina deformans*;

bệnh thoái hóa ở cây thân gỗ gây ra bởi, chẳng hạn như, các loài *Esca*, ví dụ *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* hoặc *Fomitiporia mediterranea*; loài *Ganoderma*, ví dụ *Ganoderma boninense*;

các bệnh trên hoa và hạt gây ra bởi, chẳng hạn như, loài Botrytis, ví dụ *Botrytis cinerea*;

bệnh hại củ cây trồng gây ra bởi, chẳng hạn như, loài *Rhizoctonia*, ví dụ *Rhizoctonia solani*; loài *Helminthosporium*, ví dụ *Helminthosporium solani*;

bệnh do vi khuẩn gây bệnh, chẳng hạn như loài *Xanthomonas*, ví dụ *Xanthomonas campestris pv. oryzae*; loài *Pseudomonas*, ví dụ *Pseudomonas syringae pv. lachrymans*; loài *Erwinia*, ví dụ *Erwinia amylovora*; loài *Ralstonia*, ví dụ *Ralstonia solanacearum*.

Bệnh nấm trên rễ và gốc thân gây ra bởi, chẳng hạn như, thối đen rễ (*Calonectria crotalariae*), thối đen thân và gốc (*Macrophomina phaseolina*), bệnh bạc lá fusarium hoặc héo, bệnh thối rễ và bệnh thối vỏ và thân (*Fusarium oxysporum, Fusarium orthoceras, Fusarium semitectum, Fusarium equiseti*), thối rễ mycoleptodiscus (*Mycoleptodiscus terrestris*), neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), bệnh bạc vỏ và thân (*Diaporthe phaseolorum*), bệnh thối gốc (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*), bệnh thối phytophthora (*Phytophthora megasperma*), thối gốc nâu (*Phialophora gregata*), bệnh thối pythium (*Pythium aphanidermatum, Pythium irregulare, Pythium debaryanum, Pythium myriotylum, Pythium ultimum*), bệnh thối rễ rhizoctonia, bệnh héo cây con (*Rhizoctonia solani*), bệnh thối gốc sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), bệnh bạc lá sclerotinia phía Nam (*Sclerotinia rolfsii*), thối rễ thielaviopsis (*Thielaviopsis basicola*).

Các loại cây có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm những loại sau: Các loài Rosaceae (ví dụ như các loại quả lựu như táo, lê, mơ, anh đào, hạnh nhân và đào), *loài Ribesioidae* , *loài Juglandaceae*, *loài Betulaceae*, *loài Anacardiaceae*, *loài Fagaceae*, *loài Moraceae*, *loài Oleaceae*, *loài Actinidaceae*, *loài Lauraceae*, *loài Musaceae* (ví dụ cây chuối và đồn điền), *loài Rubiaceae* (ví dụ cà phê), *loài Theaceae*, *loài Sterculiceae*, *loài Rutaceae* (ví dụ chanh, cam và bưởi); *loài Vitaceae* (ví dụ nho); *loài Solanaceae* (ví dụ cà chua, ớt), *loài Liliaceae*, *loài Asteraceae* (ví dụ rau diếp), *loài Umbelliferae* , *loài Cruciferae*, *loài Chenopodiaceae*, *loài Cucurbitaceae* (ví dụ dưa chuột), *loài Alliaceae* (ví dụ tỏi tây, hành tây), *loài Papgroupaceae* (ví dụ đậu Hà Lan); cây trồng chính, chẳng hạn như *Poaceae/loài Gramineae* (ví dụ ngô, cỏ, ngũ cốc như lúa mì, lúa mạch đen, lúa, lúa mạch, yến mạch, kê và tiểu hắc mạch), *loài Asteraceae* (ví dụ hướng dương), *loài Brassicaceae* (ví dụ bắp cải trắng, bắp cải đỏ, bông cải xanh, súp lơ, cải Brussels, cải chíp, su hào, củ cải, và hạt cải dầu, mù tạt, cải ngựa và cải xoong), *loài Fabacae* (ví dụ đậu, đậu phộng), *Papgroupaceae* (ví dụ đậu nành), *loài Solanaceae* (ví dụ khoai tây), *loài Chenopodiaceae* (ví dụ củ cải đường, củ cải bò, cải cầu vồng, củ dền); Malvaceae (ví dụ như bông); cây hữu ích và cây cảnh cho vườn và khu vực rừng; và các giống biến đổi gen của từng loại cây này.

Việc kiểm soát các bệnh sau đây của đậu nành được chú trọng: Các bệnh nấm trên lá, thân, vỏ và hạt gây ra bởi, chẳng hạn như, đốm lá Altemaria (*Altemaria spec. atrans tenuissima*), bệnh thán thư (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*), đốm nâu (*Septoria glycines*), đốm lá cercospora và bệnh bạc lá (*Cercospora kikuchii*), bệnh bạc lá choanephora (*Choanephora infundibulifera trispora (Syn.)*), đốm lá dactuliophora (*Dactuliophora glycines*), bệnh sương mai (*Peronospora manshurica*), bệnh bạc lá drechslera (*Drechslera glycini*), đốm lá frogeye (*Cercospora sojina*), đốm lá leptosphaerulina (*Leptosphaerulina trifolii*), đốm lá phyllostica (*Phyllosticta sojaecola*), bệnh bạc lá và vỏ (*Phomopsis sojae*), bệnh phấn trắng (*Microsphaera diffusa*), đốm lá pyrenochaeta (*Pyrenochaeta glycines*), bệnh bạc lá, gân lá, tán lá rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*), bệnh rỉ (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), bệnh nấm vảy

(*Sphaceloma glycines*), bệnh bạc lá stemphylium (*Stemphylium botryosum*), đốm mục tiêu (*Corynespora cassiicola*).

Sáng chế cũng liên quan đến việc sử dụng các hợp chất có công thức I, hỗn hợp hoặc các chế phẩm của chúng để kiểm soát hoặc ngăn ngừa các bệnh thực vật sau đây: *Puccinia spp.* (bệnh rỉ) trên cây trồng khác nhau, ví dụ, nhưng không giới hạn ở *P. triticina* (bệnh rỉ lá hoặc rỉ nâu), *P. striiformis* (bệnh rỉ vàng hoặc rỉ sọc*), Puccinia melanocephala (bệnh rỉ trên cây mía), P. hordei* (bệnh rỉ lùn), *P. graminis* (bệnh rỉ thân hoặc rỉ đen) hoặc *P. recondita* (bệnh rỉ lá hoặc rỉ nâu) trên ngũ cốc, chẳng hạn như lúa mì, lúa mạch hoặc lúa mạch đen và *Phakopsoraceae spp.* trên các loại cây khác nhau, đặc biệt là *Phakopsora pachyrhizi và P. meibomiae* (bệnh rỉ đậu nành) trên cây đậu nành, *Hemileia vastatrix* (bệnh rỉ cà phê), *Uromyces appendiculatus, Uromyces fabae và Uromyces phaseoli* (bệnh rỉ đậu).

Theo một phương án, sáng chế đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, để kiểm soát và/hoặc ngăn ngừa các bệnh trên cây trồng do mầm bệnh như dưới đây gây ra: *Pyricularia oryzae, Rhizoctonia solani, Botrytis cinerea, Alternaria solani, Colletotrichum capsici, Septoria lycopersici, Fusarium culmorum, Phakopsora pachyrhizi, Sphaerotheca fuliginea, Pseudoperonospora cubensis, Puccinia triticina, Septoria tritici, Phytopthora infestans, Plasmopara viticola hoặc Uncinula necator.*

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, để kiểm soát và/hoặc ngăn ngừa các bệnh trên cây trồng như: *Puccinia spp.* (bệnh rỉ) trên cây trồng khác nhau, được chọn từ, nhưng không giới hạn ở *P. triticina* (bệnh rỉ lá hoặc bệnh rỉ nâu), *P. striiformis* (bệnh rỉ vàng hoặc rỉ sọc*), P. hordei* (bệnh rỉ lùn), *P. graminis* (bệnh rỉ thân hoặc rỉ đen) hoặc *P. recondita* (bệnh rỉ lá hoặc rỉ nâu) trên ngũ cốc, được chọn từ lúa mì, lúa mạch hoặc lúa mạch đen và *Phakopsoraceae spp.* trên các loại cây khác nhau, đặc biệt là *Phakopsora pachyrhizi và P. meibomiae* (bệnh rỉ đậu nành) trên đậu nành.

Theo một phương án được ưu tiên hơn, sáng chế này đề xuất việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, để kiểm soát và/hoặc ngăn chặn nấm gây bệnh cho cây trồng như *Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomiae*, đối với cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn.

Sáng chế đề xuất một phương pháp để kiểm soát các vi sinh vật không mong muốn, trong đó các hợp chất có công thức (I) được ứng dụng cho các vi sinh vật và/hoặc trong môi trường sống của chúng.

Sáng chế còn cung cấp thêm một phương pháp bảo vệ hạt giống chống lại các vi sinh vật không mong muốn bằng cách sử dụng hạt giống được xử lý bằng ít nhất một trong các hợp chất có công thức (I).

Các hợp chất có công thức (I) có thể có hoạt tính diệt vi sinh vật mạnh và có thể được sử dụng để kiểm soát các vi sinh vật không mong muốn, chẳng hạn như nấm và vi khuẩn, trong bảo vệ cây trồng và bảo vệ các nguyên liệu đó.

Các hợp chất có công thức (I) có đặc tính diệt nấm và có thể được sử dụng trong bảo vệ cây trồng, ví dụ để kiểm soát *Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes và Deuteromycetes*.

Các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng như chất diệt khuẩn trong bảo vệ cây trồng, ví dụ, để kiểm soát *Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae* và *Streptomycetaceae.*

Các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để kiểm soát trong điều trị và bảo vệ cây trồng khỏi nấm gây bệnh. Do đó, sáng chế cũng đề cập đến các phương pháp điều trị và bảo vệ để kiểm soát nấm gây bệnh cho cây trồng bằng cách sử dụng các thành phần hoạt tính hoặc các chế phẩm, được ứng dụng cho hạt giống, thực vật hoặc các bộ phận thực vật, quả hoặc đất nơi cây phát triển.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất một chế phẩm để kiểm soát và/hoặc ngăn ngừa vi

sinh vật gây bệnh trên cây trồng, gồm có hợp chất có công thức (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp của chúng, và một hoặc nhiều chất mang có tính trơ.

Sáng chế đề xuất một chế phẩm trong đó nồng độ của hợp chất có công thức (I) nằm trong khoảng từ 10 đến 90% khối lượng so với tổng khối lượng của chế phẩm tốt nhất là từ 30 đến 70% khối lượng so với tổng khối lượng của chế phẩm.

Chế phẩm này cũng có thể còn gồm có một hoặc nhiều hợp chất tương thích có hoạt tính được lựa chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng, thuốc kháng sinh, chất dinh dưỡng hoặc phân bón.

Trong một phương án, sáng chế này đề xuất hỗn hợp gồm có hợp chất có công thức (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp của chúng và một hoặc nhiều hợp chất tương thích có hoạt tính được lựa chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng, thuốc kháng sinh, chất dinh dưỡng hoặc phân bón.

Theo sáng chế, như được định nghĩa ở trên, chất mang là một chất tự nhiên hoặc tổng hợp, hữu cơ hoặc vô cơ, trong đó các hoạt chất được trộn hoặc kết hợp với chất này để có cung cấp khả năng sử dụng tốt hơn, đặc biệt là ứng dụng cho cây trồng hoặc các bộ phận thực vật hoặc hạt giống. Chất mang, có thể là chất rắn hoặc chất lỏng, nói chung là có tính trơ nên thích hợp để sử dụng trong nông nghiệp.

Các chất mang ở thể rắn có ích bao gồm ví dụ như muối amoni và bột đá tự nhiên, chẳng hạn như kaolin, đất sét, đá tan, phấn, thạch anh, attapulgit, montmorillonit hoặc đất tảo cát, và các loại bột đá tổng hợp, chẳng hạn như silica, alumin và silicat được nghiền mịn; các

chất mang ở thể rắn có ích để làm thuốc hạt: ví dụ, đá tự nhiên được nghiền nhỏ và phân cỡ như canxit, đá cẩm thạch, đá bọt pumice, sepiolit và dolomit, và cả các loại thuốc hạt tổng hợp của bột vô cơ và hữu cơ, cũng như thuốc hạt của các nguyên liệu hữu cơ như giấy, mùn cưa, gáo dừa, lõi ngô và thân cây thuốc lá; chất nhũ hóa hữu ích và/hoặc chất tạo bọt bao gồm: ví dụ chất nhũ hóa phi ion và anion, chẳng hạn như este axit béo polyoxyetylen, ete rượu béo polyoxyetylen, ví dụ, ete alkylaryl polyglycol, alkylsulphonat, ankyl sunfat, arylsulphonat và cả các sản phẩm thủy phân protein; chất phân tán thích hợp là các chất phi ion và/hoặc ion, ví dụ từ các lớp của ete rượu-POE và/hoặc -POP, axit và/hoặc este POP POE, alkylaryl và/hoặc ete POP POE, chất béo và/hoặc các sản phẩm cộng POP POE , các dẫn xuất POE- và/hoặc POP-polyol, các sản phẩm cộng POE- và/hoặc POP-sorbitan hoặc -sugar/đường, alkyl hoặc aryl sunfat, alkyl- hoặc arylsulphonat và alkyl hoặc aryl photphat hoặc các sản phẩm cộng PO-ete tương ứng. Ngoài ra, chất phù hợp là oligo- hoặc polyme, ví dụ như các chất có nguồn gốc từ monome vinylic, từ axit acrylic, từ EO và/hoặc PO đơn lẻ hoặc kết hợp với, ví dụ, (nhiều) rượu hoặc (nhiều) amin. Cũng có thể sử dụng lignin và các dẫn xuất axit sulphonic của nó, xenluloza chưa biến đổi và đã biến đổi, axit sulphonic thơm và/hoặc béo và các sản phẩm cộng của chúng với fomandehyt.

Các thành phần hoạt tính có thể được ứng dụng như vậy hoặc được chuyển đổi sang các công thức thông thường hoặc ở dạng công thức của chúng hoặc các dạng sử dụng được điều chế từ đó, chẳng hạn như các dung dịch được điều chế sẵn để sử dụng, nhũ tương, huyền phù gốc nước hoặc dầu, bột, bột thấm nước, thuốc nhão, bột hòa tan, viên dẹt hòa tan, thuốc bột, thuốc hạt hòa tan, thuốc hạt để gieo, nhũ tương huyền phù đậm đặc, các sản phẩm tự nhiên được ngâm tẩm với thành phần hoạt tính, các chất tổng hợp được ngâm tẩm với thành phần hoạt tính, phân bón và cả vi nang trong các chất polyme. Các công thức hợp chất có thể sử dụng theo cách thông thường, ví dụ như bằng cách tưới nước, phun, phun sương, hộp ươm giống, gieo, phủ bột, tạo bọt, phát tán và những cách tương tự. Cũng có thể triển khai các hoạt chất theo phương pháp thể tích cực thấp hoặc tiêm chế phẩm hoạt chất hoặc chính hoạt chất vào đất. Cũng có thể xử lý hạt giống của cây trồng.

Các hoạt chất có thể được chuyển đổi tiếp sang công thức nano với mục đích cải thiện hơn nữa độ hòa tan nước, độ ổn định nhiệt, sinh khả dụng, các thuộc tính cảm quan và hiệu suất sinh lý.

Hơn nữa, việc lựa chọn loại công thức sẽ phụ thuộc vào mục đích sử dụng cụ thể.

Các công thức được đề cập có thể được điều chế theo cách đã biết, ví dụ bằng cách trộn các hoạt chất với ít nhất một chất độn thông thường, dung môi hoặc chất pha loãng, chất nhũ hóa, chất phân tán và/hoặc chất kết dính hoặc chất cố định, chất làm ướt, chất chống thấm nước, chất làm khô và chất ổn định tia cực tím nếu thích hợp và thuốc nhuộm và sắc tố nếu thích hợp, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberellin và các chất phụ trợ chế biến khác.

Sáng chế này không chỉ bao gồm các công thức đã sẵn sàng sử dụng và có thể được triển khai với dụng cụ thích hợp cho cây trồng hoặc hạt giống, mà còn cả các chất cô đặc thương mại phải được pha loãng với nước trước khi sử dụng.

Các chất phụ trợ được sử dụng có thể là những chất thích hợp để truyền các đặc tính cụ thể cho chính chế phẩm và/hoặc cho các chế phẩm có nguồn gốc từ đó (ví dụ dung dịch phun, chất bao phủ hạt giống), chẳng hạn như các đặc tính kỹ thuật nhất định và/hoặc các đặc tính sinh học cụ thể. Các chất phụ trợ điển hình bao gồm chất độn, dung môi và chất mang.

Các chất độn thích hợp, ví dụ, nước, chất lỏng hóa học hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ các lớp của hydrocacbon thơm và không thơm (chẳng hạn như parafin, alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), rượu và polyol (cũng có thể được thế tùy ý, ete hóa và/hoặc este hóa), keton (bao gồm axeton, xyclohexanon), este (kể cả chất béo và dầu) và (nhiều) ete, các amin, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton, không được thế và được thế, các sulphon và sulphoxit (chẳng hạn như dimetyl sulphoxit).

Các chất độn hoặc chất mang thể khí hóa lỏng được hiểu là chất lỏng ở thể khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và dưới áp suất tiêu chuẩn, ví dụ chất đẩy dạng sol khí như halohydrocacbon, hoặc butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Trong các công thức, có thể sử dụng các chất dính như cacboxymetylxenluloza, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, thuốc hạt hoặc nhựa mủ, chẳng hạn như gôm arabic, polyvinyl alcohol và polyvinyl axetat, hoặc các phospholipit tự nhiên khác như cephalin và lexitin và phospholipit tổng hợp. Các chất phụ gia khác có thể là dầu khoáng, dầu thực vật và dầu hạt được metyl hóa.

Nếu chất độn được sử dụng là nước, thì cũng có thể sử dụng, ví dụ, dung môi hữu cơ làm dung môi phụ trợ. Các dung môi lỏng hữu ích về cơ bản là: các chất thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, chất thơm được clo hóa hoặc hydrocacbon béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan hoặc parafin, ví dụ các sản phẩm chưng cất dầu mỏ, rượu như butanol hoặc glycol và ete và este của chúng, keton như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit và dimetyl sunfoxit, hoặc nước.

Các chế phẩm gồm có các hợp chất có công thức (I) ngoài ra có thể gồm có các cấu phần khác, ví dụ như các chất hoạt động bề mặt. Các chất hoạt động bề mặt thích hợp là chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc chất làm ẩm có đặc tính ion hoặc phi ion, hoặc hỗn hợp của các chất hoạt động bề mặt này. Các ví dụ về chúng là muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulphonic, muối của axit phenolsulphonic hoặc axit naphthalenesulphonic, các dạng đa tụ của etylen oxit với rượu béo hoặc với axit béo hoặc với amin béo, phenol được thế (tốt nhất là alkylphenol hoặc arylphenol), muối của các este sulphosucxinic, các dẫn xuất taurin (tốt nhất là alkyl taurat), este photphoric của rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, este béo của polyol và các dẫn xuất của hợp chất có chứa sunfat, sulphonat và photphat, ví dụ như ete alkylaryl polyglycol, alkylsulphonat, alkyl sunfat, arylsulphonat, các sản phẩm thủy phân protein, nước thải lignosulphite và metylxenluloza. Sự hiện diện của một chất hoạt động bề mặt là cần thiết nếu một trong các hoạt chất và/hoặc một trong các chất mang có tính trơ không hòa tan trong nước và khi được sử dụng cùng với nước. Tỷ lệ chất hoạt động bề mặt là từ 5 đến 40% khối lượng của chế phẩm trong sáng chế.

Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm hóa chất nông nghiệp gồm có một chất phụ trợ và ít nhất một hợp chất có công thức I theo sáng chế này.

Một chế phẩm hóa chất nông nghiệp học gồm một lượng hợp chất chứa công thức (I) có hiệu quả diệt nấm. Thuật ngữ "lượng hiệu dụng" biểu thị một lượng chế phẩm hoặc các hợp chất có Công thức (I), đủ để kiểm soát nấm có hại trên cây trồng hoặc trong bảo vệ nguyên liệu và không gây thiệt hại đáng kể cho các cây trồng được xử lý. Một lượng như vậy có thể khác nhau nhiều và phụ thuộc vào các yếu tố khác nhau, chẳng hạn như các loài nấm được kiểm soát, cây trồng hoặc nguyên liệu được xử lý, điều kiện khí hậu và hợp chất cụ thể của công thức (I) được sử dụng.

Các hợp chất có công thức I, các oxit và muối của chúng có thể được chuyển đổi thành các chế phẩm hóa chất nông nghiệp thông thường, ví dụ như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, thuốc bột, bột, thuốc nhão, thuốc hạt, thuốc dạng ép, viên nang và hỗn hợp của chúng. Ví dụ cho các chế phẩm là huyền phù (ví dụ: SC, OD, FS), thuốc sữa đậm đặc (ví dụ: EC), nhũ tương (ví dụ: EW, EO, ES, ME), viên nang (ví dụ: CS, ZC), thuốc nhão, viên ngậm, bột thấm nước hoặc thuốc bột (ví dụ: WP, SP, WS, DP, DS), thuốc dạng ép (ví dụ: BR, TB, DT), thuốc hạt (ví dụ: WG, SG, GR, FG, GG, MG), các sản phẩm diệt côn trùng (ví dụ: LN), cũng như các công thức gel xử lý nguyên liệu nhân giống cây trồng như hạt giống (ví dụ: GF). Những loại này và các chế phẩm khác được định nghĩa trong "Danh mục các loại công thức thuốc trừ sâu và hệ thống mã hóa quốc tế", Chuyên khảo kỹ thuật số 2, sửa đổi lần thứ 61. Tháng 5 năm 2008, Croplife International.

Các chế phẩm được điều chế theo cách đã biết, như được mô tả bởi Mollet và Grube mann, Công nghệ xây dựng công thức, Wiley VCH, Weinheim, 2001; hoặc Knowles, Những phát triển mới trong công thức sản phẩm bảo vệ cây trồng, Báo cáo Agrow DS243, TandF Informa, London, 2005.

Các chất phụ trợ thích hợp là dung môi, chất mang ở thể lỏng, chất mang ở thể rắn hoặc chất độn rắn, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất làm ướt, chất bổ trợ, chất hòa tan, chất tăng cường thâm nhập, chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất làm đặc, chất

làm ẩm, chất đẩy, chất hấp dẫn, chất kích thích cho ăn, phụ gia liên kết, thuốc diệt khuẩn, chất chống đông, chất chống tạo bọt, chất tạo màu, chất dính và chất kết dính.

Các dung môi thích hợp và chất mang ở thể lỏng là nước và dung môi hữu cơ, chẳng hạn như các phần dầu khoáng có nhiệt độ sôi trung bình đến cao, ví dụ dầu hỏa, dầu diesel; dầu có nguồn gốc thực vật hoặc động vật; hydrocacbon aliphatic, xyclic và thơm, ví dụ như toluen, parafin, tetrahydronaphthalen, naphthalen kiềm; rượu, ví dụ etanol, propanol, butanol, rượu benzyl, xyclohexanol; glycol; DMSO; keton, ví dụ như xyclohexanon; este, ví dụ như lactat, cacbonat, este axit béo, gamma-butyrolacton; axit béo; phospho; các amin; amit ví dụ N-metyl pyrrolidon, axit béo dimetyl amit; và hỗn hợp của chúng.

Chất mang ở thể rắn hoặc chất độn rắn thích hợp là đất khoáng, ví dụ silicat, silica gel, bột tan, kaolin, đá vôi, vôi, phấn, đất sét, dolomit, đất diatomaceous, bentonite, canxi sunfat, magiê sunfat, magiê oxit; polysacarit, ví dụ xenluloza, tinh bột; phân bón, ví dụ amoni sunfat, amoni photphat, amoni nitrat, urê; các sản phẩm có nguồn gốc thực vật, ví dụ như bột ngũ cốc, bột vỏ cây, bột gỗ, bột hạt dẻ và hỗn hợp của chúng.

Các chất hoạt động bề mặt thích hợp là các hợp chất hoạt động bề mặt, chẳng hạn như các chất hoạt động bề mặt anion, cation, không ion và lưỡng tính, polyme khối, polyelectrolyte, và hỗn hợp của chúng. Các chất hoạt động bề mặt như vậy có thể được sử dụng làm chất nhũ hóa, chất phân tán, chất hòa tan, chất làm ướt, chất tăng cường thâm nhập, chất keo bảo vệ hoặc chất bổ trợ. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt được liệt kê trong McCutcheon's, Quyển 1: Chất nhũ hóa và chất tẩy rửa, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (phiên bản Quốc tế hoặc phiên bản Bắc Mỹ).

Các chất hoạt động bề mặt anion thích hợp là kiềm, kiềm thổ hoặc muối amoni của sulfonat, sunfat, photphat, cacboxylat và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về sulfonat bao gồm alkylaryl sulfonat, diphenyl sulfonat, alpha-olefin sulfonat, lignin sulfonat, sulfonat của axit béo và dầu, sulfonat của alkylphenol etoxyl hóa, sulfonat của arylphenol alkoxyl hóa, sulfonat của naphthalen ngưng tụ, sulfonat của dodexyl và tridexylbenzen, sulfonat của naphthalen và alkyl naphthalen, sulfosuccinat hoặc sulfosuccinamat. Ví dụ về sunfat là sunfat của axit

béo và dầu, của alkylphenol hóa, rượu, rượu etoxyl hóa hoặc este của axit béo. Ví dụ về photphat là este photphat. Ví dụ về các cacboxylat là các alkyl cacboxylat và rượu cacboxyl hóa hoặc alkylphenol etoxylat.

Các chất hoạt động bề mặt không ion thích hợp là alkoxylat, amit axit béo được thế tại vị trí của Ni-tơ, oxit amin, este, chất hoạt động bề mặt có đường, chất hoạt động bề mặt polyme và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về alkoxylat là các hợp chất như rượu, alkylphenol, amin, amit arylphenol, axit béo hoặc este axit béo đã được alkoxyl hóa với 1 đến 50 chất tương đương. Etylen oxit và/hoặc propylen oxit có thể được sử dụng cho quá trình alkoxyl hóa, tốt nhất là etylen oxit. Ví dụ về các amit axit béo được thế tại vị trí của Ni-tơ là glucamit axit béo hoặc alkanolamit axit béo. Ví dụ về este là este axit béo, este glyxerol hoặc monoglyxerit. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt có đường là sorbitan, sorbitan etoxyl hóa, sucroza và glucoza este hoặc alkylpolyglucosit. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt polyme là các chất home- hoặc copolyme của vinyl pyrrolidon, rượu vinyl hoặc vinyl axetat.

Các chất hoạt động bề mặt cation thích hợp là các chất hoạt động bề mặt bậc bốn, ví dụ các hợp chất amoni bậc bốn với một hoặc hai nhóm kỵ nước, hoặc muối của các amin chính chuỗi dài. Các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính thích hợp là alkylbetain và imidazolin. Các polyme khối thích hợp là các polyme khối thuộc loại A-B hoặc A-B-A gồm các khối polyetylen oxit và polypropylen oxit hoặc loại A-B-C gồm alkanol, polyetylen oxit và polypropylen oxit.

Polyelectrolyte thích hợp là polyaxit hoặc polybazơ. Ví dụ về polyaxit là muối kiềm của axit polyacrylic hoặc polyme comb polyaxit. Ví dụ về polybazơ là polyvinyl amin hoặc polyetylen amin.

Các chất bổ trợ phù hợp là các hợp chất, có hoạt tính không đáng kể hoặc thậm chí không có hoạt tính trừ sâu và chúng cải thiện hiệu suất sinh học của hợp chất có công thức (I) trên mục tiêu. Ví dụ là các chất hoạt động bề mặt, dầu khoáng hoặc dầu thực vật và các chất

phụ trợ khác. Các ví dụ khác được liệt kê trong Knowles, Chất bổ trợ và phụ gia, Agrow Reports DS256, TandF Informa UK, 2006, chương 5.

Chất làm đặc thích hợp là polysacarit (ví dụ như gôm xanthan, cacboxymetyl xenluloza), đất sét vô cơ (biến đổi hữu cơ hoặc không biến đổi), polycacboxylat và silicat.

Các chất diệt khuẩn thích hợp là các dẫn xuất của bronopol và isothiazolinon như alkylisothiazolinon và benzisothiazolinon.

Các chất chống đông thích hợp là etylen glycol, propylen glycol, urê và glyxerin. Các chất chống tạo bọt thích hợp là silicon, rượu chuỗi dài và muối của axit béo. Các chất tạo màu thích hợp (ví dụ như màu đỏ, xanh dương hoặc xanh lục) là các sắc tố có độ hòa tan nước thấp và thuốc nhuộm hòa tan trong nước. Ví dụ là chất màu vô cơ (ví dụ: oxit sắt, oxit titan, sắt hexaxyanoferrat) và chất màu hữu cơ (ví dụ: chất tạo màu alizarin-, azo- và phthaloxyanin).

Chất dính hoặc chất kết dính thích hợp là polyvinyl pyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyl, polyacrylat, sáp sinh học hoặc tổng hợp, và ete xenluloza.

Ví dụ cho các chế phẩm và điều chế của chúng là:

i) Dạng đậm đặc tan trong nước (SL, LS)

10-60% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) và 5-15% khối lượng chất làm ướt (ví dụ: rượu alkoxylat) được hòa tan trong nước và/hoặc trong dung môi hòa tan trong nước (ví dụ như rượu) thành 100% khối lượng. Các hoạt chất hòa tan khi pha loãng với nước.

ii) Dạng phân tán đậm đặc (DC)

5-25% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) và 1-10% khối lượng phân tán (ví dụ polyvinyl pyrrolidon) được hòa tan trong dung môi hữu cơ (ví dụ: xyclohexanon) thành 100% khối lượng. Pha loãng với nước tạo thành dạng phân tán.

iii) Thuốc sữa đậm đặc (EC)

15-70% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) và 5-10% khối lượng chất nhũ hóa (ví dụ canxi dodexylbenzensulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan trong dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm) thành 100% khối lượng. Pha loãng với nước tạo thành nhũ tương.

iv) Nhũ tương (EW, EO, ES)

5-40% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) và 1-10% khối lượng chất nhũ hóa (ví dụ canxi dodexylbenzensulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan trong 20-40% khối lượng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm). Hỗn hợp này được đưa vào nước để có 100% khối lượng bằng máy nhũ hóa và được tạo thành dạng nhũ tương đồng nhất. Pha loãng với nước tạo thành nhũ tương.

v) Huyền phù (SC, OD, FS)

Trong máy nghiền bi khuấy trộn, 20-60% khối lượng hợp chất có công thức (I) được tán nhỏ bằng việc thêm 2-10% khối lượng chất phân tán và chất làm ướt (ví dụ natri lignosulfonat và rượu etoxylat), 0,1-2% khối lượng chất làm đặc (ví dụ: gôm xanthan) và nước 100% khối lượng để tạo huyền phù có hoạt tính tốt. Pha loãng với nước tạo thành huyền phù ổn định của hoạt chất. Đối với chế phẩm loại FS, có tới 40% khối lượng chất kết dính (ví dụ: rượu polyvinyl) được thêm vào.

vi) Hạt phân tán trong nước và hạt tan trong nước (WG, SG)

50-80% khối lượng của hợp chất có công thức (I) được nghiền mịn bằng cách thêm chất phân tán và chất làm ướt (ví dụ: natri lignosulfonat và rượu etoxylat) với 100% khối lượng và được điều chế dưới dạng thuốc hạt phân tán trong nước hoặc hòa tan trong nước bằng các thiết bị kỹ thuật (ví dụ: đùn, tháp phun, tầng sôi). Pha loãng với nước tạo ra sự phân tán ổn định hoặc dung dịch của hoạt chất.

vii) Bột phân tán trong nước và bột hòa tan trong nước (WP, SP, WS)

50-80% khối lượng của hợp chất có công thức I được nghiền trong máy nghiền roto stator có thêm 1-5% khối lượng chất phân tán (ví dụ: natri lignosulfonat), 1-3% khối lượng chất làm ướt (ví dụ: rượu etoxylat) và chất mang ở thể rắn (ví dụ: silica gel) để có 100% khối lượng. Pha loãng với nước tạo ra sự phân tán ổn định hoặc dung dịch của hoạt chất.

viii) Gel (GW, GF)

Trong máy nghiền bi khuấy trộn, 5-25% khối lượng hợp chất có công thức (I) được tán nhỏ bằng việc thêm 3-10% khối lượng chất phân tán (ví dụ natri lignosulfonat), chất làm đặc 1-5% khối lượng (ví dụ cacboxymetyl xenluloza) và nước thành 100% khối lượng để tạo ra huyền phù hoạt chất. Pha loãng với nước tạo thành huyền phù ổn định của hoạt chất.

ix) Vi nhũ tương (ME)

5-20% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) được thêm vào 5-30% khối lượng hỗn hợp dung môi hữu cơ (ví dụ: axit béo dimetyl amit và xyclohexanon), 10-25% khối lượng hỗn hợp chất hoạt động bề mặt (ví dụ rượu etoxylat và arylphenol etoxylat) và nước để có 100% khối lượng. Hỗn hợp này được khuấy trong 1 giờ để tạo ra một loại vi nhũ tương ổn định nhiệt động học.

x) Viên nang siêu nhỏ (CS)

Một pha dầu gồm có 5-50% khối lượng của một hợp chất có công thức (I), 0-40% khối lượng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm), 2-15% khối lượng monome acrylic (ví dụ: metylmethacrylat, axit methacrylic và một di- hoặc triacrylat) được phân tán vào dung dịch nước của chất keo bảo vệ (ví dụ: rượu polyvinyl). Phản ứng trùng hợp gốc dẫn đến sự hình thành các viên nang siêu nhỏ poly(meth)acrylat. Ngoài ra, một pha dầu gồm có 5-50% khối lượng của hợp chất có công thức (I) theo sáng chế, dung môi hữu cơ không tan trong nước 0-40% khối lượng (ví dụ hydrocacbon thơm) và monome isoxyanat (ví dụ: diphenylmethen-4,4'-diisoxyanat) được phân tán vào dung dịch nước của

chất keo bảo vệ (ví dụ: rượu polyvinyl). Việc bổ sung một polyamin (ví dụ hexameth ylenediamin) dẫn đến sự hình thành các viên nang siêu nhỏ. Các monome chiếm tới 1-10% khối lượng. % khối lượng liên quan đến tổng chế phẩm viên nang siêu nhỏ.

xi) Thuốc bột (DP, DS)

1-10% khối lượng hợp chất có công thức (I) được nghiền mịn và trộn lẫn với chất mang ở thể rắn (ví dụ: cao lanh được chia mịn) để có 100% khối lượng.

xii) Thuốc hạt (GR, FG)

0,5-30% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) được nghiền mịn và được liên kết với chất mang ở thể rắn (ví dụ như silicat) để có 100% khối lượng. Tạo hạt đạt được bằng cách đùn, sấy phun hoặc tầng sôi.

xiii) Chất lỏng thể tích cực thấp (UL)

1-50% khối lượng của một hợp chất có công thức (I) được hòa tan trong dung môi hữu cơ (ví dụ hydrocacbon thơm) để có 100% khối lượng.

Các chế phẩm từ i) đến xiii) có thể tùy ý chứa các chất phụ trợ khác, chẳng hạn như thuốc diệt khuẩn 0,1-1%, chất chống đông 5-15%, chất chống tạo bọt 0,1-1% và chất tạo màu 0,1-1% .

Các chế phẩm hóa chất nông nghiệp nói chung gồm có từ 0,01 đến 95%, tốt nhất là từ 0,1 đến 90%, và đặc biệt là từ 0,5 đến 75%, theo khối lượng của hoạt chất.

Các hoạt chất được sử dụng ở độ tinh khiết từ 90% đến 100%, tốt nhất là từ 95% đến 100% (theo phổ NMR).

Đối với mục đích xử lý nguyên liệu nhân giống cây trồng, đặc biệt là hạt giống, giải pháp để xử lý hạt giống (LS), nhũ tương - huyền phù (SE), huyền phù đậm đặc (FS), bột để xử lý khô (DS), bột phân tán trong nước để xử lý bùn (WS), bột hòa tan trong nước (SS), nhũ

tương (ES), thuốc sữa đậm đặc (EC) và gel (GF) thường được sử dụng. Các chế phẩm này cho, sau khi pha loãng hai đến mười lần, nồng độ hoạt chất từ 0,01 đến 60% khối lượng, tốt nhất là từ 0,1 đến 40%, trong các chế phẩm được điều chế sẵn để sử dụng. Có thể sử dụng các chế phẩm này trước hoặc trong khi gieo. Các phương pháp sử dụng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, tương ứng, trên nguyên liệu nhân giống cây trồng, đặc biệt là hạt giống, bao gồm chất dùng để bao phủ, phủ hạt giống, vo viên, phủ bột và ngâm cũng như các phương pháp bón trong luống. Tốt hơn là, hợp chất có công thức (I) hoặc các chế phẩm của chúng, tương ứng, được ứng dụng cho nguyên liệu nhân giống cây trồng bằng phương pháp không nảy mầm, ví dụ như bằng cách bao phủ hạt giống, vo viên, phủ và phủ bột.

Khi được sử dụng trong bảo vệ thực vật, lượng hoạt chất được ứng dụng, tùy thuộc vào mức độ hiệu quả mong muốn, từ 0,001 đến 2 kg mỗi ha, tốt hơn là từ 0,005 đến 2 kg mỗi ha, tốt hơn nữa là từ 0,05 đến 0,9 kg mỗi ha, và đặc biệt từ 0,1 đến 0,75 kg mỗi ha.

Trong quá trình xử lý các nguyên liệu nhân giống thực vật như hạt giống, ví dụ bằng cách phủ bột, phủ hoặc tưới ẩm hạt giống, thường cần phải có lượng hoạt chất từ 0,1 đến 1000 g, tốt hơn là từ 1 đến 1000 g, tốt hơn nữa là từ 1 đến 100 g và tốt nhất là từ 5 đến 100 g, trên 100 kg nguyên liệu nhân giống cây trồng (tốt nhất là hạt giống).

Khi được sử dụng để bảo vệ nguyên liệu hoặc các sản phẩm được lưu trữ, lượng hoạt chất được ứng dụng tùy thuộc vào loại khu vực cần sử dụng và mức độ hiệu quả mong muốn. Lượng hoạt chất trên một mét khối nguyên liệu được ứng dụng thường được sử dụng trong việc bảo vệ nguyên liệu là 0,001 g đến 2 kg, tốt nhất là 0,005 g đến 1 kg.

Các loại dầu, chất làm ướt, chất bổ trợ, phân bón hoặc vi chất dinh dưỡng và thuốc trừ sâu khác (ví dụ thuốc diệt cỏ, thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, chất điều hòa sinh trưởng, chất an toàn, thuốc trừ sâu sinh học) có thể được thêm vào các hoạt chất hoặc các chế phẩm gồm có chúng như là hỗn hợp trộn sẵn hoặc, nếu thích hợp cho đến ngay trước khi sử dụng (trộn trong thùng chứa). Các tác nhân này có thể được trộn lẫn với các chế phẩm theo sáng chế theo tỷ lệ khối lượng 1:100 đến 100:1, tốt nhất là 1:10 đến 10:1.

Một loại thuốc trừ sâu nói chung là một tác nhân hóa học hoặc sinh học (như thành phần hoạt chất trừ sâu, hợp chất, chế phẩm, vi rút, vi khuẩn, chất kháng khuẩn hoặc khử trùng) mà thông qua tác dụng của nó có thể ngăn chặn, làm mất tác dụng, giết chết hoặc làm giảm sâu bệnh. Các loài gây hại mục tiêu có thể bao gồm côn trùng, mầm bệnh thực vật, cỏ dại, động vật thân mềm, chim, động vật có vú, cá, tuyến trùng (giun tròn) và vi khuẩn phá hủy đất đai, gây phiền toái, lây lan bệnh hoặc là vật truyền bệnh. Thuật ngữ thuốc trừ sâu bao gồm cả các chất điều hòa sinh trưởng thực vật làm thay đổi tốc độ tăng trưởng, ra hoa hoặc tốc độ sinh sản của cây; thuốc làm rụng lá làm cho lá hoặc tán lá rụng khỏi cây, thường là để tạo điều kiện cho thu hoạch; chất hút ẩm thúc đẩy làm khô các mô sống, chẳng hạn như ngọn cây không mong muốn; chất kích hoạt thực vật, kích hoạt sinh lý thực vật để bảo vệ chống lại một số loài gây hại; chất an toàn làm giảm tác dụng diệt cỏ không mong muốn của thuốc trừ sâu trên cây trồng; và các chất kích thích tăng trưởng thực vật ảnh hưởng đến sinh lý thực vật, ví dụ như để tăng sự phát triển của cây, sinh khối, năng suất hoặc bất kỳ thông số chất lượng nào khác của sản phẩm có thể thu hoạch của cây trồng.

Thuốc trừ sâu sinh học đã được định nghĩa là một dạng thuốc trừ sâu dựa trên các vi sinh vật (vi khuẩn, nấm, vi rút, tuyến trùng, v.v.,) hoặc các sản phẩm tự nhiên (các hợp chất, chẳng hạn như chất chuyển hóa, protein hoặc chiết xuất từ các nguồn sinh học hoặc các nguồn tự nhiên khác) (Cơ quan Bảo vệ Môi trường Hoa Kỳ: http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/). Thuốc trừ sâu sinh học thường được tạo ra bằng cách phát triển và tập trung các sinh vật tự nhiên và/hoặc các chất chuyển hóa của chúng bao gồm vi khuẩn và các vi sinh vật khác, nấm, vi rút, tuyến trùng, protein, v.v.. Chúng thường được coi là cấu phần quan trọng của các chương trình quản lý dịch hại tổng hợp (IPM).

Thuốc trừ sâu sinh học được chia thành hai loại chính, thuốc trừ sâu vi sinh và thuốc trừ sâu sinh hóa:

1 Thuốc trừ sâu vi sinh gồm có vi khuẩn, nấm hoặc vi rút (và thường bao gồm các chất

chuyển hóa mà vi khuẩn và nấm tạo ra). Tuyến trùng gây bệnh cho côn trùng cũng được xếp vào loại thuốc trừ sâu vi sinh, mặc dù chúng là loại đa bào.

2 Thuốc trừ sâu sinh học là các chất tự nhiên có tác dụng kiểm soát dịch hại hoặc cung cấp các công dụng bảo vệ cây trồng khác như được định nghĩa dưới đây, nhưng gần như không độc đối với động vật có vú

Người sử dụng sử dụng các chế phẩm theo sáng chế thường từ một thiết bị định lượng trước, bình phun thuốc (có quai đeo), bình phun, máy bay phun hoặc hệ thống tưới. Thông thường, chế phẩm hóa chất nông nghiệp được tạo thành từ nước, dung dịch đệm và/hoặc các chất phụ trợ khác với nồng độ sử dụng mong muốn và chất lỏng phun được điều chế sẵn để sử dụng hoặc chế phẩm hóa chất nông nghiệp theo sáng chế thu được. Thông thường, dùng 20 đến 2000 lít, tốt nhất là dùng từ 50 đến 500 lít chất lỏng phun được điều chế sẵn để sử dụng trên mỗi ha diện tích sử dụng trong nông nghiệp.

Sáng chế còn đề cập đến một chế phẩm để kiểm soát các vi sinh vật không mong muốn, gồm ít nhất một trong các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một hoặc nhiều hợp chất tương thích có hoạt tính được chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt cỏ, thuốc trừ sâu sinh học, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, thuốc kháng sinh, phân bón và/hoặc hỗn hợp của chúng.

Nói chung, một hợp chất theo sáng chế này được sử dụng dưới chế phẩm (ví dụ: công thức) có chứa chất mang. Một hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm của chúng có thể được sử dụng ở nhiều dạng khác nhau như phân tán son khí, huyền phù viên nang, thuốc phun mù lạnh đậm đặc, thuốc bột, thuốc sữa đậm đặc, nhũ tương dầu trong nước, nhũ tương nước trong dầu, viên nang (thuốc hạt có lớp bao), hạt mịn, huyền phù đậm đặc dùng xử lý hạt giống, khí (dưới áp suất), sản phẩm sinh khí, thuốc hạt, thuốc phun mù nóng đậm đặc, hạt thô, hạt nhỏ, bột phân tán trong dầu, huyền phù cải tiến đậm đặc có thể trộn với dầu, thuốc dạng lỏng có thể trộn với dầu, bột nhão, dạng que cây, thuốc bột xử lý khô hạt giống, hạt giống được bao bằng thuốc, thuốc đậm đặc tan trong nước, bột hòa tan, dung dịch để xử lý hạt giống, dạng huyền phù đậm đặc (huyền phù đậm đặc), chất lỏng

thể tích cực thấp (ulv), huyền phù thể tích cực thấp (ulv), thuốc hạt hoặc viên nén phân tán trong nước, bột phân tán trong nước để xử lý bùn, thuốc hạt hoặc viên nén hòa tan trong nước, bột hòa tan trong nước để xử lý hạt giống và bột thấm nước.

Một công thức thường gồm có chất mang ở thể lỏng hoặc rắn và tùy chọn một hoặc nhiều chất phụ trợ công thức thông thường, có thể là chất phụ trợ ở thể rắn hoặc lỏng, ví dụ dầu thực vật không bị epoxy hóa hoặc bị epoxy hóa (ví dụ dầu dừa đã bị epoxy hóa, dầu hạt cải hoặc dầu đậu nành), chất chống tạo bọt, ví dụ như dầu silicon, chất bảo quản, đất sét, các hợp chất vô cơ, chất điều chỉnh độ nhớt, chất hoạt động bề mặt, chất kết dính và/hoặc chất dính. chế phẩm này cũng có thể bao gồm phân bón, chất bổ sung vi chất dinh dưỡng hoặc các chế phẩm khác ảnh hưởng đến sự tăng trưởng của cây trồng cũng như gồm có một hỗn hợp có chứa hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều chất có hoạt tính sinh học khác, chẳng hạn như thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, chất kích hoạt thực vật, thuốc diệt ve và thuốc trừ sâu.

Do đó, sáng chế cũng cung cấp một chế phẩm gồm có một hợp chất theo sáng chế và một chất mang có đặc tính nông học và có thể là một hoặc nhiều chất phụ trợ công thức thông thường.

Các chế phẩm được điều chế theo cách đã biết, trong trường hợp không có chất phụ trợ, ví dụ bằng cách nghiền, sàng lọc và/hoặc nén một hợp chất rắn theo sáng chế và với sự có mặt của ít nhất một chất phụ trợ, ví dụ bằng cách trộn lẫn và/hoặc nghiền hợp chất theo sáng chế với (các) chất phụ trợ. Trong trường hợp của các hợp chất rắn theo sáng chế, việc nghiền các hợp chất là để đảm bảo kích thước hạt cụ thể. Các quy trình điều chế chế phẩm này cũng như việc sử dụng các hợp chất theo sáng chế để điều chế các chế phẩm này cũng là đối tượng của sáng chế.

Các chế phẩm gồm có 0,1 đến 99%, đặc biệt là 0,1 đến 95%, của hợp chất theo sáng chế này và 1 đến 99,9%, đặc biệt là 5 đến 99,9%, của ít nhất một chất mang ở thể rắn hoặc lỏng, thông thường có thể là 0 đến 25%, đặc biệt là 0,1 đến 20%, của chế phẩm là chất hoạt động bề mặt (% trong mỗi trường hợp có nghĩa là phần trăm theo khối lượng).

Trong khi các chế phẩm cô đặc có xu hướng được ưu tiên cho hàng hóa thương mại, thì người tiêu dùng cuối cùng thông thường sử dụng các chế phẩm loãng có nồng độ hoạt chất thấp hơn đáng kể.

Ví dụ về các loại chế phẩm để bón qua lá dưới chế phẩm có sẵn là:

GR: thuốc hạt	EW: nhũ tương, dầu trong nước
WP: bột thấm nước	ME: Vi nhũ tương
WG: thuốc hạt phân tán trong nước (bột)	SC: huyền phù đậm đặc ngậm nước
SG: thuốc hạt hòa tan trong nước	CS: huyền phù viên nang ngậm nước
SL: thuốc đậm đặc tan trong nước	OD: huyền phù đậm đặc gốc dầu, và
EC: thuốc sữa đậm đặc	SE: nhũ tương huyền phù ngậm nước.

Trong khi đó, các ví dụ về các loại công thức xử lý hạt giống của các chế phẩm sẵn là:

WS: bột thấm nước để làm bùn xử lý hạt giống	FS: dạng huyền phù đậm đặc để xử lý hạt giống
LS: dung dịch xử lý hạt giống	WG: thuốc hạt phân tán trong nước, và
ES: nhũ tương để xử lý hạt giống	CS: huyền phù viên nang ngậm nước.

Ví dụ về các loại công thức thích hợp cho các chế phẩm hỗn hợp trộn trong thùng chứa là dung dịch, nhũ tương loãng, huyền phù hoặc hỗn hợp của chúng và thuốc bột.

Cũng như bản chất của các công thức, các phương pháp ứng dụng, chẳng hạn như bón qua

lá, tưới ẩm, phun, phun sương, phủ bột, rải, phủ hoặc đổ, được lựa chọn phù hợp với các mục tiêu đã định và các trường hợp phổ biến.

Các chế phẩm hỗn hợp trộn trong thùng chứa thường được điều chế bằng cách pha loãng với dung môi (ví dụ, nước) một hoặc nhiều chế phẩm sẵn có chứa các loại thuốc trừ sâu khác nhau, và thêm các chất phụ trợ khác tùy chọn. Các chất mang và chất bổ trợ thích hợp có thể ở thể rắn hoặc lỏng và là những chất thường được sử dụng trong công nghệ xây dựng công thức, ví dụ như các chất khoáng tự nhiên hoặc tái tạo, dung môi, chất phân tán, chất làm ướt, chất dính, chất làm đặc, chất kết dính hoặc phân bón.

Nói chung, một công thức hỗn hợp trộn trong thùng chứa để bón qua lá hoặc bón đất gồm có 0,1 đến 20%, đặc biệt là 0,1 đến 15%, của các thành phần mong muốn và 99,9 đến 80%, đặc biệt là 99,9 đến 85%, của một chất phụ trợ ở thể rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, một dung môi như nước), trong đó các chất phụ trợ có thể là một chất hoạt động bề mặt với lượng từ 0 đến 20%, đặc biệt là 0,1 đến 15%, dựa trên công thức hỗn hợp trộn trong bể. Thông thường, một công thức trộn sẵn để bón qua lá gồm có 0,1 đến 99,9%, đặc biệt là 1 đến 95%, của các thành phần mong muốn và 99,9 đến 0,1%, đặc biệt là 99 đến 5%, của một chất bổ trợ rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, một dung môi như nước), trong đó các chất phụ trợ có thể là một chất hoạt động bề mặt với lượng từ 0 đến 50%, đặc biệt là 0,5 đến 40%, dựa trên công thức hỗn hợp trộn sẵn.

Thông thường, một công thức hỗn hợp trộn trong thùng chứa để xử lý hạt giống gồm có 0,25 đến 80%, đặc biệt là 1 đến 75%, của các thành phần mong muốn và 99,75 đến 20%, đặc biệt là 99 đến 25%, của một chất phụ trợ ở thể rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, một dung môi như nước), trong đó các chất phụ trợ có thể là một chất hoạt động bề mặt với lượng từ 0 đến 40%, đặc biệt là 0,5 đến 30%, dựa trên công thức hỗn hợp trộn trong thùng chứa.

Thông thường, một công thức trộn sẵn để xử lý hạt giống gồm có 0,5 đến 99,9%, đặc biệt là 1 đến 95%, của các thành phần mong muốn và 99,5 đến 0,1%, đặc biệt là 99 đến 5%, của một chất bổ trợ rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, một dung môi như nước), trong đó các

chất phụ trợ có thể là một chất hoạt động bề mặt với lượng từ 0 đến 50%, đặc biệt là 0,5 đến 40%, dựa trên công thức trộn sẵn trong khi các sản phẩm thương mại tốt hơn là được phát triển dưới dạng các chất cô đặc (ví dụ, chế phẩm (công thức) sẵn), người dùng cuối thường sẽ sử dụng các công thức pha loãng (ví dụ: chế phẩm trong thùng chứa).

Các công thức trộn sẵn để xử lý hạt giống được ưu tiên là huyền phù đậm đặc ngậm nước. Công thức này có thể được ứng dụng cho các hạt giống sử dụng các kỹ thuật và máy móc xử lý thông thường, chẳng hạn như kỹ thuật tầng sôi, phương pháp máy nghiền con lăn, máy xử lý hạt giống rotostatic và máy phủ dạng trống. Các phương pháp khác, chẳng hạn như tầng phun cũng có thể hữu ích. Hạt giống có thể được định cỡ trước khi phủ. Sau khi phủ, hạt giống thường được làm khô và sau đó được chuyển sang máy định cỡ để xác định kích cỡ. Các thủ tụcquy trình như vậy đã được biết đến trong lĩnh vực kỹ thuật tương ứng. Các hợp chất theo sáng chế này đặc biệt thích hợp để áp dụng trong xử lý đất và hạt giống.

Nói chung, các chế phẩm sẵn theo sáng chế chứa 0,5 đến 99,9, đặc biệt là 1 đến 95, ưu tiên là từ 1 đến 50%, theo khối lượng của các thành phần mong muốn, và 99,5 đến 0,1, đặc biệt là 99 đến 5%, theo khối lượng của chất bổ trợ rắn hoặc lỏng (bao gồm, ví dụ, một dung môi như nước), trong đó chất phụ trợ (hoặc chất bổ trợ) có thể là một chất hoạt động bề mặt với lượng từ 0 đến 50, đặc biệt là 0,5 đến 40%, theo khối lượng dựa trên khối lượng của công thức trộn sẵn.

Một hợp chất có công thức (I) theo một phương án được ưu tiên, độc lập với bất kỳ phương án nào khác, ở chế phẩm xử lý (hoặc bảo vệ) nguyên liệu nhân giống cây trồng, trong đó chế phẩm bảo vệ nguyên liệu nhân giống cây trồng này có thể bao gồm thêm chất tạo màu. chế phẩm hoặc hỗn hợp bảo vệ nguyên liệu nhân giống cây trồng cũng có thể bao gồm ít nhất một polyme từ polyme tạo màng tan trong nước và phân tán trong nước để cải thiện khả năng bám dính của các thành phần hoạt tính với nguyên liệu nhân giống cây trồng đã qua xử lý, polyme này thường có khối lượng phân tử trung bình từ ít nhất 10000 đến khoảng 100000.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất một phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự nhiễm độc của các cây trồng hữu ích do các vi sinh vật gây bệnh trên cây trồng đối với cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn, trong đó hợp chất đã đề cập có công thức chung (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp, chế phẩm hoặc hỗn hợp của chúng, được ứng dụng cho cây trồng, cho hạt giống cây trồng, cho các bộ phận của chúng hoặc vị trí xung quanh.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất một phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa vi sinh vật gây bệnh trên cây trồng đối với cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng tại vườn sử dụng hợp chất có công thức (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp, chế phẩm hoặchỗn hợp của chúng, trong đó gồm có một bước sử dụng liều lượng hiệu quả của hợp chất hoặc chế phẩm hoặc hỗn hợp, với số lượng từ 1g đến 2kg mỗi ha cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng làm vườn.

Theo một phương án khác nữa, sáng chế đề xuất một phương pháp chống lại nấm gây bệnh trên cây trồng, gồm có xử lý cây trồng, đất, hạt giống hoặc nguyên liệu cần được bảo vệ bằng hợp chất có công thức (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc các muối được chấp nhận sử dụng trong nông nghiệp, chế phẩm hoặc hỗn hợp của chúng.

Ví dụ về các phương pháp sử dụng các hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm của chúng, là các phương pháp kiểm soát dịch hại trong nông nghiệp, bao gồm phun, phun sương, phủ bột, quét phủ bột, bao phủ, rải hoặc đổ mà sẽ được lựa chọn cho phù hợp với mục đích đã định của các trường hợp phổ biến.

Một phương pháp bón trong nông nghiệp là bón qua lá của cây trồng (bón lá), có thể lựa chọn tần suất và tỷ lệ bón để phù hợp với mức độ phá hoại nguy hiểm của sâu bệnh hoặc

nấm đang được đề cập. Ngoài ra, thành phần hoạt tính có thể tiếp cận cây trồng thông qua hệ thống rễ (ngấm vào qua rễ), bằng cách sử dụng hợp chất vào vị trí của cây, ví dụ bằng cách bón một chế phẩm lỏng của hợp chất vào đất (bằng cách tưới ẩm), hoặc bón hợp chất rắn ở thể rắn của thuốc hạt vào đất (bón đất). Trong trường hợp cây lúa nước, thuốc hạt này có thể được đo đếm trong ruộng ngập nước. Việc bón đất bằng các hợp chất theo sáng chế là một phương pháp ứng dụng được ưu tiên.

Tỷ lệ bón điển hình trên mỗi ha thường là 1 đến 2000 g hoạt chất trên mỗi ha, cụ thể là 10 đến 1000 g/ha, tốt nhất là 10 đến 600 g/ha, chẳng hạn như 50 đến 300 g/ha.

Có thể sử dụng thuốc nhuộm như sắc tố vô cơ, ví dụ oxit sắt, oxit titan và Xanh phổ, và thuốc nhuộm hữu cơ như thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm phthaloxyanin kim loại, và các chất dinh dưỡng vi lượng như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molypden và kẽm.

Các chất phụ gia khác có thể là nước hoa, khoáng chất hoặc thực vật, dầu, sáp và chất dinh dưỡng được sửa đổi tùy chọn (bao gồm cả các chất dinh dưỡng vi lượng), chẳng hạn như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molypden và kẽm.

Các cấu phần bổ sung có thể là chất ổn định, chẳng hạn như chất ổn định lạnh, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng hoặc các tác nhân khác giúp cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý.

Nếu thích hợp, các cấu phần bổ sung khác cũng có thể có mặt, ví dụ chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất dính, chất làm đặc, chất thixotropic, chất thẩm thấu, chất ổn định, chất cô lập, chất tạo phức. Nói chung, các thành phần hoạt tính có thể được kết hợp với bất kỳ chất phụ gia rắn hoặc lỏng nào thường được sử dụng cho mục đích xây dựng các công thức.

Các công thức thường chứa từ 0,05 đến 99% trọng lượng, 0,01 và 98% trọng lượng, tốt nhất là từ 0,1 đến 95% trọng lượng, tốt hơn nữa là từ 0,5 đến 90% thành phần hoạt tính, tốt nhất là từ 10 đến 70% trọng lượng.

Các công thức được mô tả ở trên có thể được sử dụng để kiểm soát các vi sinh vật không mong muốn, trong đó các chế phẩm gồm có các hợp chất có công thức (I) được ứng dụng cho vi sinh vật và/hoặc trong môi trường sống của chúng.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế này, cũng như muối, N-oxit, phức kim loại, đồng phân lập thể hoặc đa hình có thể được sử dụng như vậy hoặc trong các công thức của chúng và có thể được trộn với các đối tác phối trộn đã biết để mở rộng, ví dụ, phổ hoạt động hoặc để ngăn chặn sự phát triển của kháng thuốc. Các đối tác phối trộn hữu ích bao gồm, ví dụ, thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, thuốc diệt giun tròn, thuốc trừ sâu sinh học và thuốc diệt khuẩn. Một hỗn hợp với các thành phần hoạt tính đã biết khác, chẳng hạn như thuốc diệt cỏ, hoặc với phân bón và chất điều hòa tăng trưởng, chất an toàn và/hoặc chất bán hóa học, cũng có thể được sử dụng.

Theo một phương án, các cấu phần riêng lẻ của chế phẩm theo sáng chế, chẳng hạn như các bộ phận của bộ dụng cụ hoặc các bộ phận của hỗn hợp nhị phân hoặc tam phân có thể được trộn bởi chính người dùng trong bể phun hoặc bất kỳ loại thùng nào khác được sử dụng để bón thuốc (ví dụ: thùng xử lý hạt giống, máy vo viên hạt giống, bình phun thuốc) và các chất phụ trợ có thể được thêm vào, nếu thích hợp.

Do đó, một phương án của sáng chế là một bộ để điều chế một chế phẩm thuốc trừ sâu có thể dùng được, bộ gồm có a) một chế phẩm gồm có cấu phần 1) như được định nghĩa ở đây và ít nhất một phụ trợ; và b) một chế phẩm gồm có cấu phần 2) như được định nghĩa ở đây và ít nhất một phụ trợ; và tùy ý c) một chế phẩm gồm có ít nhất một phụ trợ và một cách tùy ý một hoạt chất 3) như được định nghĩa ở đây.

(Các) hợp chất có Công thức I, các hỗn hợp và chế phẩm của chúng trong việc sử dụng làm thuốc diệt nấm với các loại thuốc diệt nấm khác có thể dẫn đến việc mở rộng phổ hoạt tính diệt nấm hoặc ngăn chặn sự phát triển kháng thuốc của nấm. Hơn nữa, trong nhiều trường hợp, hiệu ứng đặc biệt khác thường có thể thu được.

Điều này có thể đạt được bằng cách sử dụng các hợp chất có Công thức I và ít nhất một chất hoạt tính thuốc trừ sâu đồng thời, cùng nhau (ví dụ: hỗn hợp trộn trong thùng chứa) hoặc riêng rẽ, hoặc liên tiếp, trong đó khoảng thời gian giữa các lần bón riêng lẻ được chọn để đảm bảo rằng hoạt chất được ứng dụng lần đầu vẫn xảy ra tại vị trí tác dụng với lượng vừa đủ tại thời điểm bón (các) hoạt chất thuốc trừ sâu tiếp theo. Trình tự sử dụng không quan trọng để thu được hiệu quả theo sáng chế.

Các hợp chất hoạt tính đã biết và được báo cáo như thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, thuốc kháng sinh, phân bón và chất dinh dưỡng có thể được kết hợp với ít nhất một hợp chất có Công thức I theo sáng chế hiện tại. Ví dụ, thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, thuốc kháng sinh, phân bón và chất dinh dưỡng được công bố và báo cáo trong WO2017076739 (A đến O) có thể được kết hợp với hợp chất có Công thức I của sáng chế này. Sáng chế cũng đề cập đến hỗn hợp như vậy gồm có hợp chất theo sáng chế và các hợp chất tương thích hoạt động được báo cáo trong WO2017076739.

Thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, thuốc kháng sinh, phân bón và chất dinh dưỡng được báo cáo trong WO2017076739, không được nêu lại ở đây vì mục đích ngắn gọn và được đưa vào đây theo cách tham khảo như các ví dụ không giới hạn được kết hợp với ít nhất một hợp chất có Công thức I theo sáng chế.

Tất cả các loại thực vật và các bộ phận thực vật có thể được xử lý theo sáng chế. Thực vật ở đây được hiểu là tất cả các loài thực vật và quần thể thực vật, chẳng hạn như thực vật hoang dã hoặc cây trồng mong muốn và không mong muốn (bao gồm cả cây trồng tự nhiên). Cây trồng có thể là cây có thể thu được bằng phương pháp nhân giống và tối ưu hóa thông thường hoặc bằng phương pháp công nghệ sinh học và di truyền hoặc kết hợp các phương pháp này, bao gồm cả cây chuyển gen và bao gồm cả các giống cây trồng có

thể được bảo vệ và không được bảo vệ theo quyền của nhà tạo giống cây trồng. Các bộ phận của thực vật được hiểu là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật trên mặt đất và trong lòng đất, chẳng hạn như cành non, lá, hoa và rễ ví dụ như lá, chồi, thân, cuống, hoa, thân quả, quả và hạt cũng như rễ, củ và thân rễ. Các bộ phận thực vật cũng bao gồm nguyên liệu đã thu hoạch và nguyên liệu nhân giống sinh sản và sinh dưỡng ví dụ cành giâm, củ, thân rễ, cành ghép và hạt giống.

Theo một phương án, sáng chế cung cấp một hạt giống gồm có hợp chất có công thức (I), muối được sử dụng trong nông nghiệp, đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit hoặc S-oxit của chúng, trong đó lượng hợp chất có công thức (I), đồng phân/đồng phân cấu trúc, đồng phân lập thể, đồng phân không đối quang, đồng phân đối quang, chất hỗn biến, phức kim loại, đa hình, N-oxit, S-oxit hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp của chúng là từ 0,1 g đến 10 kg trên 100 kg hạt giống.

Ngoài ra, sáng chế còn bao gồm một phương pháp xử lý hạt giống, đặc biệt là hạt giống (ngủ đông, ngâm giống, nảy mầm trước trước hoặc thậm chí có rễ và lá mới lên) được xử lý bằng ít nhất một trong các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng. Hạt giống theo sáng chế được sử dụng trong các phương pháp bảo vệ hạt giống và cây mới từ hạt khỏi nấm gây bệnh ở cây. Trong các phương pháp này, hạt giống phải được xử lý bằng cách sử dụng ít nhất một hoạt chất.

Mong muốn tối ưu hóa lượng hoạt chất được sử dụng để cung cấp sự bảo vệ tốt nhất có thể cho hạt giống, cây đang nảy mầm và cây con mới khỏi sự tấn công của nấm gây bệnh ở cây, nhưng không làm tổn hại đến bản thân cây trồng bởi hoạt chất được sử dụng. Đặc biệt, các phương pháp xử lý hạt giống cũng cần xem xét các kiểu hình nội tại của cây chuyển gen để đạt được sự bảo vệ tối ưu cho hạt giống và cây nảy mầm với tối thiểu các chế phẩm bảo vệ thực vật được sử dụng.

Do đó, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt giống, cây nảy mầm và cây con mới khỏi sự tấn công của động vật gây hại và/hoặc vi sinh vật gây hại ở cây bằng cách xử

lý hạt bằng chế phẩm trong sáng chế. Sáng chế cũng liên quan đến việc sử dụng các chế phẩm theo sáng chế để xử lý hạt giống nhằm bảo vệ hạt giống, cây nảy mầm và cây con mới nhú lên chống lại động vật gây hại và/hoặc vi sinh vật gây bệnh ở cây. Sáng chế còn liên quan đến hạt giống đã được xử lý bằng chế phẩm trong sáng chế để bảo vệ khỏi động vật gây hại và/hoặc vi sinh vật gây bệnh ở cây.

Một trong những ưu điểm của sáng chế là việc xử lý hạt giống bằng các chế phẩm này không chỉ bảo vệ hạt giống mà còn bảo vệ cây sau khi nảy mầm, khỏi động vật gây hại và/hoặc vi sinh vật gây bệnh ở cây. Bằng cách này, việc xử lý cây trồng ngay tại thời điểm gieo hạt hoặc ngay sau đó sẽ bảo vệ cây trồng cũng như xử lý hạt giống trước khi gieo hạt. Cũng có thể coi là thuận lợi là các thành phần hoặc chế phẩm có hoạt tính sáng chế có thể được sử dụng đặc biệt cho hạt giống chuyển gen, trong trường hợp đó cây trồng từ hạt này có khả năng biểu hiện một loại protein có tác dụng chống lại sâu bệnh, diệt cỏ hoặc các điều kiện bất lợi phi sinh học. Việc xử lý những hạt giống như vậy bằng các thành phần hoặc chế phẩm có hoạt tính sáng chế, ví dụ như protein diệt côn trùng, có thể dẫn đến việc kiểm soát một số loài sâu bệnh nhất định. Đáng ngạc nhiên là trong trường hợp này có thể quan sát thấy một hiệu ứng đồng vận hơn nữa, điều này cũng làm tăng hiệu quả bảo vệ chống lại sự tấn công của sâu bệnh, vi sinh vật, cỏ dại hoặc các điều kiện bất lợi phi sinh học.

Các hợp chất có công thức (I) thích hợp để bảo vệ hạt giống của bất kỳ giống cây trồng nào được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong rừng hoặc trồng trọt. Đặc biệt hơn, hạt giống của ngũ cốc (chẳng hạn như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, kê và yến mạch), hạt cải dầu, ngô, bông, đậu nành, lúa, khoai tây, hướng dương, đậu, cà phê, củ cải đường (ví dụ như củ cải đường và củ cải bò), đậu phộng, rau (như cà chua, dưa chuột, hành tây và rau diếp), thảm cỏ và cây cảnh. Đặc biệt quan trọng là xử lý hạt giống lúa mì, đậu tương, hạt cải dầu, ngô và lúa.

Như được mô tả dưới đây, việc xử lý hạt giống chuyển gen bằng các thành phần hoặc chế phẩm có hoạt tính sáng chế có ý nghĩa đặc biệt. Điều này đề cập đến việc hạt giống của

thực vật có chứa ít nhất một gen dị hợp cho phép biểu hiện polypeptit hoặc protein, ví dụ như có đặc tính diệt côn trùng. Các gen dị hợp này trong hạt chuyển gen có thể bắt nguồn, ví dụ, từ vi sinh vật của các loài *Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus* hoặc *Gliocladium*. Các gen dị hợp này tốt nhất là bắt nguồn từ *các loài Bacillus* , trong trường hợp đó, sản phẩm gen có hiệu quả chống lại sâu đục thân ngô châu Âu và/hoặc sâu ăn rễ ngô phương Tây. Đặc biệt tốt nhất là các gen dị hợp có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*.

Trong bối cảnh của sáng chế, chế phẩm trong sáng chế được áp dụng cho mình hạt giống hoặc trong một công thức phù hợp. Tốt hơn là hạt giống được xử lý ở trạng thái đủ ổn định để không xảy ra thiệt hại trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt giống có thể được xử lý bất cứ lúc nào từ khi thu hoạch và một thời gian sau khi gieo. Theo thông lệ, người ta thường sử dụng hạt giống đã tách khỏi cây và tách khỏi lõi, vỏ, cuống, lớp bọc, lông hoặc thịt của quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt giống đã thu hoạch, làm sạch và sấy khô đến độ ẩm dưới 15% theo trọng lượng. Ngoài ra, cũng có thể sử dụng hạt giống sau khi phơi khô, ví dụ, đã được xử lý bằng nước và sau đó làm khô lại, hoặc hạt giống chỉ sau khi được ngâm giống, hoặc hạt giống được bảo quản trong điều kiện ngâm giống hoặc hạt giống đã nảy mầm trước, hoặc hạt giống được gieo trong khay ươm, lớp băng hoặc giấy.

Khi xử lý hạt giống, thường phải đảm bảo rằng lượng chế phẩm trong sáng chế được ứng dụng cho hạt giống và/hoặc lượng phụ gia khác được lựa chọn sao cho khả năng nảy mầm của hạt không bị suy giảm hoặc cây tạo thành không bị hư hại. Điều này phải được đảm bảo đặc biệt trong trường hợp các hoạt chất có thể biểu hiện tác dụng gây độc thực vật ở một số tỷ lệ sử dụng nhất định.

Các hợp chất có công thức (I) có thể được ứng dụng trực tiếp, tức là không chứa bất kỳ thành phần nào khác và không cần pha loãng. Nói chung, tốt hơn là áp dụng các chế phẩm cho hạt giống ở dạng công thức thích hợp. Những công thức và phương pháp xử lý hạt giống thích hợp đã được biết đến bởi những người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này. Các hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển đổi thành các công thức thông

thường liên quan đến việc xử lý hạt giống, chẳng hạn như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bọt, bùn hoặc kết hợp với các chế phẩm chất phủ khác cho hạt giống, chẳng hạn như nguyên liệu tạo màng, nguyên liệu vo viên, sắt mịn hoặc bột kim loại khác, thuốc hạt, nguyên liệu chất phủ cho hạt giống bất hoạt, và cả các công thức ULV.

Trong xử lý hạt giống để tạo điều kiện cho hạt giống có thể trồng được bằng cách phủ polyme. Chất phủ polyme gồm có chất kết dính, sáp và sắc tố, và một hoặc nhiều chất ổn định với một lượng có hiệu dụng để ổn định huyền phù. Chất kết dính có thể là polyme được chọn từ nhóm gồm có đồng trùng hợp vinyl axetat-etylen, đồng trùng hợp vinyl axetat, đồng trùng hợp vinyl axetat-acrylic, vinylacrylic, acrylic, etylen-vinyl clorua, vinyl ete maleic anhydrit hoặc butadien styren. Các polyme tương tự khác có thể được sử dụng.

Các công thức này được điều chế theo cách đã biết, bằng cách pha trộn các hoạt chất hoặc hỗn hợp hoạt chất với các chất phụ gia thông thường, ví dụ chất độn và dung môi hoặc chất pha loãng thông thường, thuốc nhuộm, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberellin, và cả nước.

Thuốc nhuộm hiệu quả có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các thuốc nhuộm được sử dụng phổ biến cho các mục đích như vậy. Có thể sử dụng các sắc tố ít hòa tan trong nước hoặc thuốc nhuộm hòa tan trong nước. Ví dụ bao gồm thuốc nhuộm được biết đến với tên Rhodamine B, C.I. Sắc tố đỏ 112 và C.I. Dung môi đỏ 1.

Các chất làm ướt hiệu quả có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất thúc đẩy quá trình làm ướt và thường được sử dụng để tạo thành các thành phần hoạt tính hóa chất nông nghiệp. Có thể ưu tiên sử dụng chất alkylnaphthalenesulphonat, chẳng hạn như diisopropyl- hoặc diisobutylnaphthalenesulphonat.

Các chất phân tán hiệu quả và/hoặc chất nhũ hóa có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất phân tán không ion,

anion và cation thường được sử dụng để tạo thành các thành phần hóa chất nông nghiệp hoạt tính. Có thể ưu tiên sử dụng chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp của chất phân tán không ion hoặc anion. Các chất phân tán không ion hữu ích bao gồm đặc biệt là polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristrylphenol polyglycol ete, và các dẫn xuất được photphat hóa hoặc sunfat hóa của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là lignosulphonat, muối axit polyacrylic và các chất ngưng tụ arylsulphonat/fomandehyt.

Chất chống tạo bọt có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất ức chế tạo bọt thường được sử dụng để tạo thành các thành phần hóa chất nông nghiệp hoạt tính. Có thể tùy ý sử dụng chất chống tạo bọt silic và magie stearat.

Các chất bảo quản có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất có thể sử dụng cho các mục đích như vậy trong các chế phẩm hóa chất nông nghiệp. Ví dụ bao gồm diclophen và benzyl alcohol hemiformal.

Chất làm đặc thứ cấp có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất có thể sử dụng cho các mục đích như vậy trong các chế phẩm hóa chất nông nghiệp. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm dẫn xuất xenluloza, dẫn xuất axit acrylic, xanthan, đất sét biến tính và silica được phân chia mịn.

Các chất kết dính có thể xuất hiện trong các công thức chất bao phủ hạt giống có thể dùng được theo sáng chế là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong các sản phẩm dùng để bao phủ hạt giống. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm polyvinylpyrolidon, polyvinylga axetat, rượu polyvinyl và tyloza.

Các công thức có thể dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế có thể được sử dụng trực tiếp để xử lý nhiều loại hạt giống khác nhau hoặc sau khi pha loãng trước với nước. Ví dụ, các chất cô đặc hoặc các chế phẩm thu được từ đó bằng cách pha loãng với nước có thể được sử dụng để trộn hạt ngũ cốc, chẳng hạn như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch và

tiểu hắc mạch, và cả hạt giống ngô, đậu tương, lúa, hạt cải dầu, đậu Hà Lan, đậu, bông, hoa hướng dương, và củ cải đường, hoặc nhiều loại hạt giống rau củ khác nhau. Các công thức có thể dùng được theo sáng chế, hoặc các chế phẩm loãng của chúng, cũng có thể được sử dụng để xử lý hạt giống của cây chuyển gen. Trong trường hợp này, các tác dụng hiệp đồng bổ sung cũng có thể xảy ra khi tương tác với các chất được tạo thành thông qua các biểu hiện.

Thêm nước để xử lý hạt giống bằng các công thức có thể dùng được theo sáng chế hoặc các chế phẩm được điều chế từ đó, tất cả các hỗn hợp trộn đều có thể sử dụng theo cách thông thường để xử lý hạt giống hiệu quả. Cụ thể, quy trình xử lý hạt giống là đặt hạt giống vào máy trộn, sau đó thêm lượng các công thức mong muốn cụ thể, như vậy hoặc sau khi pha loãng trước với nước, và trộn tất cả mọi thứ cho đến khi tất cả các công thức được ứng dụng phân phối đồng nhất trên các hạt giống. Nếu thích hợp, thực hiện thao tác tiếp theo là làm khô.

Các hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm của chúng cũng thích hợp để bảo vệ nguyên liệu nhân giống thực vật, ví dụ hạt giống, chẳng hạn như quả, củ hoặc nhân, hoặc cây ươm, chống lại các loại sâu bệnh nói trên. Nguyên liệu nhân giống có thể được xử lý bằng hợp chất trước khi trồng, ví dụ hạt giống có thể được xử lý trước khi gieo. Ngoài ra, hợp chất có thể được ứng dụng để xử lý nhân hạt giống (chất phủ), bằng cách ngâm nhân hạt giống trong chế phẩm thể lỏng hoặc phủ một lớp chế phẩm thể rắn. Cũng có thể sử dụng các chế phẩm khi nguyên liệu nhân giống được trồng vào vị trí bón, ví dụ như vào rãnh hạt trong quá trình gieo. Các phương pháp xử lý này đối với nguyên liệu nhân giống cây trồng, do đó nguyên liệu nhân giống cây trồng được xử lý là các đối tượng tiếp theo của sáng chế. Tỷ lệ xử lý điển hình sẽ phụ thuộc vào cây trồng và sâu bệnh/nấm cần kiểm soát và thường từ 1 đến 200 gam trên 100 kg hạt giống, tốt nhất là từ 5 đến 150 gam trên 100 kg hạt giống, chẳng hạn như từ 10 đến 100 gam trên 100 kg hạt giống. Việc sử dụng các hợp chất theo sáng chế để xử lý hạt giống là một phương pháp ứng dụng được ưu tiên.

Tỷ lệ sử dụng các công thức có thể dùng được theo sáng chế có thể thay đổi trong phạm vi tương đối rộng. Tỷ lệ này được hướng dẫn theo hàm lượng cụ thể của các hoạt chất trong các công thức và theo hạt giống. Tỷ lệ sử dụng mỗi hoạt chất đơn lẻ thường từ 0,001 đến 15 g cho mỗi kg hạt giống, tốt nhất là từ 0,01 đến 5 g cho mỗi kg hạt giống.

Khi sử dụng các hợp chất có công thức (I) như thuốc diệt nấm, tỷ lệ sử dụng có thể thay đổi trong một phạm vi tương đối rộng, tùy thuộc vào loại mục đích sử dụng. Tỷ lệ sử dụng của các hoạt chất theo sáng chế là:

trong trường hợp xử lý các bộ phận thực vật, ví dụ lá: từ 0,1 đến 10000 g/ha, tốt nhất là từ 10 đến 1000 g/ha, tốt hơn nữa là từ 30 đến 300 g/ha (trong trường hợp xử lý bằng cách tưới hoặc nhỏ giọt, thậm chí có thể giảm tỷ lệ sử dụng, đặc biệt khi sử dụng các chất nền có tính trơ như bông khoáng hoặc đá trân châu);

trong trường hợp xử lý hạt giống: từ 0,1 đến 200 g trên 100 kg hạt giống, tốt nhất là từ 1 đến 150 g trên 100 kg hạt giống, tốt hơn nữa là từ 2,5 đến 25 g trên 100 kg hạt giống, thậm chí tốt hơn là từ 2,5 đến 12,5 g trên 100 kg hạt giống;

đối với xử lý đất: từ 0,1 đến 10000 g/ha, tốt nhất là từ 1 đến 5000 g/ha.

Các tỷ lệ sử dụng này chỉ là ví dụ và không giới hạn cho các mục đích của sáng chế.

Trong một số trường hợp, các hợp chất có công thức (I), ở nồng độ hoặc tỷ lệ sử dụng cụ thể, cũng có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc các tác nhân để cải thiện đặc tính thực vật, hoặc làm chất diệt vi sinh, ví dụ như thuốc diệt nấm, thuốc chống co thắt, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt vi-rút (bao gồm cả các chế phẩm chống lại viroid) hoặc chế phẩm chống lại MLO (sinh vật giống Mycoplasma) và RLO (sinh vật giống Rickettsia).

Các hợp chất có công thức (I) can thiệp vào các quá trình sinh lý của thực vật và do đó cũng có thể được sử dụng làm các chất điều hòa sinh trưởng thực vật. Các chất điều hòa sinh trưởng thực vật có thể có nhiều tác dụng khác nhau đối với thực vật. Tác dụng của các

chất chủ yếu phụ thuộc vào thời điểm sử dụng liên quan đến giai đoạn phát triển của cây trồng, giống cây trồng và cũng phụ thuộc vào lượng hoạt chất được ứng dụng cho cây trồng hoặc môi trường của chúng và phụ thuộc vào loại mục đích sử dụng. Trong mỗi trường hợp, chất điều hòa sinh trưởng phải có tác dụng mong muốn cụ thể đối với cây trồng.

Các tác dụng điều hòa sinh trưởng, gồm có nảy mầm sớm hơn, nảy mầm tốt hơn, hệ thống rễ phát triển hơn và/hoặc cải thiện sự phát triển của rễ, tăng khả năng đẻ nhánh, đẻ nhánh năng suất hơn, ra hoa sớm hơn, tăng chiều cao và/hoặc sinh khối của cây, rút ngắn thân, cải thiện sự phát triển của chồi, số lượng hạt/bắp, số bắp/m², số thân bò lan và/hoặc số hoa, chỉ số thu hoạch nâng cao, lá to hơn, ít lá chết hơn, cải thiện kiểu xếp lá, chín sớm hơn/kết quả sớm hơn, chín đồng nhất, tăng thời gian ra đầy hạt, kết qảu tốt hơn, kích thước quả/rau lớn hơn, khả năng chống mọc mầm và giảm nguy cơ bị đổ ngã.

Tăng hoặc cải thiện năng suất đề cập đến tổng sinh khối trên một ha, năng suất trên một ha, khối lượng nhân/quả, kích thước hạt và/hoặc khối lượng ha cũng như chất lượng sản phẩm được cải thiện, gồm có:

cải thiện khả năng xử lý liên quan đến sự phân bố kích thước (nhân, quả, v.v.,), độ chín đồng nhất, độ ẩm của hạt, xay xát tốt hơn, khả năng tạo men tốt hơn, sản xuất bia tốt hơn, tăng năng suất nước của quả, khả năng thu hoạch, khả năng tiêu hóa, giá trị lắng đọng, chỉ số rơi, độ ổn định của vỏ quả, độ ổn định trong bảo quản, cải thiện chiều dài/độ bền/độ đồng đều của sợi, tăng lượng sữa và/hoặc đáp ứng chất lượng thức ăn được ủ tươi của vật nuôi, khả năng thích ứng với quy trình nấu ăn và chiên;

gồm có cải thiện khả năng thị trường liên quan đến cải thiện chất lượng quả/hạt, phân bố kích thước (nhân, quả, v.v.,), tăng khả năng bảo quản/thời hạn sử dụng, độ chắc/mềm, mùi vị (hương thơm, kết cấu, v.v.,), mức độ (kích thước, hình dạng, số quả, v.v.,), số quả/quả trên một chùm, độ giòn, độ tươi, độ phủ của sáp, tần suất rối loạn sinh lý, màu sắc, v.v.;

gia tăng các thành phần mong muốn như hàm lượng protein, axit béo, hàm lượng dầu, chất lượng dầu, chế phẩm axit amin, hàm lượng đường, hàm lượng axit (pH), tỷ lệ đường/axit

(Brix), polyphenol, hàm lượng tinh bột, chất lượng dinh dưỡng, hàm lượng/chỉ số gluten, hàm lượng năng lượng, mùi vị, v.v.;

và còn gồm có giảm các thành phần không mong muốn như ít độc tố nấm mốc, ít aflatoxin, mức độ geosmin, hương liệu phenolic, lacchaza, polyphenol oxidaza và peroxidaza, hàm lượng nitrat, v.v..

Ví dụ, các hợp chất điều hòa sinh trưởng thực vật có thể được sử dụng để làm chậm quá trình phát triển sinh dưỡng của thực vật. Sự suy giảm sinh trưởng như vậy là mối quan tâm kinh tế, ví dụ, trong trường hợp cỏ, vì như vậy có thể giảm tần suất cắt cỏ trong vườn cảnh, công viên và cơ sở thể thao, ven đường, sân bay hoặc trong cây ăn quả. Một điều cũng có ý nghĩa quan trọng là sự ức chế sự phát triển của cây thân thảo và cây thân gỗ ở ven đường và gần đường ống hoặc dây cáp trên cao, hoặc nói chung là ở những nơi không mong muốn cây phát triển mạnh mẽ.

Một điều quan trọng nữa là việc sử dụng các chất điều hòa sinh trưởng để ức chế sự phát triển theo chiều dọc của ngũ cốc. Điều này làm giảm hoặc loại bỏ hoàn toàn nguy cơ cây bị đổ ngã trước khi thu hoạch. Ngoài ra, các chất điều hòa tăng trưởng có thể củng cố thân của cây ngũ cốc, giúp ngăn chặn cây bị đổ ngã. Việc sử dụng các chất điều hòa sinh trưởng để rút ngắn và củng cố thân cây cho phép sử dụng lượng phân bón cao hơn nhằm tăng năng suất, mà không gây bất kỳ nguy cơ đổ ngã nào cho giống cây ngũ cốc.

Trong nhiều loại cây trồng, sự suy giảm sinh trưởng cho phép trồng dày đặc hơn, và do đó có thể đạt được năng suất cao hơn dựa trên bề mặt đất. Một ưu điểm khác của các loại cây nhỏ hơn thu được theo cách này là cây trồng dễ trồng và dễ thu hoạch hơn.

Giảm sự phát triển của cây sinh dưỡng cũng có thể dẫn đến tăng hoặc cải thiện năng suất vì các chất dinh dưỡng và chất đồng hóa có lợi cho sự hình thành hoa và quả hơn là các bộ phận sinh dưỡng của cây.

Ngoài ra, các chất điều hòa sinh trưởng cũng có thể được sử dụng để thúc đẩy sự phát triển sinh dưỡng. Điều này mang lại lợi ích lớn khi thu hoạch các bộ phận thực vật sinh dưỡng.

Tuy nhiên, việc thúc đẩy tăng trưởng sinh dưỡng cũng có thể thúc đẩy tăng trưởng sinh sản trong đó nhiều chất đồng hóa hơn được hình thành, tạo ra nhiều quả hơn hoặc quả to hơn.

Hơn nữa, các tác động có lợi đến tăng trưởng hoặc năng suất có thể đạt được thông qua việc cải thiện hiệu quả sử dụng chất dinh dưỡng, đặc biệt là hiệu quả sử dụng nitơ (N), hiệu quả sử dụng phospho (P), hiệu quả sử dụng nước, cải thiện sự thoát hơi nước, hô hấp và/hoặc tốc độ đồng hóa CO_2, nốt sần tốt hơn, cải thiện chuyển hóa Ca, v.v..

Tương tự như vậy, các chất điều hòa sinh trưởng có thể được sử dụng để thay đổi chế phẩm của cây, do đó có thể dẫn đến cải thiện chất lượng của sản phẩm thu hoạch. Dưới ảnh hưởng của các chất điều hòa sinh trưởng, các quả không hạt có thể được hình thành. Ngoài ra, có thể ảnh hưởng đến giới tính của hoa. Người ta cũng có thể tạo ra hạt phấn vô trùng, điều này có ý nghĩa rất quan trọng trong việc nhân giống và sản xuất hạt lai.

Sử dụng chất điều hòa sinh trưởng có thể kiểm soát sự đẻ nhánh của cây trồng. Một mặt, bằng cách phá vỡ ưu thế ngọn, có thể thúc đẩy sự phát triển của các chồi bên, điều này có thể rất được mong đợi, đặc biệt là trong việc trồng cây cảnh, đồng thời kết hợp với việc ức chế sinh trưởng. Tuy nhiên, mặt khác cũng có thể ức chế sự phát triển của các chồi bên. Tác dụng này được quan tâm đặc biệt, ví dụ, trong việc trồng thuốc lá hoặc trong việc trồng cà chua.

Dưới tác động của các chất điều hòa sinh trưởng, số lượng lá trên cây có thể được kiểm soát sao cho cây rụng lá đạt được vào thời điểm mong muốn. Việc làm rụng lá như vậy đóng một vai trò quan trọng trong việc thu hoạch bông cơ giới, nhưng cũng được chú ý để tạo điều kiện thu hoạch cho các cây trồng khác, ví dụ như trong nghề trồng nho. Việc làm rụng lá của cây cũng có thể được thực hiện để giảm sự thoát hơi nước của cây trước khi chúng được cấy ghép.

Hơn nữa, các chất điều hòa sinh trưởng có thể điều chỉnh sự già đi của cây, điều này có thể dẫn đến thời gian diện tích lá xanh kéo dài, giai đoạn lấp đầy hạt dài hơn, cải thiện chất lượng năng suất, v.v..

Tương tự như vậy, các chất điều hòa sinh trưởng cũng có thể được sử dụng để điều chỉnh sự rụng quả. Một mặt, có thể ngăn ngừa hiện tượng rụng quả sớm. Mặt khác, nó cũng có thể thúc đẩy sự rụng quả hoặc thậm chí hoa phát triển không đầy đủ để đạt được khối lượng mong muốn ("tỉa thưa"). Ngoài ra, có thể sử dụng các chất điều hòa sinh trưởng vào thời điểm thu hoạch để giảm lực tác động để lấy quả, cho phép thu hoạch bằng phương tiện cơ giới hoặc thu hoạch thủ công.

Các chất điều hòa sinh trưởng cũng có thể được sử dụng để đẩy nhanh hơn hoặc làm chậm quá trình chín của nguyên liệu thu hoạch trước hoặc sau khi thu hoạch. Điều này đặc biệt thuận lợi vì nó cho phép điều chỉnh tối ưu theo các yêu cầu của thị trường. Hơn nữa, các chất điều hòa sinh trưởng trong một số trường hợp có thể giúp cải thiện màu sắc của quả. Ngoài ra, các chất điều hòa sinh trưởng cũng có thể được sử dụng để làm chín quả đồng thời trong một khoảng thời gian nhất định. Điều này thiết lập các điều kiện tiên quyết để thu hoạch hoàn toàn bằng hình thức cơ giới hoặc thủ công bằng một thao tác đơn lẻ, ví dụ như trong trường hợp áp dụng với thuốc lá, cà chua hoặc cà phê.

Bằng cách sử dụng các chất điều hòa sinh trưởng, người ta cũng có thể tác động đến tình trạng có vẻ không sinh trưởng của hạt hoặc chồi của cây, chẳng hạn như các cây như dứa hoặc cây cảnh trong vườn ươm, chẳng hạn như nảy mầm, đâm chồi hoặc ra hoa vào thời điểm mà chúng thường không như vậy. Ở những khu vực có nguy cơ bị sương giá, có thể nên trì hoãn việc đâm chồi hoặc nảy mầm của hạt với sự hỗ trợ của các chất điều hòa sinh trưởng, để tránh thiệt hại do sương giá muộn.

Cuối cùng, các chất điều hòa sinh trưởng có thể tạo ra khả năng chống chịu của cây đối với sương giá, hạn hán hoặc độ mặn cao của đất. Điều này cho phép trồng cây ở những vùng thường không thích hợp cho mục đích này.

Các hợp chất có công thức (I) cũng thể hiện tác dụng tăng cường sức sống mạnh ở cây trồng. Do đó, kết hợp có thể được sử dụng để thúc đẩy khả năng phòng vệ của thực vật trước sự tấn công của các vi sinh vật có hại.

Các chất tăng cường (tính kháng) thực vật trong bối cảnh hiện nay là các chất có khả năng kích thích hệ thống phòng vệ của cây trồng theo cách mà chúng đã được xử lý, khi được cấy vi sinh vật không mong muốn sau đó, sẽ phát triển mức độ đề kháng cao đối với các vi sinh vật này.

Hơn nữa, trong bối cảnh sáng chế này, các tác dụng sinh lý thực vật gồm có những điều sau đây:

Khả năng chống chịu các điều kiện bất lợi phi sinh học, bao gồm khả năng chống chịu nhiệt độ cao hoặc thấp, chịu hạn và phục hồi sau điều kiện hạn hán, hiệu quả sử dụng nước (tương quan với việc giảm tiêu thụ nước), khả năng chịu ngập lụt, điều kiện bất lợi ôzôn và khả năng chịu tia cực tím, chịu được các hóa chất như kim loại nặng, muối, thuốc trừ sâu, v.v..

Khả năng chống chịu các điều kiện bất lợi sinh học bao gồm tăng khả năng chống nấm và tăng khả năng chống lại sự phá hoại của tuyến trùng, vi rút và vi khuẩn. Trong bối cảnh sáng chế, khả năng chống chịu các điều kiện bất lợi sinh học tốt hơn gồm có tăng khả năng kháng nấm và tăng khả năng chống lại sự phá hoại của tuyến trùng.

Sức sống của thực vật đã tăng lên, gồm có sức khỏe/chất lượng cây và sức sống của hạt, giảm thiểu khả năng chết cây khi đã sinh trưởng, cải thiện hình dạng cây, tăng khả năng phục hồi sau thời gian bị ảnh hưởng, cải thiện sắc tố (như hàm lượng chất diệp lục, hiệu ứng xanh lá của cây, v.v.,) cũng như cải thiện hiệu quả quang hợp.

Ngoài ra, các hợp chất có công thức (I) có thể làm giảm hàm lượng độc tố nấm mốc trong nguyên liệu thu hoạch và thực phẩm và thức ăn chăn nuôi được điều chế từ đó. Độc tố nấm mốc bao gồm đặc biệt, nhưng không duy nhất, những chất sau: deoxynivalenol (DON), nivalenol, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, T2- và HT2-toxin, fumonisin, zearalenon, moniliformin, fusarin, diaceotoxyscirpenol (DAS), beauvericin, enniatin, fusaroproliferin, fusarenol, ochratoxin, patulin, ergot alkaloid và aflatoxin có thể được tạo ra, ví dụ, bởi các loại nấm sau: *Các loài Fusarium*như *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*,

F. crookwellense, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminarum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides*v.v., và loài *Aspergillus* như *A. flavus, A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, loài *Penicillium* như *P. verrucosum*, *P. viridicatum*, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P. claviforme*, *P. roqueforti*, *các loài Clavicepsnhư C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, loài *Stachybotrys* và các loài khác.

Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để bảo vệ nguyên liệu, bảo vệ nguyên liệu công nghiệp chống lại sự tấn công và phá hủy của nấm phytopathogenic.

Ngoài ra, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng làm các chế phẩm chống rỉ, độc lập hoặc kết hợp với các hoạt chất khác.

Nguyên liệu công nghiệp trong bối cảnh hiện nay được hiểu là những nguyên liệu vô tri vô giác đã được chuẩn bị để sử dụng trong ngành công nghiệp. Ví dụ, các nguyên liệu công nghiệp cần được bảo vệ bằng các chế phẩm trong sáng chế khỏi sự thay đổi hoặc phá hủy của vi sinh vật có thể là chất kết dính, keo dán, giấy, giấy dán tường và bìa/bìa cứng, hàng dệt, thảm, da, gỗ, sợi và mô, sơn và đồ nhựa, chất bôi trơn làm mát và các nguyên liệu khác có thể bị nhiễm hoặc phá hủy bởi vi sinh vật. Các bộ phận của nhà máy sản xuất và tòa nhà, ví dụ mạch nước làm mát, hệ thống làm mát và sưởi ấm, hệ thống thông gió và điều hòa không khí, có thể bị suy giảm do sự sinh sôi của vi sinh vật cũng có thể được đề cập trong phạm vi nguyên liệu cần bảo vệ. Các nguyên liệu công nghiệp trong phạm vi của sáng chế tốt nhất là bao gồm chất kết dính, hồ, giấy và bìa, da, gỗ, sơn, chất bôi trơn làm mát và chất lỏng truyền nhiệt, tốt hơn là gỗ.

Các hợp chất có công thức (I) có thể ngăn ngừa các tác động bất lợi, chẳng hạn như thối rữa, mục nát, đổi màu, mất màu hoặc hình thành nấm mốc.

Trong trường hợp xử lý gỗ, các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để chống lại nấm bệnh phát triển trên hoặc bên trong gỗ. Thuật ngữ "gỗ" có nghĩa là tất cả các loại gỗ, và tất cả các dạng gia công của loại gỗ này được dùng để xây dựng, ví dụ gỗ rắn, gỗ-đặc, gỗ nhiều lớp và ván ép. Phương pháp xử lý gỗ theo sáng chế chủ yếu bao gồm tiếp xúc với chế phẩm theo sáng chế; điều này bao gồm ví dụ, ứng dụng trực tiếp, phun, nhúng thuốc, tiêm thuốc hoặc bất kỳ cách phù hợp nào khác.

Ngoài ra, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ các vật thể tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là vỏ tàu, lưới chắn, lưới, tòa nhà, neo đậu và hệ thống tín hiệu, khỏi bị bám bẩn.

Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để bảo vệ hàng hóa bảo quản. Hàng hóa bảo quản được hiểu là các chất tự nhiên có nguồn gốc thực vật hoặc động vật hoặc các sản phẩm chế biến của chúng có nguồn gốc tự nhiên và mong muốn được bảo vệ lâu dài.

Hàng hóa bảo quản có nguồn gốc thực vật, ví dụ cây hoặc các bộ phận thực vật, chẳng hạn như thân, lá, củ, hạt, quả, ngũ cốc, có thể được bảo vệ khi mới thu hoạch hoặc sau khi chế biến bằng cách sấy khô (sơ bộ), làm ẩm, trộn, nghiền, ép hoặc rang. Hàng hóa bảo quản cũng bao gồm gỗ, cả gỗ chưa qua xử lý, chẳng hạn như gỗ xây dựng, cột điện và hàng rào, hoặc ở dạng thành phẩm, chẳng hạn như đồ nội thất. Hàng hóa bảo quản có nguồn gốc động vật, ví dụ như da sống, da, lông thú và lông. Các chế phẩm trong sáng chế có thể ngăn ngừa các tác động bất lợi, chẳng hạn như thối rữa, mục nát, biến màu, mất màu hoặc hình thành nấm mốc.

Các vi sinh vật có khả năng phân huỷ hoặc làm thay đổi nguyên liệu công nghiệp bao gồm, ví dụ, vi khuẩn, nấm, nấm men, tảo và các sinh vật chất nhờn. Các hợp chất có công thức (I) tốt hơn là hoạt động chống lại nấm, đặc biệt là nấm mốc, nấm làm đổi màu gỗ và phá hủy gỗ (*Ascomycetes, Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* và *Zygomycetes*), và chống lại các sinh vật chất nhờn và tảo. Ví dụ bao gồm các vi sinh vật thuộc các chi sau: *Alternaria*, chẳng hạn như *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, chẳng hạn như *Aspergillus niger*;

Chaetomium, chẳng hạn như *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, chẳng hạn như *Coniophora puetana; Lentinus, chẳng hạn như Lentinus tigrinus; Penicillium,* chẳng hạn như *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, chẳng hạn như *Polyporus versicolor; Aureobasidium*, chẳng hạn như *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, chẳng hạn như *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, chẳng hạn như *Trichoderma viride*; *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* và *Tyromyces spp.*, *Cladosporium spp.*, *Paecilomyces spp. Mucor spp.*, *Escherichia*, chẳng hạn như *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, chẳng hạn như *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, chẳng hạn như *Staphylococcus aureus*, *Candida spp.* và *Saccharomyces spp.*, chẳng hạn như *Saccharomyces cerevisae.*

Ngoài ra, các hợp chất có công thức (I) còn có tác dụng chống nấm rất tốt. Các hợp chất này có phổ hoạt động chống nấm rất rộng, đặc biệt chống lại các loại nấm da và nấm men, nấm mốc và nấm hai pha (ví dụ chống lại các loài *Candida*, chẳng hạn như *Candida albicans, Candida glabrata*), và *Epidermophyton floccosum,* các loài Aspergillus, chẳng hạn như *Aspergillus niger* và *Aspergillus fumigatus,* các loài Trichophyton, chẳng hạn như *Trichophyton mentagrophytes,* các loài *Microsporon như Microsporon canis* và *audouinii*. Những loại nấm được liệt kê này hoàn toàn không tạo nên sự giới hạn của phổ bệnh nấm, và chỉ mang tính chất minh họa.

Các hợp chất này cũng có thể được sử dụng để kiểm soát nấm bệnh quan trọng trong nuôi cá và giáp xác, ví dụ như *saprolegnia diclina* ở cá hồi, *saprolegnia parasitica* ở tôm càng.

Do đó, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng cả trong các ứng dụng y tế và phi y tế.

Các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng như vậy, ở các công thức của chúng hoặc dạng sử dụng được điều chế từ đó, chẳng hạn như dung dịch được điều chế sẵn để sử dụng, huyền phù, bột thấm nước, bột nhão, bột hòa tan, thuốc bột và thuốc hạt. Việc sử dụng các hợp chất này có thể được thực hiện theo cách thông thường, ví dụ như bằng cách

tưới nước, phun, phun sương, gieo, phủ bột, tạo bọt, phát tán và những cách tương tự. Cũng có thể sử dụng hoạt chất theo phương pháp thể tích cực thấp hoặc tiêm chế phẩm hoạt chất/chính hoạt chất đó vào đất. Cũng có thể xử lý hạt giống của cây trồng.

Có thể xử lý tất cả các loài thực vật và các bộ phận của chúng theo sáng chế, tốt nhất là với các loài thực vật hoang dã và giống cây trồng, hoặc những loài thu được bằng các phương pháp nhân giống sinh học thông thường, chẳng hạn như lai hoặc dung hợp tế bào trần, và cả các bộ phận của chúng. Theo một phương án được ưu tiên hơn nữa, cây chuyển gen và giống cây trồng thu được bằng phương pháp kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp kết hợp với các phương pháp thông thường (Sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng được xử lý. Các thuật ngữ "các bộ phận" hoặc "các bộ phận thực vật" đã được giải thích ở trên. Tốt hơn nữa, các cây thuộc giống cây trồng có bán trên thị trường hoặc đang được sử dụng được xử lý theo sáng chế. Giống cây trồng được hiểu là cây trồng có các đặc tính mới ("đặc điểm") và thu được bằng cách nhân giống thông thường, bằng phương pháp gây đột biến hoặc bằng kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Chúng có thể là giống cây trồng, giống, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

Phương pháp xử lý theo sáng chế có thể được sử dụng trong việc xử lý các sinh vật biến đổi gen (GMO), ví dụ như cây trồng hoặc hạt giống. Cây biến đổi gen (hoặc cây chuyển gen) là cây trồng có gen dị hợp đã được tích hợp ổn định vào hệ gen. Khái niệm "gen dị hợp" về cơ bản có nghĩa là một gen được cung cấp hoặc ghép bên ngoài thực vật và khi được đưa vào trong bộ gen nhân, lục lạp hoặc ty thể sẽ mang lại cho cây biến đổi những đặc tính nông học mới hoặc cải tiến hoặc các đặc tính khác bằng cách biểu hiện một protein hoặc polypeptit tham gia hoặc bằng cách điều hòa giảm hoặc làm triệt âm (các) gen khác có trong cây (ví dụ, sử dụng công nghệ antisense, công nghệ đồng ức chế, can thiệp ARN công nghệ – ARNi hoặc microARN – công nghệ – miARN). Một gen dị hợp nằm trong bộ gen còn được gọi là gen chuyển. Một gen chuyển được xác định bởi vị trí cụ thể của nó trong bộ gen thực vật được gọi là sự biến đổi hoặc sự kiện chuyển gen.

Thực vật và giống cây trồng được ưu tiên xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các cây có nguyên liệu di truyền, có thể truyền lại các đặc điểm đặc biệt có lợi, có ích cho những cây này (cho dù thu được bằng cách nhân giống và/hoặc phương pháp công nghệ sinh học).

Thực vật và giống cây trồng cũng được ưu tiên xử lý theo sáng chế có khả năng chống lại một hoặc nhiều điều kiện bất lợi sinh học, tức là các loài thực vật đã nêu cho thấy khả năng bảo vệ tốt hơn đối với động vật và vi sinh vật gây hại, chẳng hạn như chống lại tuyến trùng, côn trùng, ve, nấm gây bệnh phytopathogenic, vi khuẩn , vi-rút và/hoặc viroid.

Thực vật và giống cây trồng cũng có thể được xử lý theo sáng chế là những thực vật có khả năng chống lại một hoặc nhiều điều kiện bất lợi phi sinh học. Các điều kiện bất lợi phi sinh học có thể bao gồm, ví dụ, hạn hán, tiếp xúc với nhiệt độ lạnh, tiếp xúc với nhiệt, điều kiện bất lợi thẩm thấu, lũ lụt, tăng độ mặn của đất, tăng tiếp xúc với khoáng chất, tiếp xúc với ôzôn, tiếp xúc với ánh sáng cao, hạn chế các chất dinh dưỡng nitơ, hạn chế các chất dinh dưỡng phospho, tránh bóng râm.

Thực vật và giống cây trồng cũng có thể được xử lý theo sáng chế, là những thực vật đặc trưng với các đặc tính năng suất nâng cao. Việc tăng năng suất ở các cây nói trên có thể là kết quả của việc, ví dụ như cải thiện sinh lý, sinh trưởng và phát triển của cây, chẳng hạn như hiệu quả sử dụng nước, hiệu quả giữ nước, cải thiện sử dụng nitơ, tăng cường đồng hóa cacbon, cải thiện quang hợp, tăng hiệu quả nảy mầm và tăng tốc độ trưởng thành. Hơn nữa, năng suất có thể bị ảnh hưởng bởi cấu trúc cây trồng được cải thiện (trong điều kiện bất lợi và không bất lợi), bao gồm nhưng không giới hạn ở, ra hoa sớm, kiểm soát ra hoa để sản xuất hạt lai, sức sống cây con, kích thước cây, số gióng và khoảng cách, sự phát triển của rễ, kích thước hạt giống, kích thước quả, kích thước vỏ, số vỏ hoặc số bắp, số hạt trên vỏ hoặc bắp, khối lượng hạt, tăng khả năng ra đầy hạt, giảm sự phát tán hạt, giảm nguy cơ bị rụng vỏ và khả năng chống đổ ngã cho cây. Các đặc điểm năng suất khác bao gồm chế phẩm hạt, chẳng hạn như hàm lượng và thành phần cacbohydrat, ví dụ như bông hoặc tinh bột, hàm lượng protein, hàm lượng và chế phẩm dầu, giá trị dinh dưỡng, giảm các hợp chất kháng dinh dưỡng, cải thiện khả năng xử lý và độ ổn định bảo quản tốt hơn.

Thực vật có thể được xử lý theo sáng chế là các cây lai đã biểu hiện đặc tính ưu thế lai dẫn đến năng suất, sức sống và khả năng chống chịu các điều kiện bất lợi sinh học và phi sinh học nói chung cao hơn.

Thực vật hoặc giống cây trồng (thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật chẳng hạn như kỹ thuật di truyền) có thể được xử lý theo sáng chế là cây trồng chịu được thuốc diệt cỏ, tức là cây chịu được một hoặc nhiều loại thuốc diệt cỏ nhất định. Những cây như vậy có thể thu được bằng cách biến đổi gen, hoặc bằng cách chọn lọc những cây có đột biến mang lại khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ như vậy.

Thực vật hoặc giống cây trồng (thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế là thực vật chuyển gen kháng sâu bệnh, tức là thực vật có khả năng chống lại sự tấn công của một số loài sâu bệnh mục tiêu. Những cây như vậy có thể được tạo ra bằng cách biến đổi gen, hoặc bằng cách chọn lọc những cây có đột biến mang lại khả năng kháng sâu bệnh.

Thực vật hoặc giống cây trồng (thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế để có khả năng chống chịu với các điều kiện bất lợi phi sinh học. Những cây như vậy có thể được tạo ra bằng cách biến đổi gen, hoặc chọn lọc những cây có chứa đột biến mang lại khả năng chống chịu các điều kiện bất lợi.

Thực vật hoặc giống cây trồng (thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế cho thấy số lượng, chất lượng và/hoặc độ ổn định bảo quản của sản phẩm thu hoạch bị thay đổi và/hoặc làm thay đổi các đặc tính của các thành phần cụ thể của sản phẩm thu hoạch.

Thực vật hoặc giống cây trồng (có thể thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế là thực vật, chẳng hạn như cây bông, có đặc điểm sợi bị biến đổi. Những cây như vậy có thể được tạo ra bằng

cách biến đổi gen, hoặc bằng cách chọn lọc những cây có chứa đột biến mang lại những đặc điểm sợi bị biến đổi như vậy.

Thực vật hoặc giống cây trồng (có thể thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật chẳng hạn như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế là các thực vật, chẳng hạn như cây cải dầu hoặc các cây thuộc họ Brassica, có đặc điểm đặc trưng của dầu bị biến đổi. Những cây như vậy có thể được tạo ra bằng cách biến đổi gen, hoặc bằng cách chọn lọc những cây chứa đột biến mang lại các đặc điểm đặc trưng của dầu bị biến đổi như vậy.

Thực vật hoặc giống cây trồng (có thể thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) cũng có thể được xử lý theo sáng chế là các thực vật, chẳng hạn như cây cải dầu hoặc cây thuộc họ Brassica, có đặc điểm rụng hạt bị biến đổi. Những cây như vậy có thể được tạo ra bằng cách biến đổi gen, hoặc bằng cách chọn lọc những cây có chứa đột biến mang lại những đặc điểm vỡ hạt bị thay đổi như vậy và bao gồm những cây như cây cải dầu có độ vỡ hạt giảm hoặc thời gian vỡ hạt chậm lại.

Thực vật hoặc giống cây trồng (có thể thu được bằng các phương pháp công nghệ sinh học thực vật như tạo gen) cũng có thể được xử lý theo sáng chế là thực vật, chẳng hạn như cây thuốc lá, với các dạng biến đổi protein hậu dịch mã bị thay đổi.

Các hợp chất theo sáng chế không chỉ kiểm soát hiệu quả các vi sinh vật gây bệnh không mong muốn mà còn cho thấy phản ứng tích cực của cây trồng như các hiệu ứng tăng cường sinh trưởng của cây trồng như nâng cao sức sống của cây trồng, tăng cường sự phát triển của rễ, tăng cường khả năng chịu hạn, nồng độ muối cao, nhiệt độ cao, lạnh, sương giá hoặc ánh sáng bức xạ, cải thiện ra hoa, sử dụng nước và chất dinh dưỡng hiệu quả (chẳng hạn như cải thiện đồng hóa nitơ), sản phẩm cây trồng chất lượng cao hơn, số lượng đẻ nhánh nhiều hơn, tăng cường khả năng chống nấm, côn trùng, sâu bệnh và những bệnh tương tự, dẫn đến năng suất cao hơn.

Theo một phương án, các hợp chất có công thức chung (I) như được công bố trong sáng

chế được sử dụng cho các ứng dụng phi nông học.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ hóa học

Các ví dụ sau đây trình bày cách thức và quy trình tạo ra các hợp chất theo sáng chế mà không phải là giới hạn của nó và bao gồm phương thức tốt nhất mà các nhà sáng chế dự tính để thực hiện sáng chế.

Ví dụ 1: Tổng hợp chất trung gian 3-bromo amidin (III):

a) N'-(3-bromo-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (III)

Bước 1: Điều chế axit 3-bromo-2,5-dimetylbenzoic (XXIV)

Một hỗn hợp gồm axit 2,5-dimetylbenzoic (2 g, 13,3 mmol) và axit sulfuric (20 mL) được làm lạnh đến 0 °C, N-bromosuccinimit (2,4 g, 13,3 mmol) được thêm vào hỗn hợp phản ứng và khuấy ở 0 °C trong 1,5 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đổ lên đá nghiền và chiết bằng etyl axetat (50 mL). Lớp etyl axetat được rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô trên natri sunfat khan và làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 50% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được axit 3-bromo-2,5-dimetylbenzoic (1,6 g, hiệu suất 52%), LCMS (M-1): 229,00.

Bước 2: Điều chế *tert*-butyl (3-bromo-2,5-dimetylphenyl)cacbamat

Hỗn hợp phản ứng của axit 3-bromo-2,5-dimetylbenzoic (1 g, 4,3 mmol), trietylamin (1,5 mL, 10,9 mmol) và azid diphenylphosphoryl (1,8 g, 6,5 mmol) trong *tert*-butanol khan được đun nóng ở 80 °C trong 6 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đổ lên đá nghiền và chiết bằng etyl axetat (50 mL). Lớp etyl axetat được rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô trên natri sunfat khan và làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 50% trong hexan làm dung

môi rửa giải hấp để thu được *tert*-butyl (3-bromo-2,5-dimetylphenyl)cacbamat (0,9 g, hiệu suất 69%).

Bước 3: Điều chế 3-bromo-2,5-dimetylanilin (XXIII)

Cho vào dung dịch gồm *tert*-butyl (3-bromo-2,5-dimetylphenyl)cacbamat (1 g, 3,3 mmol) trong diclometan (20 mL) từng giọt axit trifloaxetic (10 mL, 130 mmol) ở 0 °C. Hỗn hợp phản ứng tạo thành được khuấy ở 25 °C trong 6 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Hòa tan cặn thô thu được trong diclometan (30 mL) và rửa hai lần bằng dung dịch natri bicacbonat bão hòa (10 mL). Lớp hữu cơ được tách ra, rửa bằng dung dịch nước muối sau đó làm khô trên natri sunfat khan và làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 50% làm dung môi rửa giải hấp để thu được 3-bromo-2,5-dimetylanilin (0,45 g, 2,2 mmol, hiệu suất 67%). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 6,59 (s, 1H), 6,42 (s, 1H), 5,10 (s, 2H), 2,11 (s, 3H), 2,09 (s, 3H).

Bước 4: Điều chế N'-(3-bromo-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (III)

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-bromo-2,5-dimetylanilin (1,00 g, 5,0 mmol) trong trimetyl orthoformat (15 mL) một lượng axit *p*-toluenesulfonic monohydrat khan (0,05 g, 0,2 mmol) và hỗn hợp phản ứng tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, dung môi được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được hòa tan trong 1,4-dioxan (50 mL) trong môi trường nitơ, sau đó bổ sung N-etylmetylamin (0,9 mL, 10 mmol). Hỗn hợp phản ứng tạo thành được hồi lưu ở 80 °C trong 3 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-bromo-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (1 g, 3,5 mmol, hiệu suất 71 %). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,62 (brs, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,59 (s, 1H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 270,90.

b) N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Bước 1: điều chế 1-bromo-5-flo-2-metyl-3-nitrobenzen

Cho vào dung dịch 4-flo-1-metyl-2-nitrobenzen (2,00 g, 12,9 mmol) trong axit trifloaxetic (10 mL) một lượng axit sulfuric (3 mL) ở 0 °C, sau đó thêm N-bromosuccinimit (2,4 g 13,3 mmol) vào hỗn hợp phản ứng và khuấy hỗn hợp phản ứng ở 0 °C trong 1,5 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đổ qua đá nghiền và chiết bằng etyl axetat (50 mL). Lớp etyl axetat được rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô trên natri sunfat khan và làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 10% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 1-bromo-5-flo-2-metyl-3-nitrobenzen (2,2 g, 9,4 mmol, hiệu suất 73 %) ở dạng chất lỏng màu vàng. ^{1}H-NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,57 (dd, 1H), 7,50 (dd, 1H), 2,52 (s, 3H); GCMS: 234,9.

Bước 2: Điều chế 3-bromo-5-flo-2-metylanilin

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 1-bromo-5-flo-2-metyl-3-nitrobenzen (1,0 g, 4,3 mmol) trong etanol ngậm nước (15 mL, 2:1) một lượng bột sắt (1,7 g, 29,9 mmol) và amoni clorua (1,1 g, 21,3 mmol). Hỗn hợp sau phản ứng được đun nóng ở 80 °C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite và rửa kỹ bằng etyl axetat. Sản phẩm lọc kết hợp được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được trung hòa bằng dung dịch natri bicacbonat ngậm nước bão hòa (25 mL) và chiết ba lần bằng etyl axetat (50 mL). Các lớp etyl axetat kết hợp được rửa bằng nước, dung dịch nước muối và làm khô qua natri sunfat khan, làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 3-bromo-5-flo-2-metylanilin (0,8 g, 3,8 mmol, hiệu suất 89%); GCMS: 202.9.

Bước 3: Điều chế N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-bromo-5-flo-2-metylanilin (1,0 g, 4,9 mmol) trong 1,4-dioxan (10 mL) một lượng axit *p*-toluenesulfonic monohydrat (0,05 g, 0,2 mmol) và N-

(dimetoxymetyl)-N-metylethanamin (1,6 g, 12,3 mmol) và hỗn hợp phản ứng tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (1 g, 3,5 mmol, hiệu suất 72%) ở dạng chất lỏng màu nâu. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,75 (s, 1H), 7,01 (dd, 1H), 6,74-6,71 (m, 1H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 274,80.

c) N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Bước 1: Điều chế 1 -bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen

Cho vào hỗn hợp đã khuấy gồm 2-bromo-4-metyl-6-nitroanilin (2,0 g, 8,7 mmol) và đồng (I) clorua (1,7 g, 17,3 mmol) trong axetonitril (20 mL) từng giọt*tert*-butyl nitrite (2,7 g , 26 mmol) ở 0 °C. Sau khi hoàn thành quá trình thêm chất phản ứng, khuấy hỗn hợp phản ứng ở 25 °C trong 1 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được lọc qua lớp đệm celite, rồi rửa bằng axetonitril. Sản phẩm lọc được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được hòa tan trong etyl axetat (50 mL), được rửa bằng dung dịch amoni clorua ngậm nước, dung dịch nước muối và làm khô bằng natri sunfat khan. Làm bay hơi dung môi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat làm dung môi rửa giải hấp để thu được 1-bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen (1,6 g, 6,6 mmol, hiệu suất 76%). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8,02-7,97 (1H), 7,94-7,90 (1H), 2,40-2,37 (3H); GCMS: 252,80.

Bước 2: Điều chế 3-bromo-2-clo-5-metylanilin

Cho vào dụng dịch đã khuấy gồm 1-bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen (1,00 g, 4 mmol) trong etanol ngậm nước (15 mL, 2:1) một lượng bột sắt (1,6 g, 27,9 mmol) và amoni clorua (1,1 g, 20 mmol). Hỗn hợp sau phản ứng được đun nóng ở 80 °C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite và rửa

kỹ bằng etyl axetat. Sản phẩm lọc kết hợp được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được trung hòa bằng dung dịch natri bicacbonat ngậm nước bão hòa và chiết ba lần bằng etyl axetat (50 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, dung dịch nước muối, làm khô qua natri sunfat khan, được lọc và làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat làm dung môi rửa giải hấp để thu được 3-bromo-2-clo-5-metylanilin (0,8 g, 3,5 mmol, hiệu suất 89%) ở dạng chất lỏng màu nâu. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 6,73-6,71 (m, 1H), 6,59-6,57 (m, 1H), 5,57 (s, 2H), 2,15 (s, 3H); LCMS (M+1): 222,00.

Bước 3: Điều chế N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-bromo-2-clo-5-metylanilin (1,0 g, 4,5 mmol) trong 1,4-dioxan (10 mL) một lượng axit *p*-toluenulfonic monohydrat khan (0,04 g, 0,2 mmol) và N-(dimetoxymetyl)-N-metylethanamin (1,5 g, 11,3 mmol) và hỗn hợp tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,9 g, 3,3 mmol, hiệu suất 73 %) ở dạng chất lỏng màu nâu. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,74 (s, 1H), 7,13-7,11 (m, 1H), 6,84-6,78 (m, 1H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 290,80.

Ví dụ 2: Điều chế N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

a) Điều chế N'-(2,5-dimetyl-3-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Hỗn hợp được khuấy gồm N'-(3-bromo-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (1,0 g, 3,7 mmol), bis(pinacol)diboron (1,9 g, 7,4 mmol), [1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferocen] diclopalladium(II) diclometan [$PdCl_2$(dppf)-CH_2Cl_2] (0,2 g, 0,2 mmol) và kali axetat (0,7 g, 7,4 mmol) trong 1,4-dioxan (30 mL) được khử khí trong

5 phút bằng nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 95 °C trong 16 giờ trong môi trường khí nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan, lọc qua lớp đệm celite, phần cặn được rửa bằng diclometan (100 mL). Sản phẩm lọc kết hợp được rửa bằng dung dịch nước muối, được làm khô bằng natri sunfat khan. Các chất bay hơi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 10% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(2,5-dimetyl-3-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,8 g, hiệu suất 70 %).

b) Điều chế N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Một hỗn hợp gồm N'-(2,5-dimetyl-3-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,5 g, 1,6 mmol), (bromometyl)benzen (0,3 g, 1,6 mmol), $Pd(Ph_3p)_4$ [tetrakis(triphenylphosphin)palladium(0)] (0,09 g, 0,08 mmol) và kali cacbonat (0,5 g, 3,9 mmol) trong dioxan:nước (12 mL, 8:2) được khử khí bằng nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 100 °C trong 4 giờ trong môi trường khí nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite. Sản phẩm lọc được pha loãng với etyl axetat và rửa bằng nước muối, làm khô trên natri sunfat khan và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,4 g, 3,5 mmol, hiệu suất 63 %).

Ví dụ 3: Điều chế N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit

a) Điều chế 4-metyl-2-nitro-6-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)anilin

Hỗn hợp được khuấy gồm 2-bromo-4-metyl-6-nitroanilin (2,00 g, 8,7 mmol), bis(pinacol)diboron (4,4 g, 17,3 mmol), [1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferocen]diclopalladium(II) diclometan [$PdCl_2$(dppf)-CH_2Cl_2]

(0,35 g, 0,4 mmol) và kali axetat (2,1 g, 21,6 mmol) trong 1,4-dioxan (30 mL) được khử khí bằng nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 95 °C trong 16 giờ trong môi trường khí nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được pha loãng với diclometan, lọc qua lớp celite, phần cặn được rửa bằng diclometan (100 mL). Sản phẩm lọc kết hợp được rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô bằng natri sunfat khan và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 10% trong hexan để thu được 4-metyl-2-nitro-6-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)anilin (2 g, 7,3 mmol, hiệu suất 85 %) ở dạng chất rắn màu vàng. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,97 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,30 (s, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,33 (s, 12H); GCMS: 278,2.

b) Điều chế 2-(3-flobenzyl)-4-metyl-6-nitroanilin

Một hỗn hợp gồm 4-metyl-2-nitro-6-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)anilin (2,0 g, 7,2 mmol), 1-(bromometyl)-3-flobenzen (1,4 g, 7,2 mmol), tetrakis(triphenylphosphin)palladium(0) [$Pd(Ph_3P)_4$] (0,42 g, 0,4 mmol) và kali cacbonat (2,5 g, 17,9 mmol) trong dioxan:nước (35 mL, 8:2) được khử khí bằng nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 100 °C trong 4 giờ trong môi trường khí nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite. Sản phẩm lọc được pha loãng với etyl axetat (200 mL) và rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô bằng natri sunfat khan và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 10% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 2-(3-flobenzyl)-4-metyl-6-nitroanilin (1,4 g, 5,2 mmol, hiệu suất 73 %) ở dạng chất rắn màu vàng. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,74 (d, 1H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,14 (d, 1H), 7,09-7,00 (m, 3H), 3,98 (s, 2H), 2,16 (s, 3H); GCMS: 260,1.

c) Điều chế 2-bromo-1-(3-flobenzyl)-5-metyl-3-nitrobenzen

Cho vào hỗn hợp đã khuấy gồm 2-(3-flobenzyl)-4-metyl-6-nitroanilin (2,0 g, 8,3 mmol) và đồng (I) bromit (2,2 g, 15,4 mmol) trong axetonitril (20 mL) từng giọt *tert*-butyl nitrite (2,4 g, 23,0 mmol) ở 0 °C. Sau khi hoàn thành quá trình thêm chất phản ứng, khuấy hỗn hợp

phản ứng ở 25 °C trong 1 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được lọc qua lớp đệm celite, rửa bằng axetonitril. Sản phẩm lọc được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được hòa tan trong etyl axetat (50 mL), được rửa bằng dung dịch amoni clorua ngậm nước, dung dịch nước muối và làm khô bằng natri sunfat khan. Dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 2-bromo-1-(3-flobenzyl)-5-metyl-3-nitrobenzen (1,8 g, 5,5 mmol, hiệu suất 71%) ở dạng chất rắn màu vàng. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,68 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,37-7,31 (m, 1H), 7,07-7,01 (m, 3H), 4,17 (s, 2H), 2,32 (s, 3H); GCMS: 324,9.

d) Điều chế 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin

Một hỗn hợp gồm 2-bromo-1-(3-flobenzyl)-5-metyl-3-nitrobenzen (2,0 g, 6,2 mmol), axit metylboronic (0,7 g, 12,3 mmol), sản phẩm cộng $PdCl_2$(dppf)-CH_2Cl_2 (0,5 g, 0,6 mmol) và kali photphat tribasic (3,3 g, 15,4 mmol) trong dioxan:nước (35 mL, 8:2) được khử khí bằng nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 100 °C trong 4 giờ trong môi trường khí nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite. Sản phẩm lọc được pha loãng với etyl axetat (200 mL) và rửa bằng dung dịch nước muối, làm khô bằng natri sunfat khan và dung môi được loại bỏ dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 10% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 1-(3-flobenzyl)-2,5-dimetyl-3-nitrobenzen (1,4 g, 5,5 mmol, hiệu suất 89 %) ở dạng chất rắn màu vàng. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,55 (s, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,05-7,00 (m, 1H), 6,96 (d, 2H), 4,08 (s, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H); GCMS: 259,1.

e) Điều chế 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 1-(3-flobenzyl)-2,5-dimetyl-3-nitrobenzen (1 g, 3,8 mmol) trong etanol ngậm nước (15 mL, 2:1) một lượng bột sắt (1,0 g, 19,2 mmol) và amoni clorua (1,4 g, 27,0 mmol). Hỗn hợp sau phản ứng được đun nóng ở 80 °C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite

và rửa kỹ bằng etyl axetat. Sản phẩm lọc kết hợp được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được pha loãng với dung dịch natri bicacbonat ngậm nước bão hòa và chiết ba lần bằng etyl axetat (50 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, nước muối, làm khô qua natri sunfat khan, lọc và làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin (0,8 g, 3,4 mmol, hiệu suất 89%) ở dạng chất lỏng màu nâu. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,32-7,27 (m, 1H), 7,00-6,95 (m, 2H), 6,88 (d, 1H), 6,38 (s, 1H), 6,26 (s, 1H), 4,69 (s, 2H), 3,86 (s, 2H), 2,12 (s, 3H), 1,85 (s, 3H); GCMS: 229,1.

f) Điều chế N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin (1,0 g, 4,3 mmol) trong 1,4-dioxan (10 ml) một lượng axit *p*-toluenesulfonic monohydrat khan (0,04 g, 0,2 mmol) và N-(dimetoxymetyl)-N-metylethanamin (0,6 g, 4,3 mmol) và hỗn hợp tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit (0,9 g, 3,1 mmol, hiệu suất 70 %) ở dạng chất lỏng màu nâu. ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,57 (brs, 1H), 7,33-7,27 (m, 1H), 7,01-6,95 (m, 2H), 6,91-6,87 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s 3H), 2,04 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15.

Ví dụ 4: Điều chế N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit:

a) Điều chế 3-bromo-5-flo-2-metylanilin:

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 1-bromo-5-flo-2-metyl-3-nitrobenzen (10 g, 42,7 mmol) trong etanol ngậm nước (130 mL, 2:1) một lượng bột sắt (23,9 g, 427 mmol) và amoni clorua (22,9 g, 427 mmol). Hỗn hợp sau phản ứng được đun nóng ở 80 °C trong 2 giờ. Sau

khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite và rửa kỹ bằng etyl axetat (250 mL). Sản phẩm lọc kết hợp được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được pha loãng với dung dịch natri bicacbonat ngậm nước bão hòa và chiết ba lần bằng etyl axetat (150 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, dung dịch nước muối, làm khô qua natri sunfat khan, được lọc và làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 5% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được sản phẩm 3-bromo-5-flo-2-metylanilin mong muốn (8 g, 39,0 mmol, hiệu suất 91 %); GCMS: 202.9.

b) Điều chế N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-bromo-5-flo-2-metylanilin (8 g, 39,2 mmol) trong trimetyl orthoformat (50 mL) một lượng axit *p*-toluenesulfonic monohydrat khan (0,75 g, 3,9 mmol) và hỗn hợp tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được hòa tan trong 1,4-dioxan (50 mL) trong môi trường nitơ, sau đó bổ sung N-etylmetylamin (10,1 mL, 12 mmol). Hỗn hợp phản ứng tạo thành được hồi lưu ở 80 °C trong 3 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (8 g, 29,3 mmol, hiệu suất 75 %). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,75-7,64 (m, 1H), 7,00 (dd, 1H), 6,77-6,71 (m, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,01-2,92 (m, 3H), 2,25 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1) 272,7.

c) Điều chế

N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit

Một hệ huyền phù được khuấy gồm N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,7 g, 2,5 mmol), pyridin-2-amin (0,3 g, 3,1 mmol), cesi cacbonat (2,1 g, 6,4 mmol) trong toluen khan (10 mL) được khử khí bằng nitơ trong 15 phút. Paladi

axetat (0,03 g, 0,1 mmol) và 2,2′-bis(diphenylphosphino)-1,1′-binaphthyl) (BINAP) (0,16 g, 0,3 mmol) được thêm vào và hỗn hợp phản ứng được đun nóng ở 100 °C trong 16 giờ trong môi trường nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đi qua celite, rửa kỹ bằng etyl axetat (25 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa hai lần bằng nước (50 mL), một lần bằng dung dịch nước muối (50 mL), được làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 40% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit (0,3 g, 1 mmol, hiệu suất 38%); LCMS: 286,95.

d) Điều chế

N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit

Cho vào huyền phù gồm natri hydrit (0,06 g, 1,4 mmol) trong *N,N*-dimetylformamit (5 mL) từng giọt dung dịch N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit (0,2 g, 0,7 mmol) trong *N,N*-dimetylformamit (3 mL) ở 0-5 °C và khuấy hỗn hợp phản ứng trong 15 phút. Sau đó, thêm từng giọt metyl iot (0,12 g, 1,4 mmol) và tiếp tục khuấy trong 45 phút. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp được dập tắt trong nước đá lạnh, chiết hai lần bằng etyl axetat (50 mL). Lớp hữu cơ được rửa hai lần bằng nước (50 mL), sau đó rửa bằng dung dịch nước muối (50 mL), được làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit (0,16 g, 0,5 mmol, hiệu suất 74 %); LCMS: 301,4.

Ví dụ 5: Tổng hợp N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit:

a) Điều chế 1-bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen:

Cho vào dung dịch 2-bromo-4-metyl-6-nitroanilin (15 g, 64,9 mmol) trong axetonitril (150 mL) một lượng đồng (I) clorua (9,6 g, 97 mmol) và khuấy hỗn hợp phản ứng ở 25 °C trong 30 phút. Sau đó thêm từng giọt *tert*-butylnitrite (38,5 mL, 325 mmol) ở 0 °C và từ từ đưa hỗn hợp phản ứng về 25 °C dưới điều kiện tiếp tục khuấy trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được dập tắt bằng dung dịch amoni clorua ngậm nước và chiết ba lần bằng etyl axetat (200 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch nước muối (200 mL), làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được 1-bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen (12 g, 48 mmol, hiệu suất 74%); GCMS: 251,0.

b) Điều chế 3-bromo-2-clo-5-metylanilin:

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 1-bromo-2-clo-5-metyl-3-nitrobenzen (13 g, 51,9 mmol) trong etanol ngậm nước (130 mL, 2:1) một lượng bột sắt (29 g, 519 mmol) và amoni clorua (27,8 g, 519 mmol). Hỗn hợp sau phản ứng được đun nóng ở 80 °C trong 2 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 25 °C, lọc qua lớp đệm celite và rửa kỹ bằng etyl axetat. Sản phẩm lọc kết hợp được làm bay hơi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được pha loãng với dung dịch natri bicacbonat ngậm nước bão hòa và chiết ba lần bằng etyl axetat (250 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, dung dịch nước muối, làm khô qua natri sunfat khan, được lọc và làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được sản phẩm 3-bromo-2-clo-5-metylanilin (9,1 g, 41 mmol, hiệu suất 79 %); GCMS: 220,9.

c) Điều chế N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit:

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 3-bromo-2-clo-5-metylanilin (8,5 g, 38,5 mmol) trong trimetyl orthoformat (50 mL) một lượng axit *p*-toluenesulfonic monohydrat khan (0,7 g, 3,8 mmol) và hỗn hợp tạo thành được hồi lưu ở 105 °C trong 4 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được hòa tan trong

1,4-dioxan (50 mL) trong môi trường nitơ, sau đó bổ sung N-etylmetylamin (10,1 mL, 118 mmol). Hỗn hợp phản ứng tạo thành được hồi lưu ở 80 °C trong 3 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng etyl axetat 7% trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (8,9 g, 31,4 mmol, hiệu suất 82 %). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7,74-7,63 (m, 1H), 7,12 (q, 1H), 6,80 (d, 1H), 3,47-3,30 (m, 4H), 3,03-2,94 (m, 3H), 2,22 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1) 291,0.

d) Điều chế

N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit:

Một hỗn hợp gồm N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,7 g, 2,41 mmol), pyridin-2-amin (0,3 g, 3,1 mmol), cesi cacbonat (2 g, 6,0 mmol) trong toluen khan (10 mL) được khử khí bằng nitơ. Sau đó, paladi axetat (0,03 g, 0,1 mmol) và 2,2′-bis(diphenylphosphino)-1,1′-binaphthyl) (BINAP) (0,15 g, 0,2 mmol) được thêm vào và hỗn hợp phản ứng được đun nóng ở 100 °C trong 16 giờ trong môi trường nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đi qua celite và rửa bằng etyl axetat (50 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa hai lần bằng nước (50 mL), dung dịch nước muối (50 mL), được làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 40% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,5 g, 40,8 mmol, hiệu suất 72 %); LCMS: 303,4.

e) Điều chế N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Cho vào huyền phù natri hydrit (0,1 g, 1,7 mmol) trong *N,N*-dimetylformamit (5 mL) từng giọt dung dịch N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,3 g, 1,1 mmol) trong *N,N*-dimetylformamit (3 mL) ở 0-5 °C. Sau

khi khuấy trong 15 phút, thêm metyl iot (0,2 g, 1,4 mmol) vào hỗn hợp phản ứng và tiếp tục khuấy trong 1 giờ nữa. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được dập tắt trong nước đá lạnh, chiết hai lần bằng etyl axetat (50 mL). Lớp hữu cơ được rửa hai lần bằng nước (25 mL), dung dịch nước muối (50 mL), làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 10% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,22 g, 0,7 mmol, hiệu suất 62 %); LCMS: 317,40.

Ví dụ 6: Điều chế N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

a) Điều chế 2-clo-N-metoxy-N-metylaxetamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm N,O-dimetylhydroxylamin hydroclorua (25 g, 256 mmol) trong dietyl ete (50 mL) và nước (50 mL) một lượng kali cacbonat (78 g, 564 mmol), sau đó thêm 2-cloaxetyl clorua (24,50 mL, 308 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 25 °C trong 16 giờ. Sau khi phản ứng kết thúc, hỗn hợp phản ứng được dập tắt bằng cách thêm nước, hỗn hợp được chiết hai lần bằng 1,2-dicloromethane (250 mL) Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước (100 mL), nước muối (100 mL), làm khô trên natri sunfat và làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được 2-clo-N-metoxy-N-metylaxetamit (25 g, 182 mmol, hiệu suất 71%).

b) Điều chế 2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)-N-metoxy-N-metylaxetamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm 2-clo-4-metoxyphenol (2,77 g, 17,45 mmol) trong *N,N*-dimetylformamit (15 mL) một lượng kali cacbonat (4,02 g, 29,1 mmol), sau đó thêm 2-clo-N-metoxy-N-metylaxetamit (2 g, 14,54 mmol) và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 25 °C trong 16 giờ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được dập tắt bằng nước đá và chiết ba lần bằng etyl axetat (150 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, nước

muối, làm khô trên natri sunfat và dung môi được làm bay hơi dưới áp suất giảm để thu được 2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)-N-metoxy-N-metylaxetamit (2,9 g, 11,17 mmol, hiệu suất 77%).

c) Điều chế

N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Cho vào dung dịch đã khuấy gồm N'-(3-bromo-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,7 g, 2,56 mmol) trong tetrahydrofuran (10 ml) một lượng n-butyl liti (2,56 ml , 5,13 mmol) ở -78 °C. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở -78 °C trong 1 giờ, sau đó thêm vào 2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)-N-metoxy-N-metylaxetamit (0,799 g, 3,08 mmol) và khuấy hỗn hợp phản ứng trong 1 giờ ở -78 °C. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được dập tắt bằng dung dịch amoni clorua ngậm nước và chiết ba lần bằng etyl axetat (75 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước (50 mL), nước muối và làm khô bằng natri sunfat khan; làm bay hơi dung môi dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô được tinh chế thêm bằng cách điều chế sắc ký lỏng hiệu năng cao để thu được N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,116 g, 0,295 mmol, hiệu suất 11%).

Ví dụ 7: Điều chế

N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometyl)benzyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit

Một hệ huyền phù được khuấy gồm N'-(3-bromo-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,7 g, 2,417 mmol), (2-(triflometyl)phenyl)methanamin (0,441 mL, 3,14 mmol) và cesi cacbonat (1,969 g, 6,04 mmol) trong toluen khan (10 mL) được khử khí bằng nitơ trong 15 phút. Cho thêm vào hỗn hợp phản ứng này paladi axetat (0,027 g, 0,121 mmol) và 2,2′-bis(diphenylphosphino)-1,1′-binaphthyl) (BINAP) (0,151 g, 0,242 mmol) và hỗn hợp phản ứng được đun nóng ở 100 °C trong 16 giờ trong môi trường nitơ. Sau khi kết thúc phản ứng, hỗn hợp phản ứng được đi qua celite, rửa kỹ bằng etyl axetat

(25 mL). Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa hai lần bằng nước (50 mL), một lần bằng dung dịch nước muối (50 mL), được làm khô bằng natri sunfat khan, được lọc và cô đặc dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô tạo thành được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng 40% etyl axetat trong hexan làm dung môi rửa giải hấp để thu được N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometyl) benzyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit (0,16 g, 0,417 mmol, hiệu suất 17 %).

Các hợp chất sau đây trong Bảng-I thu được bằng cách sử dụng các quy trình tương tự như được mô tả trong sơ đồ 1-21 hoặc trong các ví dụ.

Bảng: I

Hợp chất số.	Tên IUPAC	Dữ liệu phân tích
1	N'-(2-clo-5-metyl-3-(p-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (s, 1H), 7,12 (s, 1H), 6,99-6,96 (m, 3H), 6,81 (s, 1H), 6,67 (d, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,20
2	N'-(2,5-dimetyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,53 (brs, 1H), 7,05 (d, 2H), 6,97 (d, 2H), 6,55 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,35-3,28 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,40
3	N'-(3-(3-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,56 (brs, 1H), 7,35-7,26 (m, 1H), 7,22-7,20 (m, 1H), 7,11 (s, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,59 (s, 1H),

		6,48 (s, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,15
4	N'-(2,5-dimetyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,60 (s, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,12-7,05 (m, 2H), 6,80-6,78 (m, 1H), 6,48 (s, 1H), 6,35 (s, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,65
5	N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,57 (brs, 1H), 7,33-7,27 (m, 1H), 7,01-6,95 (m, 2H), 6,91-6,87 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s 3H), 2,04 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15
6	N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74-7,41 (m, 1H), 7,14-7,09 (m, 1H), 7,03 (s, 1H), 6,97-6,93 (m, 1H), 6,76-6,71 (m, 1H), 6,67-6,63 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 6,37 (s, 1H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,40
7	N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63 (m, 1H), 7,16-7,01 (m, 2H), 6,89-6,82 (m, 2H), 6,44 (s, 2H), 3,59-3,32 (m, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,16 (s ,3H), 1,96 (s, 3H), 1,15-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 315,15
8	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (s, 1H), 7,41 (s, 1H), 7,23-7,18 (m, 2H), 6,93 (dd, 2H), 6,81-6,77 (m, 1H), 6,50 (dd, 1H), 6,32 (d, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 285,85

9	N'-(2-clo-5-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 1H), 7,39 (s, 1H), 7,22 (dd, 2H), 7,05-7,03 (m, 2H), 6,84 (t,1H), 6,70 (s, 1H), 6,38 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,16 (S, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 302,05
10	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (s, 1H), 7,18-7,10 (m, 2H), 6,76-6,71 (m, 2H), 6,65 (t, 1H), 6,50 (dd, 2H), 3,45-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,00
11	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,78 (s, 1H), 7,16-7,12 (m, 2H), 6,68-6,64 (m, 2H), 6,56-6,49 (m, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,93 (S, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,05
12	N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (bs, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,15-7,08 (m, 2H), 6,90-6,87 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,96 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 314,85
13	N'-(2-clo-3-(2-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (bs, 1H), 7,49-7,45 (m, 1H), 7,30-7,24 (m, 2H), 7,03-7,01 (m, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 4,09 (s, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 335,05
14	N'-(2-clo-3-(2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (bs, 1H), 7,30-7,24 (m, 1H), 7,20-7,06 (m, 3H), 6,69 (s, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,45

15	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (s, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,13-7,08 (m, 1H), 6,94-6,90 (m, 1H), 6,83-6,80 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,23 (d, 1H), 5,99-5,95 (m, 1H), 3,44-3,32(m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,45
16	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,12 (s, 1H), 7,75 (S, 1H), 7,47-7,44 (m, 2H), 6,87-6,84 (m, 2H), 6,59 (dd, 1H), 6,52 (d, 1H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,45
17	N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (s, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,00-6,96 (m, 3H), 6,69-6,65 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,40
18	N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66 (bs, 1H), 7,12-7,04 (m, 4H), 6,68-6,67 (m, 1H), 6,66-6,61 (m, 1H), 3,95 (m, 2H), 3,45-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 315,45
19	N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (s, 1H), 7,21-7,15 (m, 2H), 7,05-7,02 (m, 1H), 6,92-6,86 (m, 2H), 6,36 (d, 1H), 6,24 (dd, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 304,45
20	N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-5-flo-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,25-7,22 (m, 3H), 6,92-6,89 (m, 2H), 6,45 (dd, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,44-3,32

	2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	(m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,26 (s, 9H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 342,65
21	N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,61 (m, 2H), 7,57 (t, 1H), 7,45 (t,1H), 7,04 (d, 1H), 6,73 (s, 1H), 6,50-6,49 (m, 1H), 4,19 (s, 2H), 3,45-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,50
22	N'-(2-clo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (bs, 1H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,04-6,96 (m, 3H), 6,74-6,73 (m, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,15-1-11 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,55
23	N'-(2-clo-3-((2-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 7,24-7,19 (m, 1H), 7,13-7,09 (m, 3H), 7,01-6,97 (m, 1H), 6,37 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 320,20
24	N'-(2-clo-5-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (S, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,16 (t, 1H), 7,06-6,98 (m, 2H), 6,69 (s, 1H), 6,25 (s, 1H), 6,12 (d, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,17 (S, 3H), 2,10 (S, 3H), 1,17-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,15
25	N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (S, 1H), 7,26 (d, 2H), 7,19 (s, 1H), 7,04-7,01 (m, 2H), 6,65 (d, 1H), 6,30 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,27 (s, 9H), 1,17-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 359,95
26	N'-(2-clo-5-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)am	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,14 (s, 1H), 7,74 (S, 1H), 7,48- 7,45 (m, 2H), 6,97-6,94 (m, 2H), 6,79 (d, 1H), 6,57 (s, 1H),

	ino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	3,46-3,33 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 402,2
27	N'-(2-clo-3-(3-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (bs, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,24-7,21 (m, 1H), 7,19 (s, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,74-6,73 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,18-2,23 (m, 3H), 1,13-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,05
28	N'-(2-clo-3-(3-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,62 (bs, 1H), 7,21-7,17 (m, 1H), 6,77-6,74 (m, 3H), 6,70 (d, 1H), 6,65 (s, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,15
29	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 2H), 7,17 (q, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,48-6,57 (m, 3H), 6,41 (d, 1H), 3,39 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,22-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 303,8
30	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,09 (t, 1H), 6,54-6,46 (m, 3H), 6,38-6,33 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,45-3,332 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,15
31	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 2H), 7,17 (q, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,57-6,48 (m, 3H), 6,41 (d, 1H), 3,39 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,22-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 300,2
32	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,16-7,10 (m, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,41 (m, 1H), 6,27-6,23

	metylphenyl)-N-metylformimidamit	(m, 2H), 3,46-3,36 (m, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,15
33	N'-(3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 2H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 2H), 3,41 (dd, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,98 (t, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,15
34	N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 2H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 3H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,98 (S, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,70
35	N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73-7,59 (m, 2H), 7,18 (q, 1H), 6,77 (dd, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,68 (dt, 1H), 6,54 (td, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,42-3,33(m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 320,2
36	N'-(2-clo-5-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (s, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,14-7,08 (m, 1H), 6,90-6,81 (m, 2H), 6,67-6,65 (m, 2H), 6,36 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,25 (d, 3H), 2,17-2,15 (m, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,15
37	N'-(3-((3-clophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (S, 2H), 7,18 (t, 1H), 6,81-6,74 (m, 3H), 6,54 (dd, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46- 3,32 (m, 2H), 2,94 (S, 3H), 2,04 (S, 3H), 1,16-1,12 (M, 3H); LCMS (M+1): 320,40
38	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(m-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 6,66 (d, 1H), 6,53-6,48 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 3,44-3,35 (m, 1H), 3,12

	tolyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	(s, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1):314,20
39	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 2H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,98 (S, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,20-1,14 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,25
40	N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,77 (s, 1H), 7,09-7,13 (m, 1H), 6,74-6,80 (m, 1H), 6,41-6,45 (m, 1H), 6,22-6,27 (m, 2H), 3,33 (d, 3H), 3,19 (m, 3H), 3,15 (s, 3H), 2,97 (S, 3H), 1,14-1,23 (m, 3H); LCMS (M+1): 334,15
41	N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,13 (t, 1H), 6,81-6,74 (m, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,69-6,46 (m, 1H), 6,44-6,41 (m, 2H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,16 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,15
42	N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,09 (t, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,60 (dd, 2H), 6,41-6,36 (m, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,38 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,20
43	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,00 (t, 1H), 6,75-6,69 (m, 1H), 6,48 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,35-3,30 (m, 2H), 3,14 (d, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,25

44	N'-(2-clo-3-(4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,23-7,19 (m, 2H), 7,12-7,06 (m, 2H), 6,71-6,70 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,15
45	N'-(3-(2-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72-7,60 (m, 2H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,21-7,16 (m, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,48 (s, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,00
46	N'-(2-clo-3-(4-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,73 (m, 2H), 7,69 (brs, 1H), 7,37 (d, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,10 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 3H), 2,91 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,15
47	N'-(2-clo-3-(2-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,83-7,81 (m, 1H), 7,70-7,58 (m, 2H), 7,41 (t, 1H), 7,16 (d, 1H), 6,72 (s, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,20 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,15
48	N'-(2-clo-3-(3-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,55-7,48 (m, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,92 (S, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,15
49	N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76 (s, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,73 (d, 2H), 6,27 (d, 1H), 6,07-6,03 (m, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,44-3,41 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,17-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 346,80

50	N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,40-7,34 (m, 2H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,11-7,08 (m, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,59 (s, 1H), 4,05 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 385,35
51	N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,39 (d, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,11 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,35
52	N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,31-7,26 (m, 4H), 6,76 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,35
53	N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,47 (m, 5H), 6,78 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,12 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,15
54	N'-(2-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,37-7,30 (m, 2H), 7,20-7,16 (m, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,92 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,15
55	N'-(2-clo-3-(3,5-dimetylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 6,80 (d, 3H), 6,68 (d, 1H), 6,64 (s, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,21 (s, 6H), 2,19 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,40

56	N'-(2-clo-3-(3-clo-2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,69 (s, 1H), 6,64 (s, 1H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 1H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 355,10
57	N'-(2-clo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,05-7,02 (m, 1H), 6,95-6,86 (m, 2H), 6,66 (s, 1H), 6,39 (d, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,15
58	N'-(2-clo-3-((3-isopropylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H),7,57 7,25 (s, 1H), 7,13-7,09 (t, 1H), 6,97 (t, 1H), 6,85-6,83 (d, 1H), 6,73-6,71 (d, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,34 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,84-2,77 (m, 1H), 2,16 (s, 3H), 1,20-1,13 (m, 9H); LCMS (M+1): 344,25
59	N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73-7,60 (m, 2H), 7,25-7,21 (m, 2H), 7,01-6,97 (m, 2H), 6,69-6,68 (m, 1H), 6,42 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 336,15
60	N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 7,34 (s, 1H), 7,11-7,06 (m, 4H), 6,57 (d, 1H), 6,33 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (m+1): 320,15
61	N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (s, 1H), 7,08-7,05 (m, 2H), 7,01 (s, 1H), 6,90-6,87 (m, 2H), 6,41 (d, 1H), 6,21 (s, 1H), 3,74 (d, 3H), 3,44-3,32(m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,08

62	N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,18-7,14 (m, 2H), 6,78-6,73 (m, 2H), 6,50-6,46 (m, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 3,16 (d, 3H), 2,97 (t, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 350,15
63	N'-(2-clo-3-((3-isopropylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76 (d, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,74-6,70 (m, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,24 (dd, 1H), 3,36 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,97 (m, 3H), 2,75 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,16 (d, 9H); LCMS (M+1): 358,10
64	N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 6,76 (d, 2H), 6,69-6,65 (m, 2H), 6,51-6,48 (m, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,32 (m, 2H), 3,12 (d, 3H), 2,97 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,14 (d, 3H); LCMS (M+1): 346,3
65	N'-(2-clo-3-(4-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,07-7,03 (m, 1H), 6,93-6,87 (m, 2H), 6,68 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,245 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,20
66	N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,48-8,39 (m, 2H), 7,68-7,54 (m, 2H), 7,31-7,28 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,17-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 302,15
67	N'-(2-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,36-7,29 (m, 1H), 7,24-7,18 (m, 1H), 7,03- 6,99 (m, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,20

68	N'-(2-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,10-7,08 (m, 1H), 7,05-7,00 (m, 2H), 6,70 (d, 1H), 6,66 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,25
69	N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (S, 1H), 7,00-6,95 (m, 2H), 6,73 (d, 2H), 6,51-6,47 (m, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,93 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,24-1,14 (m, 3H)
70	N'-(3-benzyl-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (brs, 1H), 7,30-7,26 (m, 2H), 7,20-7,16 (m, 3H), 6,71 (s, 1H), 6,66 (s, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,52-3,36 (s, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 301,05
71	N'-(2-clo-3-(3,5-diflo-4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,96-6,89 (m, 2H), 6,76 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,95
72	N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (s, 1H), 7,32-7,26 (m, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,08-7,01 (m, 2H), 6,31 (s, 1H), 6,16 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 338,05
73	N'-(3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74-7,62 (m, 2H), 7,27-7,19 (m, 1H), 6,86-6,77 (m, 1H), 6,68-6,64 (m, 1H), 6,52-6,48 (m, 1H), 6,40 (d, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 322

74	N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,84-6,77 (m, 2H), 6,39 (t, 1H), 6,07-6,05 (m, 2H), 3,48-3,30 (m, 2H), 3,18 (d, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,18-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,4
75	N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72-7,61 (m, 2H), 7,29-7,21 (m, 1H), 6,96-6,93 (m, 1H), 6,81-6,77 (m, 1H), 6,69-6,67 (m, 1H), 6,44 (s, 1H), 3,48-3,32 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,14 (s, 3H); LCMS (M+1): 338,05
76	N'-(3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,29-7,23 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 7,01-6,96 (m, 2H), 6,29 (d, 1H), 6,08-6,05 (m, 1H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,15
77	N'-(3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,07 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 6,59 (dd, 1H), 6,52 (d, 1H), 6,46-6,41 (m, 1H), 6,39-6,34(m, 2H), 3,45 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,05
78	N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,10 (d, 1H), 7,75-7,62 (m, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,58 (s, 1H), 6,50-6,45(m, 3H), 3,47-3,33 (m, 2H), 3,01-2,93 (m, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,17-1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,95
79	N'-(3-benzyl-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,31-7,27 (m, 2H), 7,21-7,17 (m, 1H), 7,15-7,13 (m, 2H), 6,76 (s, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,41-3,38 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,00

80	N'-(3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,21-7,15 (m, 1H), 7,01-6,88 (m, 2H), 6,52-6,44 (m, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,89 (s, 3H), 1,15-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,2
81	N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76 (d, 1H), 7,20-7,13 (m, 1H), 6,80-6,74 (m, 2H), 6,49-6,43 (m, 1H), 6,21-6,16 (m, 1H), 3,48-3,33 (m, 2H), 3,14 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,45
82	N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,62 (d, 1H), 7,15-7,09 (m, 1H), 6,98-6,90 (m, 2H), 6,56 (s, 2H), 3,39-3,33 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,14-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,0
83	N'-(3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (d, 1H), 7,16-7,08 (m, 1H), 6,66 (d, 1H), 6,53 (d, 1H), 6,44-6,41 (m, 1H), 6,13 (t, 1H), 3,43-3,31 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 1,87 (s, 3H), 1,12-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,0
84	N'-(3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,72 (t, 1H), 6,59 (dd, 1H), 6,37 (t, 1H), 6,04 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,16 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,15-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,45
85	N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,09 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,89 (d, 1H), 6,72 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,4

86	N'-(2-clo-5-metyl-3-((3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,00 (dd, 1H), 7,72-7,61 (m, 1H), 7,48-7,46 (m, 1H), 7,20 (s, 1H), 6,74 (dd, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,45
87	N'-(5-clo-3-(4-flo-3,5-dimetylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 6,83 (d, 2H), 6,75 (d, 2H), 3,83 (s, 2H), 3,49-3,34 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,50
88	N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (brs, 1H), 7,22-7,19 (m, 1H), 7,16-7,09 (m, 2H), 6,86-6,84 (m, 1H), 6,77 (s, 1H), 6,44 (d, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,20
89	N'-(5-clo-3-(2-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (BRS, 1H), 7,51-7,47 (m, 1H), 7,31-7,25 (m, 2H), 7,04-7,00 (m, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,54 (d, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,93 (S, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15-1,11 (M, 3H); LCMS (M+1): 335,15
90	N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74-7,63 (m, 2H), 7,33 (t, 1H), 7,21 (t, 1H), 7,01 (d, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,52 (d, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,43-3,30 (m,2H), 2,93 (S, 3H), 2,10 (S, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1):381,05
91	N'-(2-clo-3-(2,6-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,43-7,37 (m, 1H), 7,16-7,10 (m, 2H), 6,66 (s, 1H), 6,32 (s, 1H), 4,02 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,00

92	N'-(2-clo-3-(2-clo-6-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,46-7,39 (m, 2H), 7,32-7,27 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,04 (s, 1H), 4,12 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,90
93	N'-(3-(4-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,48-7,45 (m, 2H), 7,14 (d, 2H), 6,73-6,68 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 380,85
94	N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,19-7,15 (m, 1H), 7,01 (d, 1H), 6,95 (d, 1H), 6,92 (s, 1H), 6,75 (d, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,27 (sz, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,90
95	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,10-8,07 (m, 2H), 7,68 (d, 1H), 7,55-7,50 (m, 1H), 7,19-7,14 (m, 1H), 6,82-6,79 (m, 1H), 6,72-6,68 (m, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,56-3,31 (m, 2H), 2,97 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 286,95
96	N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,06 (s, 1H), 7,69 (d, 1H), 6,62 (dt, 1H), 6,56 (dd, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,45 (dt, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,95
97	N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,10 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,68-6,63 (m, 2H), 6,57-6,52 (m, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,35

98	N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,78-7,59 (m, 1H), 7,15 (dd, 1H), 7,02-6,99 (m, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,54-6,44 (m, 1H), 6,23-6,19 (m, 1H), 3,33 (d, 2H), 3,01-2,92 (m, 6H), 1,98 (d, 3H), 1,89-1,85 (m, 3H), 1,13 (d, 3H); LCMS (M+1): 348,45
99	N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,79-6,77 (m, 2H), 6,60 (dt, 1H), 6,23 (t, 2H), 3,48-3,23 (m, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,15
100	N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (m,, 1H), 7,18 (dd, 1H), 6,96-6,89 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 6,43-6,31 (m, 1H), 3,45-3,33 (m, 3H), 2,97 (d, 1H), 2,52-2,50 (m, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,21-2,08 (m, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,20
101	N'-(5-clo-3-(3-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,11 (d,1H), 6,81-6,79 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,48-3,34 (m, 2H), 2,92 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (s, 3H); LCMS (M+1): 336,95
102	N'-(5-clo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,36-7,31 (m, 1H), 7,05-6,93 (m, 3H), 6,80-6,78 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,35
103	N'-(5-clo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,29-7,24 (m, 1H),7,20-7,15 (m, 1H), 7,13-7,09 (mz, 1H), 7,04 (td, 1H), 6,76 (s, 1H), 6,65 (d, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,40-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,45

104	N'-(5-clo-3-(2-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,84 (dd, 1H), 7,72-7,60 (m, 2H), 7,43 (td, 1H), 7,15 (d, 1H), 6,81-6,78 (m, 1H), 6,60 (d, 1H), 4,13 (s, 2H), 3,42-3,32 (s, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,50
105	N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (brs, 1H), 7,07 (d, 2H), 6,99 (d, 2H), 6,72-6,71 (m, 2H), 3,85 (s, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 321,50
106	N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 6,73 (t, 1H), 6,61-6,56 (m, 2H), 6,20 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,96 (s, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,16-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,45
107	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,11 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,36-7,40 (m, 1H), 6,80 (d, 2H), 6,62-6,59 (m, 1H), 6,10 (d, 1H), 3,28-3,46 (m, 2H), 2,98 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,16 (t, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,4
108	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,39-3,31 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,11-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,45
109	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,14-8,12 (m, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,41-7,36 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,65-6,59 (m, 2H), 6,08 (d, 1H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 300,38

110	N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,39-3,31 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,92 (d, 3H), 2,11 (d, 3H), 1,78 (s, 3H), , 1,05-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 364,3
111	N'-(2-clo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61-7,72 (m, 2H), 6,73 (d, 1H), 6,60 (s, 1H), 6,49 (d, 2H), 6,40 (d, 1H), 3,46 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,21 (d, 6H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
112	N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,[illegible] (t, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,62-7,58 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,38-7,36 (m, 1H), 6,54 (s, 1H), 3,35-3,45 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,26 (d, 6H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 351,27
113	N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,69-6,66 (m, 1H), 6,54 (d, 1H), 6,46 (d, 1H), 6,36 (dd, 1H), 3,47-3,30 (m, 5H), 2,97 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
114	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,53 (d, 1H), 6,43 (d, 1H), 6,38 (s, 1H), 6,35 (d, 1H), 3,47-3,33 (m, 2H), 3,01 - 2,93-(m, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,05 (d, 3H), 1,15-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,38
115	N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,88-6,84 (m, 2H), 6,76 (dd, 1H), 6,54 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,28

116	N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76 (s, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,82 (dd, 1H), 6,51 (d, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,23 (dd, 1H), 3,47-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,83
117	N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 6,87 (dd, 1H), 6,82 (s, 1H), 6,45 (d, 1H), 6,33 (dd, 1H), 3,37 (d, 2H), 3,04 (d, 3H), 2,92 (d, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,85 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,86
118	N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,15 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,49-7,48 (m, 1H), 6,65 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,13 (d, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,60 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 365,3
119	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,56 (dd, 1H), 6,28 (d, 1H), 6,11 (s, 1H), 6,04-6,00 (m, 1H), 3,30-3,47 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,0
120	N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,24 (d, 1H), 6,92 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,54 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,38 (d, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,3
121	N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,01 (m, 3H), 6,67 (d, 1H), 6,07 (d, 1H), 5,43-5,40 (m, 1H), 3,30-3,49 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,17 (s, 6H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,38

122	N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75-7,61 (m, 1H), 7,12 (s, 1H), 6,94-6,90 (m, 1H), 6,79-6,77 (m, 1H), 6,71-6,66 (m, 1H), 6,36-6,32 (m, 1H), 6,23-6,26 (m, 1H), 3,31-3,48 (m, 2H), 2,91-3,03 (m, 3H), 2,26-2,22 (m, 3H), 2,08 (dd, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,38
123	N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 6,95 (t, 2H), 6,92-6,88 (m, 1H), 6,86-6,82 (m, 1H), 6,37 (d, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,23 (d, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
124	N'-(5-clo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,18-7,08 (m, 4H), 6,77 (s, 2H), 3,92 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,10
125	N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,09 (d, 2H), 6,78 (s, 2H), 3,92 (s, 2H), 3,41-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,00
126	N'-(5-clo-3-(4-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70(brs, 1H), 7,34 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 6,78 (s, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 3H), 2,89 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 335,05
127	N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,51 (m, 4H), 7,42 (d, 1H), 6,86-6,74 (m, 2H), 4,05 (s, 2H), 3,41-3,311 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,17-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,75
128	N'-(5-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,06-7,01 (m, 2H), 6,97-6,93 (m, 1H), 6,75 (s, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,31 (m,

	metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 333,15
129	N'-(5-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,37-7,30 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 6,97-6,94 (m, 1H), 6,82-6,73 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 337,70
130	N'-(5-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,35-7,30 (m, 2H), 7,14-7,10 (m, 1H), 6,81-6,78 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 354,65
131	N'-(5-clo-3-(4-clo-3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 6,82-6,79 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,41-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12-1,06 (m, 3H); LCMS (M+1): 353,05
132	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,23-8,25 (m, 1H), 7,92 (q, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,76-7,64 (m, 1H), 6,86-6,78 (m, 2H), 6,60-6,54 (m, 1H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,93-3,01 (m, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 355,10
133	N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,57-7,73 (m, 1H), 7,19 (td, 1H), 7,13-7,09 (m, 2H), 6,68 (s, 1H), 6,13 (s, 1H), 5,59 (s, 1H), 3,47-3,35 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,16 (t, 3H), 2,04 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,50
134	N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,42-7,38 (m, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,15 (dt, 1H), 7,01-6,97 (m, 1H), 6,44-6,39 (m,

	metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	2H), 3,59-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,16 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,24
135	N'-(2-clo-5-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,36 (t, 1H), 8,01-74,98 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 6,96 (dd, 1H), 6,62 (s, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,8
136	N'-(3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,10 (dq, 1H), 6,78 (t, 1H), 6,42 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,79
137	N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,33 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,07-7,05 (m, 2H), 7,00-6,99 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 405,85
138	N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64-7,63 (m, 1H), 7,09 (td, 1H), 7,02-6,97 (m, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,39-6,38 (m, 1H), 3,39-3,30 (m, 2H), 3,17-3,15 (m, 3H),2,97- 2,88 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,13 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,86
139	N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,83-6,75 (m, 2H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,40
140	N'-(3-((4-clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 6,98-6,75 (m, 3H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,92-3,11 (m, 3H),

	flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	2,50-2,55 (m, 3H), 2,15-2,19 (m, 6H), 1,13-1,35 (m, 3H); LCMS (M+1): 347,86
141	N-etyl-N'-(5-flo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,31-7,25 (m, 1H), 7,22-7,17 (m, 1H), 7,15-7,11 (m, 1H),7,08-7,04 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,45-6,42 (m, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 303,40
142	N'-(3-(2-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,52-7,47 (m, 1H), 7,30-7,26 (m, 2H), 7,03-7,00 (m, 1H), 6,60 (d, 1H), 6,33-6,30 (m, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,35
143	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,77-7,55 (m, 2H), 7,58 (t, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,04 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,34 (dd, 1H), 4,10 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,17-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 353,40
144	N'-(3-(3-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,32 (t, 1H), 7,27-7,24 (m, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,11 (d, 1H), 6,59 (d, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,95
145	N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67-7,53 (m, 1H), 7,13-7,08 (m, 1H), 7,04-7,00 (m, 2H), 6,47 (dd, 1H), 6,34-6,27 (m, 1H), 3,40-3,29 (m, 2H), 3,13-3,10 (m, 3H), 2,99-2,83 (m, 3H), 2,10-2,04 (m, 3H), 1,58 (s, 3H), 1,11-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,41

146	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,01-6,91 (m, 3H), 6,56-6,51 (m, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15
147	N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,35-7,30 (m, 1H), 7,04-6,93 (m, 3H), 6,58 (d, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 302,95
148	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,16-7,09 (m, 2H), 6,86-6,84 (m, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,22-6,19 (m, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,93 (sz, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,10
149	N'-(3-benzyl-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,31-7,27 (m, 2H), 7,21-7,13 (m, 3H), 6,57-6,52 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 285,10
150	N'-(2-clo-3-(4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (brs, 1H), 7,10-7,07 (m, 2H), 6,82 (d, 2H), 6,65 (d, 1H), 6,62-6,58 (m, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,95
151	N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68-7,61 (m, 2H), 7,30 (t, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,03-7,01 (m, 1H), 6,54 (dd, 1H), 6,28 (dd, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,41-3,35 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,95

152	N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74-7,62 (m, 1H), 6,98-6,94 (m, 1H), 6,86-6,82 (m, 1H), 6,71 (td, 1H), 6,50-6,43 (m, 2H), 3,45-3,30 (m, 2H), 3,08 (s, 3H), 3,01-2,91 (m, 3H), 2,17 (d, 3H), 1,92-1,90 (m, 3H), 1,15-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 332,3
153	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,55 (d, 1H), 7,99 (dd, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,13 (dd, 1H), 6,60-6,54 (m, 1H), 6,12 (dd, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,95
154	N'-(5-clo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,08 (t, 1H), 6,70-6,67 (m, 3H), 6,62 (d, 1H), 6,52 (s, 1H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,1
155	N'-(5-clo-2-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73-7,61 (m, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,23-7,18 (m, 2H), 6,89 (dd, 2H), 6,82-6,78 (m, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,53-6,51 (m, 1H), 3,47-3,29 (m, 2H), 3,02-2,91 (m, 3H), 2,09 (d, 3H), 1,13 (dd, 3H); LCMS (M+1): 302,8
156	N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72-7,59 (m, 1H), 7,26 (dd, 1H), 7,17-7,14 (m, 1H), 6,94 (t, 1H), 6,63-6,59 (m, 2H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,16-3,11 (m, 3H), 3,02-2,92 (m, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 370,7
157	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,54-8,52 (m, 1H), 7,99-7,96 (m, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,14-7,11 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,39 (d, 1H), 3,36-3,32 (m, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,83

	yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	
158	N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,81-7,68 (m, 1H), 7,01 (s, 1H), 6,87-6,85 (m, 1H), 6,81-6,79 (m, 1H), 6,67-6,62 (m, 2H), 3,47-3,30 (m, 2H), 3,23 (s, 3H), 3,02-2,95 (m, 3H), 2,29 (d, 3H), 1,18-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 418,25
159	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,80 (s, 1H), 7,17-7,12 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,67 (t, 1H), 6,49 (d, 2H), 3,54-3,33 (m, 2H), 3,21-3,14 (m, 3H), 2,97 (d, 3H), 1,94 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,05
160	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,82-7,68 (m, 1H), 7,00-7,00 (m, 1H), 6,85-6,80 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,50-6,48 (m, 1H), 6,34 (s, 1H), 6,27 (dd, 1H), 3,48-3,29 (m, 2H), 3,15-3,12 (m, 3H), 3,02-2,93 (m, 3H), 2,22-2,18 (m, 3H), 1,95 (d, 3H), 1,19-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,1
161	N'-(3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,27 (s, 1H), 7,78-7,66 (m, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,98-6,94 (m, 2H), 6,63-6,53 (m, 2H), 3,49-3,30 (m, 2H), 3,01-2,95 (m, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 388,0
162	N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,98-6,94 (m, 2H), 6,90-6,86 (m, 2H), 6,47 (t, 1H), 6,37 (s, 1H), 3,73 (d, 3H), 3,38 (d, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,0

163	N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75-7,63 (m, 2H), 7,18-7,14 (m, 1H), 6,76-6,72 (m, 4H), 6,63 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 336,12
164	N'-(3-((3-bromophenyl)amino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,80-7,65 (m, 2H), 7,15-7,10 (m, 1H), 6,95-6,88 (m, 2H), 6,80-6,75 (m, 2H), 6,66-6,63 (m, 1H), 3,47-3,30 (m, 2H), 3,01-2,94 (m, 3H), 2,10-2,02 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,85
165	N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,62 (m, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,21-7,16 (m, 1H), 7,07-7,03 (m, 1H), 6,93-6,89 (m, 1H), 6,88-6,82 (m, 1H), 6,58-6,54 (m, 1H), 6,46 (t, 1H), 3,48-3,30 (m, 2H), 3,03-2,94 (m, 3H), 2,10-2,05 (m, 3H), 1,14 (t 3H); LCMS (M+1): 320,1
166	N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,80-7,64 (m, 2H), 7,22-7,16 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,68-6,63 (m, 2H), 6,55-6,50 (m, 2H), 33,49-3,30 (m, 2H), 3,04-2,90 (m, 3H), 2,09-2,02 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,95
167	N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (dd, 1H), 6,80-6,75 (m, 3H), 6,69 (d, 1H), 6,51 (td, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,45-3,29 (m, 2H), 3,09 (d, 3H), 3,02-2,91 (m, 3H), 1,93 (t, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 345,9
168	N'-(3-(2-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,86-7,84 (m, 1H), 7,73-7,62 (m, 2H), 7,46-7,43 (m, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,39 (dd, 1H), 4,15 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,93 (m, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,40

169	N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,02 (s, 1H), 6,74 (dd, 1H), 6,59-6,56 (m, 2H), 6,49 (d, 1H), 6,23 (s, 1H), 4,19 (td, 4H), 3,37 (d, 2H), 2,94 (d, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 360,7
170	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,41-7,37 (m, 2H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,61 (d, 1H), 6,43 (dd, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,43-3,30 (m,2H), 2,93 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,15
171	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,09 (d, 2H), 7,02 (d, 2H), 6,55-6,49 (m, 2H), 3,48-3,26 (sm, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,20
172	N'-(3-(4-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,35-7,23 (m, 2H), 7,15 (d, 2H), 6,56 (d, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,50-3,26 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,10
173	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brsz, 1H), 7,42 (t, 1H), 7,20-7,13 (m, 3H), 6,59 (d, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,30
174	N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 -7,60 (m, 3H), 7,53-7,46 (m, 2H), 6,60 (d, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,15

175	N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,58-7,4 (m, 2H), 7,10 (d, 2H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,55
176	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,29-7,24 (m, 4H), 6,58 (d, 2H), 3,97 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,20
177	N'-(2-clo-3-((2-(diflometoxy)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66 (d, 1H), 7,33 7,20 (d, 1H), 7,17-7,11 (m, 3H), 6,98-6,93 (m, 1H), 6,79 (s, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,41 (s, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,4
178	N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75-7,63 (m, 1H), 7,12-7,07 (m, 2H), 6,98-6,91 (m, 2H), 6,72-6,69 (m, 1H), 6,62 (d, 1H), 3,46-3,29 (m, 2H), 3,10 (s, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 333,95
179	N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 7,14-7,09 (m, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,44-6,40 (m, 1H), 6,25-6,21 (m, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,15 (d, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 334,1
180	N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,12 (t, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,67-6,65 (m, 1H), 6,43 (t, 1H), 6,37 (dd, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,16-3,13 (m, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95

181	N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometyl)benzyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,62-7,51 (m, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,41 (t, 1H), 6,01 (s, 1H), 5,91 (t, 1H), 5,78 (d, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,41 (d, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 384,05
182	N-etyl-N'-(5-flo-3-((4-flo-3-metylbenzyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,59 (s, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 7,06-7,02 (m, 1H), 5,89 (d, 1H), 5,79-5,75 (m, 1H), 5,73-5,70 (m, 1H), 4,24 (d, 2H), 3,46-3,35 (m, 1H), 3,28 (d, 1H), 2,90 (s, 3H), 2,19 (d, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,15
183	N'-(5-clo-3-((3-clobenzyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (s, 1H), 7,38-7,26 (m, 4H), 6,15 (s, 1H), 6,00 (d, 1H), 5,84 (t, 1H), 4,35 (d, 2H), 3,37 (d, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95
184	N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66 (d, 1H), 6,69-6,61 (m, 3H), 6,00-5,98 (m, 2H), 4,15-4,10 (m, 4H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,08-3,04 (m, 3H), 2,98-2,88 (m, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,18-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 374,1
185	N'-(5-clo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72-7,70 (m, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,11 (td, 1H), 6,92 (td, 1H), 6,80-6,77 (m, 2H), 6,44 (s, 1H),6,19-6,18 (m, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,01-2,91 (m, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,08 (d, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,9
186	N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrimidin-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,44-8,39 (m, 3H), 7,73-7,61 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,84-6,82 (m, 1H), 6,58-6,55 (m, 1H),

	ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	3,03-2,94 (m, 2H), 2,55-2,50 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,8
187	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,68 (s, 1H),8,44-8,38 (m, 2H), 7,75-7,63 (m, 1H), 7,01 (dd, 1H), 6,77 (t, 1H), 6,49 (d, 1H), 3,52-3,28 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,8
188	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66-7,55 (m, 3H), 7,31 (d, 2H), 6,57-6,55 (m, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,41-3,31 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,08 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,40
189	N'-(2-bromo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,60 (brs, 1H), 7,30 (t, 6,4 Hz, 1H), 7,02-6,94 (m, 3H), 6,71 (d, 1H), 6,65 (s, 1H), 4,05 (s, 2H), 3,42-3,13 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
190	N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metyl-2-(metylthio)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,62 (brs, 1H), 7,28 (t, 1H), 7,02-6,90 (m, 3H), 6,71 (d, 1H), 6,55 (s, 1H), 4,17 (s, 2H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,20
191	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(o-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 1H), 7,18-7,13 (m, 2H), 6,96-6,94 (m, 2H), 6,64 (s, 1H), 6,40 (t, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 6H), 1,96 (d, 6H), 1,12 (d, 3H); LCMS (M+1): 330,1
192	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,44-8,39 (m, 1H), 7,73-7,61 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,84-6,82 (m, 2H), 6,58-6,55 (m, 1H),3,67

	yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	(s, 3H), 3,03-2,94 (m, 2H), 2,55-2,50 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,75
193	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,58 (s, 1H), 8,26 (t, 1H), 8,06-8,04 (m, 1H), 7,89 (t, 1H), 7,74-7,61 (m, 1H), 7,15 (dd, 1H), 6,48 (d, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,11 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 288,1
194	N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,63 (s, 1H), 8,30 (t, 1H), 8,07-8,06 (m, 1H), 7,92-7,91 (m, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,32 (s, 1H), 6,56 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,15 (t,3H); LCMS (M+1): 304,1
195	N'-(2-clo-5-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,59-8,57 (m, 2H), 8,47 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 6,18 (s, 1H), 6,03 (s, 1H), 4,84 (d, 1H), 3,97-3,90 (m, 1H), 3,42-3,32 (m, 2H), 3,11 (q, 1H), 2,91-2,99 (m, 4H), 2,16 (d, 3H), 1,10-1,19 (m, 6H); LCMS (M+1): 345,85
196	N'-(2-clo-5-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,49 (d, 1H), 8,45 (s, 1H), 7,63-7,53 (m, 1H), 6,07 (d, 2H), 5,89 (t, 1H), 4,45 (d, 2H), 3,38 (d, 1H), 3,28 (s, 1H), 2,92 (d, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,10 (d, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,15
197	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,57 (q, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,59 (s, 1H), 6,04 (dd, 1H), 5,91 (d, 1H), 4,75 (d, 1H), 3,83 (dt, 1H), 3,33-3,35 (m, 1H), 3,29-3,24 (m, 1H), 3,09 (q, 1H), 2,87 (dd, 4H), 1,93-1,88 (m, 3H), 1,15 (d, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,15
198	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,47 (s, 1H), 8,44 (d, 1H), 7,62-7,53 (m, 1H), 5,94 (d, 1H), 5,86-5,81 (m, 2H), 4,41 (d, 2H),

	yl)metyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	3,37 (d, 1H), 3,21-3,30 (1H), 2,90 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,4
199	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,10 (q, 1H), 7,81-7,62 (m, 2H), 7,52 (s, 1H), 6,78-6,70 (m, 2H), 3,34-3,35 (m, 2H), 3,28 (d, 3H), 2,96 (d, 3H), 1,94-1,87 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 302,15
200	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,31 (s, 2H), 7,71 (d, 1H), 6,67-6,60 (m, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,31 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,87 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 301,85
201	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,57-7,51 (m, 3H), 7,44 (d, 1H), 6,60 (d, 2H), 4,05 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,50
202	N'-(3-(4-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,74 (m, 2H), 7,69 (brs, 1H), 7,33 (d, 2H), 6,60 (d, 2H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,45
203	N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,05-7,01 (m, 2H), 6,97-6,94 (m, 1H), 6,57-6,51 (m, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,50
204	N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ7,66 (brs, 1H), 7,16-7,12 (m, 2H), 7,11-7,05 (m, 2H), 6,61-6,51 (m, 2H), 3,90 (s, 2H), 3,40-

		3,30 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,20
205	N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,39-7,36 (m, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,13 (d, 1H), 6,57 (d, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,50
206	N'-(3-(4-clo-3-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 6,97 (d, 1H), 6,57 (d, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,40 -3,31 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,10
207	N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,53 (brs, 1H), 7,26-7,22 (m, 2H), 7,16-7,09 (m, 3H), 6,58 (s, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,48-3,33 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 281,50
208	N'-(2,5-dimetyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,53 (brs, 1H), 7,12 (t, 1H),6,96- 6,87 (m, 3H), 6,57 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 3,82 (s, 2H), 3,49-3,32 (m, 21H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,50
209	N'-(2-bromo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,19 (dd, 1H), 7,15-7,08 (m, 2H), 6,88-6,86 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,40 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 360,50
210	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,10 (q, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 6,84 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,27

	yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	(d, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,18-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,85
211	N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,60 (s, 1H), 8,25-8,23 (m, 1H), 8,06-8,04 (m, 1H), 7,90-7,88 (m, 1H), 7,76-7,63 (m, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,68-6,65 (m, 1H), 3,48-3,31 (m, 2H), 3,03-2,91 (m, 3H), 2,14-2,09 (m, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 304,00
212	N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,72 (s, 1H), 8,37 (d, 2H), 7,66 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,75 (t, 1H), 6,67 (s, 1H), 3,41-3,35 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 304,1
213	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,12-8,10 (m, 1H), 7,83-7,72 (m, 2H), 7,55 (d, 1H), 6,97-6,92 (m, 2H), 3,47-3,35 (m, 2H), 3,31 (d, 3H), 2,99 (d, 3H), 1,96 (d, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,4
214	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,33 (s, 2H), 7,73 (d, 1H), 6,87-6,85 (m, 2H), 6,70-6,67 (m, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,97-2,91 (m, 3H), 3,02-2,90 (m, 3H), 1,89 (s, 3H), 1,20-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,8
215	N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70-7,58 (m, 2H), 7,19 (td, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,45 (d, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14-1,06(m, 3H); LCMS (M+1): 399,05
216	N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-2-clo-5-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66 (brs, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,90 (dd, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,65 (s, 1H), 3,93 (s,

	metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	3H), 3,41-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 395,05
217	N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,52 (dd, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,63 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,93 (s 3H), 2,20 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 398,85
218	N'-(2-clo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 2H), 7,54-7,50 (m, 1H), 7,44-7,40 (m, 1H), 6,78-6,70 (m, 2H), 4,08 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 388,20
219	N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,56 (brs, 1H), 7,26-7,21 (m, 1H), 7,18-7,13 (m, 1H), 7,11-7,05 (m, 1H), 7,03-6,96 (m, 1H), 6,49 (d, 2H), 3,86 (s, 2H), 3,43-3,32 (m,2H), 2,90 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,45
220	N'-(3-(2-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,56 (brs, 1H), 7,44-7,40 (m, 1H), 7,23-7,17 (m, 1H), 6,90-6,84 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 6,39 (s, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,42-3,29 (m,2H), 2,88 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,08 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,05
221	N'-(3-(2-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63-7,59 (m, 1H), 7,26 (td, 1H), 7,15 (td, 1H), 6,89 (dd, 1H), 6,50 (s, 1H), 6,40 (s, 1H), 3,92 (m, 2H), 3,46-3,32 (3H), 2,90 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 359,40

222	N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72-7,40 (1H), 7,15-7,06 (m, 4H), 6,59 (s, 1H), 6,48 (s, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,40
223	N'-(3-(4-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,59-7,45 (m, 3H), 7,09 (d, 2H), 6,61 (s, 1H), 6,51 (s, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,48-3,27 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 361,15
224	N'-(3-(4-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64-7,52 (m, 1H)7,33-7,30 (m, 2H), 7,14-7,11 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 6,49 (s, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,05
225	N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9,06 (d, 1H), 7,90 (dd, 1H), 7,73 (d, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,15 (dd, 1H), 6,57 (dd, 1H), 6,39 (s, 1H), 3,35 (d, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 343,25
226	N'-(2-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,90 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,55-7,54 (m, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,45 (s, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,62 (q, 2H), 2,23 (s, 3H), 1,23 (t, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,85
227	N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,97 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,46-7,41 (m, 1H), 7,31-7,25 (m, 1H), 6,63-6,57 (m, 2H), 6,38 (d, 1H), 3,51-3,32 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,60 (q, 2H), 2,12 (s, 3H),1,24-1,19 (m, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,85

228	N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9,10 (d, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,76-7,60 (m, 3H), 7,27-7,19 (m, 1H), 6,76-6,75 (m, 1H), 6,44 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 359,35
229	N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (brs, 1H), 7,55 (dd, 1H), 7,17 (t, 1H), 6,81 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,35 (dd, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,50-3,32 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 338,00
230	N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,76-7,60 (m, 2H), 7,23-7,18 (m, 1H), 7,05-7,01 (m, 1H), 6,62-6,59 (m, 1H), 6,29 (dd, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,50-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 383,00
231	N-etyl-N'-(5-flo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73 (brs, 1H), 7,25-7,22 (m, 1H), 6,96 (td, 1H), 6,59 (dd, 2H), 6,27 (dd, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,50-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,30
232	N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,58-6,53 (m, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 378,25
233	N'-(3-(2-bromo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,79-7,63 (m, 2H), 7,12-7,07 (m, 1H), 6,79 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,33 (dd, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,51-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 383,15

234	N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,73-7,54 (m, 2H), 7,49-7,39 (m, 2H), 6,59 (d, 2H), 4,02 (s, 2H), 3,49-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 371,50
235	N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,86-6,82 (m, 2H), 6,72 (d, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,50-3,38 (m, 2H), 2,952(s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,50
236	N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,53 (dd, 1H), 7,35 (dd, 1H), 7,00 (t, 1H), 6,63-6,54 (m, 1H), 6,46 (dd, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,54-3,32 (m, 2H), 2,952 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t,3H); LCMS (M+1): 382,30
237	N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metoxybenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,67-6,63 (m, 1H), 6,58-6,54 (m, 3H), 6,51-6,48 (m, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,48-3,38 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,55
238	N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,98 (s, 1H), 7,79-7,68 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 6,71-6,66 (m, 1H), 6,60 (ddd, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 357,3
239	N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,26 (dd, 1H), 6,70 (d, 1H), 6,61 (dd, 1H), 6,45 (d, 1H), 5,82 (d, 1H), 3,34-3,47 (m, 2H), 3,27 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,60 (q, 2H), 1,89 (s, 3H), 1,22 (q, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,35

240	N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,98 (s, 1H), 7,78-7,65 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 6,77 (d, 2H), 6,61 (dd, 2H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 374,05
241	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,16 (m, 2H), 7,08 (d, 2H), 6,56-6,52 (m, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,48-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,55
242	N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9,04-9,10 (m, 1H), 7,89-7,96 (m, 1H), 7,71-7,77 (m, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,12 (dd, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,61 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 3H), 3,01-2,94 (m, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 360,1
243	N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,01 (s, 1H), 7,72-7,71 (m, 1H), 7,47-7,46 (m, 1H), 7,44-7,42 (m, 1H), 6,60-6,55 (m, 3H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,00-2,94 (m, 3H), 2,59 (q, 2H) 2,12 (s, 3H), 1,23-1,18 (m, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,1
244	N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,3-7,36 (m, 1H), 7,33-7,30 (m, 1H), 7,26-7,21 (m, 1H), 7,12 (d, 1H), 6,79-6,77 (m, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,39-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,15
245	N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75-7,61 (m, 2H), 7,58-7,52 (m, 1H), 7,44 (t, 1H), 7,02 (d, 1H), 6,81-6,78 (m, 1H), 6,54 (d, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,10

246	N'-(5-clo-3-(4-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74-7,72 (m, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,31 (d, 2H), 6,81-6,78 (m, 2H), 4,02 (s, 2H), 3,91-3,36 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,45
247	N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,36-7,33 (m, 2H), 7,32-7,27 (m, 1H), 7,06-7,04 (m, 1H), 6,79 (s, 1H), 6,64 (d, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,15
248	N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,41-8,38 (m, 2H), 7,69 (s, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,30-7,28 (m, 1H), 6,79 (s, 2H), 3,95 (s, 2H), 3,98-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 302,45
249	N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ7,69- 7,54 (m, 3H), 7,33 (d, 2H), 6,82-6,78 (m, 2H), 4,03 (s, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (d, 3H); LCMS (M+1): 370,10
250	N'-(5-clo-3-(3-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,51-7,44 (m, 2H), 6,81-6,78 (m, 2H), 3,99 (s, 2H), 3,40-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,20
251	N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,44-7,36 (m, 1H), 7,18-7,11 (m, 3H), 6,80-6,77 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,95-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,00

252	N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,17 (m, 2H), 7,08 (d, 2H), 6,76 (s, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,10
253	N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,30-7,26 (m, 1H), 6,89 (d, 1H), 6,84-6,83 (m, 1H), 6,49-6,46 (m, 1H), 5,84 (d, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,31 (d, 3H), 2,94-3,02 (m, 3H), 2,62 (q, 2H), 1,93 (s, 3H), 1,22 (t, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,0
254	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,79 (dd, 1H), 6,72 (dt, 1H), 6,38 (dd, 1H), 6,26 (d, 1H), 3,76 (s, 3H), 3,40 (d, 2H), 2,94 (d, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,4
255	N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,29 (s, 1H), 7,09-7,04 (m, 1H), 6,93 (dd, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,32 (s, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 351,0
256	N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,06 (t, 1H), 6,78 (dd, 1H), 6,72 (dq, 1H), 6,61 (d, 1H), 6,49-6,47 (m, 1H), 3,77 (d, 3H), 3,43-3,31 (m, 2H), 3,01-2,93 (m, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 350,35
257	N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71 (d, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,64 (d, 1H), 6,52 (dd, 1H), 6,36 (dd, 1H), 6,22-6,19 (m, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,35-3,44 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,0

258	N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 6,95 (t, 1H), 6,73-6,68 (m, 2H), 6,33 (dd, 1H), 6,21 (dt, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,38 (dt, 2H), 3,11 (d, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,25 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,15
259	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,06-8,03 (m, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,69-7,55 (m, 3H), 6,63-6,58 (m, 2H), 4,08 (s, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,21-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,45
260	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,41-8,35 (m, 2H), 7,67 (s, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,29 (dd, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,40-3,35 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 286,20
261	N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,59 (s, 1H), 7,15-7,11 (m, 2H), 7,09-7,04 (m, 2H), 6,35 (d, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,86 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,45
262	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63 (s, 1H), 7,18-7,15 (m, 1H), 7,11-7,04 (m, 2H), 6,80-6,78 (m, 1H), 6,26 (d, 1H), 6,08 (d, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,45
263	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,58 (s, 1H), 7,05 (d, 2H), 6,99 (d, 2H), 6,33 (d, 1H), 6,24 (d, 1H), 3,82 (s, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,40

264	N'-(3-(3-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,29 (t, 1H), 7,23-7,20 (m, 1H), 7,12 (d, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,38 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,49-3,32 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,12-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 332,00
265	N'-(3-(2-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (s, 1H), 7,47-7,44 (m, 1H), 7,26-7,20 (m, 2H), 6,95-6,93 (m, 1H), 6,31 (d, 1H), 6,17 (d, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,45-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,10
266	N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,27-7,21 (m, 1H), 7,18-7,13 (m, 1H), 7,10-7,06 (m, 1H), 7,02-6,97 (m, 1H), 6,27 (s, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,35
267	N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,81 (d, 1H), 6,72 (s, 1H), 6,36 (dd, 1H), 6,20 (d, 1H), 3,70 (d, 3H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,23-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 364,1
268	N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64 (s, 1H), 6,95-6,92 (m, 1H), 6,78-6,69 (m, 3H), 6,35 (s, 1H), 6,31 (d, 1H), 6,10 (d, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,64 (s, 3H), 3,35 (s, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 328,35
269	N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,58 (d, 1H), 7,16 (s, 1H), 6,98 (t, 1H), 6,68 (dd, 1H), 6,62 (dt, 1H), 6,26 (d, 1H), 6,05 (d, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,63 (s, 3H), 3,45 (s, 1H), 3,25-3,30 (1H), 2,92 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,35

270	N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,57 (d, 1H), 6,98-6,92 (m, 2H), 6,77-6,73 (m, 1H), 6,58-6,56 (m, 1H), 6,28 (d, 1H), 6,11 (s, 1H), 3,74-3,71 (m, 3H), 3,67 (d, 3H), 3,38 (d, 1H), 3,27 (d, 1H), 3,00 (d, 3H), 2,86 (s, 3H), 1,66 (d, 3H), 1,29-1,19 (m, 1H), 1,15-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 342,4
271	N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 6,94 (t, 1H), 6,34-6,26 (m, 1H), 6,18 (dt, 1H), 3,69 (d, 6H), 3,38-3,33 (m, 2H), 3,07 (d, 3H), 2,93 (d, 3H), 1,85 (s, 3H), 1,22 (s, 2H), 1,14-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 360,55
272	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,62 (d, 1H), 7,72-7,68 (m, 1H), 7,07 (dd, 2H), 6,85-6,83 (m, 1H), 6,79 (t, 1H), 6,25 (s, 1H), 3,71 (d, 3H), 3,32 (s, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 367,0
273	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,67 (s, 1H), 7,75-7,62 (m, 2H), 7,11 (d, 1H), 7,06 (dd, 1H), 6,96 (d, 1H), 6,49 (d, 1H), 3,40 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,95
274	N'-(5-clo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,69 (d, 1H), 7,74-7,63 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,92 (d, 1H), 6,69 (s, 1H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,95
275	N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,04 (dd, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,58-6,55 (m, 1H), 6,32 (s,

	metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	1H), 3,76 (s, 3H), 3,40 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95
276	N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,60 (d, 1H), 7,21 (s, 1H), 6,96 (dd, 1H), 6,67 (dd, 1H), 6,34 (td, 2H), 6,05 (d, 1H), 3,72 (d, 3H), 3,63 (s, 3H), 3,42 (d, 1H), 2,92 (s, 3H), 1,98 (d, 3H), 1,22 (s, 1H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,0
277	N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,62 (s, 1H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,02-6,97 (m, 2H), 6,93-6,89 (m, 1H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (d, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,42-3,31 (s, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,25
278	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61(brs, 1H), 7,15 (t, 1H), 6,99-6,95 (m, 2H), 6,91 (d, 1H), 6,36 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,84 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,25
279	N'-(3-(4-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,34-7,30 (m, 2H), 7,15-7,12 (m, 2H), 6,37 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,05
280	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,07-8,04 (m, 1H), 7,97-7,95 (m, 1H), 7,65-7,56 (m, 3H), 6,44 (d, 1H), 6,32 (d, 1H), 4,06 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 342,10
281	N-etyl-N'-(3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metoxy-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (s, 1H), 7,23-7,20 (m, 1H), 6,93 (td, 1H), 6,53 (dd, 1H), 6,32 (s, 1H), 6,15 (d, 1H), 3,83

	metylphenyl)-N-metylformimidamit	(s, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,31 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,00
282	N'-(3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (s, 1H), 6,90-6,81 (m, 2H), 6,72 (d, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,68 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,90
283	N'-(2-clo-5-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,72 (s, 1H), 7,77-7,73 (m, 2H), 7,28 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,02 (d, 1H), 6,59-6,57 (m, 1H), 3,45-3,30 (m, 2H), 3,02-2,95 (m, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,9
284	N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,71-7,69 (m, 1H), 6,92 (dd, 1H), 6,35 (s, 1H), 6,30-6,27 (m, 2H), 5,87 (td, 1H), 3,73-3,69 (m, 6H), 3,44-3,32 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 3,01-2,92 (m, 3H), 1,90-1,88 (m, 3H), 1,17-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 360,05
285	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63-7,74 (m, 1H), 7,54-7,58 (m, 2H), 7,00-7,02 (m, 1H), 6,44-6,46 (m, 2H), 6,24 (d, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,48-3,28 (m, 2H), 3,03-2,90 (m, 3H), 1,90-1,87 (m, 3H), 1,31-1,23 (m, 2H), 1,09-1,16 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,05
286	N'-(3-(3,4-diflobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,35-7,28 (m, 1H), 7,14-7,11 (m, 1H), 6,95-6,93 (m, 1H), 6,38 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,40

287	N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,46-7,44 (m, 1H), 7,08 (d, 2H), 6,37 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,68 (s, 4H), 3,47-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 376,15
288	N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 6,91 (dd, 1H), 6,73-6,69 (m, 2H), 6,30 (dd, 1H), 5,88 (td, 1H), 3,73 (s, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,22 (s, 2H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 363,8
289	N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,83-7,72 (m, 1H), 7,61 (t, 1H), 7,06 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,28 (t, 1H), 3,48-3,31 (m, 2H), 3,29 (s, 3H),3,03-2,92 (m, 3H), 1,93 (s, 3H), 1,24 (s, 1H), 1,18-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,0
290	N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,62-7,57 (m, 1H), 7,07-7,04 (m, 1H), 6,88-6,84 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 3,48-3,32 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,18-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 384,75
291	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69-7,88 (1H), 7,59 (d, 1H), 7,06-7,04 (m, 1H), 6,73 (dd, 2H), 6,26 (s, 1H), 3,49-3,31 (m, 3H), 2,98 (d, 3H), 1,92 (d, 3H), 1,25 (d, 2H), 1,15 (d, 3H); LCMS (M+1): 369,0
292	N-etyl-N'-(3-(3-flo-5-metylbenzyl)-5-metoxy-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 6,80 (d, 2H), 6,66 (d, 1H), 6,36 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,85 (s, 2H), 3,67 (s, 3H),

	metylphenyl)-N-metylformimidamit	3,45-3,37 (s, 1H), 2,90 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 328,80
293	N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,65-7,49 (m, 2H), 7,12 (td, 1H), 6,70 (dd, 1H), 6,31 (s, 1H), 6,21-6,19 (m, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,80
294	N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,63-7,54 (m, 2H), 7,27 (t, 1H), 7,15 (t, 1H), 6,92 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 6,16 (d, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (d, 3H), 1,11(t, 3H); LCMS (M+1): 374,75
295	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,64-7,43 (m, 3H), 7,33 (d, 2H), 6,39 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 365,30
296	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,61-7,47 (m, 4H), 7,41 (d, 1H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
297	N'-(5-xyano-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (s, 1H), 7,34-7,28 (m, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,18-7,14 (m, 1H), 7,07-6,93 (m, 3H), 4,00 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,89 (m, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,17- 1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 309,80

298	N'-(3-benzyl-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,58 (s, 1H), 7,27-7,22 (m, 2H), 7,16-7,10 (m, 3H), 6,35 (d, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,45-3,29 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 297,30
299	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,56-7,63 (m, 1H), 7,37-7,25 (m, 3H), 7,01 (d, 1H), 6,29 -6,26 (m, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,35
300	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,62 (d, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,11-7,07 (m, 1H), 6,75-6,71 (m, 1H), 6,53 (dd, 1H), 6,27 (d, 1H), 6,24 (s, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,36 (d, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,8
301	N'-(5-clo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,69 (d, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 6,83 (td, 1H), 6,67-6,59 (m, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,8
302	N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66 (d, 1H), 7,31 (dt, 1H), 7,24-7,20 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 7,00-6,92 (m, 2H), 6,55 (d, 1H), 6,48 (s, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,22 (s, 1H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,7
303	N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,37 (s, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 6,83 (td, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,47 (d, 1H), 6,38 (dd, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,8

	phenyl)-N-metylformimidamit	
304	N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,22 (dd, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 6,82 (dd, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,45-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 392,80
305	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,60 (s, 1H), 7,39 (t, 1H), 7,15-7,09 (m, 3H), 6,38 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,46-3,32 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,35
306	N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,66-7,44 (m, 5H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,30
307	N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,33 (s, 1H), 6,21 (d, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,48-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,95 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
308	N'-(3-benzyl-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,60 (s, 1H), 7,31-7,28 (m, 2H), 7,22-7,17 (m, 1H), 7,16- 7,13 (m, 4H), 4,00 (s, 2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 291,80
309	N'-(5-xyano-3-(3-xyanobenzyl)-2-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,77-7,66 (m, 2H), 7,63-7,62 (m, 1H), 7,53-7,47 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 4,07 (s,

	metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,92 (m, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,80
310	N'-(5-xyano-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,24-7,06 (m, 6H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,3
311	N'-(3-(4-clobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,34-7,30 (m, 2H), 7,16-7,12 (m, 4H), 3,97 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,05
312	N'-(5-xyano-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8,09-8,03 (m, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,61-7,56 (m, 2H), 7,25 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 4,15 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,14-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 337,30
313	N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,75 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,19-7,11 (m, 3H), 3,99 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 371,70
314	N'-(5-xyano-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7,77 (s, 1H), 7,40-7,28 (m, 3H), 7,17 (d, 1H), 7,04 (d, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 375,75

* Tên ghép được tạo bằng Chemdraw Professional 17.1

Như được mô tả trong công bố này, các hợp chất có công thức chung (I) cho thấy hoạt động diệt nấm được sử dụng liên quan đến loại nấm gây bệnh trên cây trồng tấn công các

cây trồng nông nghiệp quan trọng. Các hợp chất theo sáng chế đã được đánh giá hoạt động của chúng như được mô tả trong các thử nghiệm sau:

Ví dụ về thử nghiệm sinh học, *thử nghiệm in vitro*

Ví dụ 1: *Pyricularia oryzae* (Bệnh đạo ôn):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm tương đối là 60% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 1 2 3 4 5

6 7 8 9 10 12 13 14 15 16 17 18

19 20 21 22 23 24 25 28 29 30 31 32

33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 44 45

46 47 48 49 50 51 52 54 55 56 57 58

59 60 61 64 65 66 67 68 69 70 71 72

73 75 76 77 78 79 80 82 83 86 87 88

89 90 91 92 93 94 96 97 98 100 101 102

103 104 105 107 108 111 112 113 114 115 116 117

118 119 120 121 122 123 124 125 126 127 128 129

130 131 133 134 135 136 137 138 139 140 141 142

143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 154 155

157 159 160 161 162 163 164 165 166 167 168 169

170 171 172 173 174 175 176 177 178 179 181 182

183 185 188 189 190 191 201 202 203 204 205 206

207 208 213 214 216 217 218 219 220 221 222 223

224 225 228 229 230 231 232 233 234 235 236 237
238 240 241 242 243 244 245 246 247 248 249 250
251 252 253 254 255 259 261 262 263 264 265 266
267 271 272 273 274 275 276 286 287 288 289 290
291 292 293 294 295 296 297 298 299 300 301 302
303 304 305 306 307 308 309 310 311 313 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 2: *Rhizoctonia solani* (Bạc vỏ lúa/vẩy khoai tây đen):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 1 2 3 4 5 6 7 9
11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22
23 24 25 26 27 28 29 30 31 34 35 37
38 42 44 45 46 48 50 51 52 54 55 56
58 59 60 61 64 65 67 68 69 70 71 72
73 75 76 77 79 80 82 83 84 87 88 89
90 91 92 93 94 96 98 100 102 103 104 105
113 124 125 126 127 128 129 130 131 133 134 135
136 138 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149
150 151 152 154 161 162 163 164 165 167 168 169
170 171 172 173 174 175 176 177 178 181 182 183
185 188 189 190 191 201 202 203 204 205 206 207

208 209 213 214 216 217 218 219 220 221 222 223
224 229 230 231 232 233 234 235 236 237 239 241
242 243 244 245 246 247 253 254 255 259 260 261
262 263 264 265 266 273 274 275 276 286 287 292
293 294 295 296 298 299 300 301 302 303 305 306
307 308 311 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 3: *Botrytis cinerea* (Mốc xám):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 22 °C và độ ẩm tương đối là 90% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 2 3 4 5
8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19
20 21 22 24 25 26 27 29 31 32 33 34
35 37 38 40 41 42 43 44 45 46 50 51
52 54 55 56 57 58 59 60 62 63 65 67
68 70 71 72 73 76 77 79 80 81 83 84
87 88 89 90 91 92 93 94 96 98 100 102
103 105 106 110 117 118 119 122 123 124 125 126
128 129 133 134 136 140 141 142 143 144 145 146
147 148 149 150 151 152 159 160 161 163 164 166
170 171 172 173 174 175 176 178 179 181 182 183
185 188 191 201 202 203 204 205 206 207 208 213

216 217 220 221 222 223 224 229 230 231 232 233
235 236 237 244 245 246 247 259 261 262 263 264
265 273 274 286 287 288 292 293 294 295 296 297
299 301 302 303 305 307 308 310 311 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 4: *Alternaria solani* (bệnh bạc sớm ở cà chua/khoai tây):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm tương đối là 60% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 1 2 3 4 5
6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17
18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29
30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41
42 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53
54 55 56 57 58 59 60 61 62 63 64 65
66 67 68 69 70 71 72 73 74 75 76 77
78 79 80 81 82 83 84 85 86 87 88 89
90 91 92 93 94 96 98 100 101 102 103 104
105 106 108 110 112 113 114 115 116 117 118 119
120 121 123 124 125 126 127 128 129 130 131 133
136 137 138 140 142 143 144 145 146 147 148 149
150 151 152 153 154 155 156 157 159 160 161 162

163	164	165	166	167	168	169	170	171	172	173	174
175	176	177	178	179	180	181	182	183	185	188	189
190	191	201	202	203	204	205	206	207	208	209	213
214	216	217	218	219	220	221	222	223	224	225	226
227	228	229	230	231	232	233	234	235	236	237	238
239	240	241	242	243	244	245	246	247	253	254	255
259	260	261	262	263	264	265	266	268	269	271	272
273	274	275	276	286	287	288	289	290	291	292	293
294	295	296	297	298	299	300	301	302	303	304	305

306 307 308 310 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 5: *Colletotrichum capsici* (thán thư):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm tương đối là 60% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 1 2 3 4 5

7	9	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20
21	23	24	25	26	27	31	34	35	36	37	38
39	40	41	44	45	46	48	50	51	56	58	59
60	61	62	65	67	68	71	73	75	77	79	88
89	90	91	92	93	94	96	98	100	101	102	103
105	112	113	114	115	116	118	120	123	124	125	126
128	129	131	133	139	143	144	150	152	156	161	162

163 171 172 181 183 189 190 201 203 204 207 208
209 213 216 217 219 220 221 222 223 224 225 226
233 235 236 244 245 246 254 255 263 275 287 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 6: *Septoria lycopersici / Corynespora cassicola* (CORYCA) (Bệnh đốm lá cà chua):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm tương đối là 70% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 2 3 4 5 6
9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20
22 23 24 25 29 30 31 35 36 37 38 43
44 50 51 52 54 55 56 58 59 60 67 70
72 73 76 77 79 84 89 91 92 94 96 100
101 103 112 113 114 115 116 117 118 119 120 121
123 124 125 126 128 129 130 131 133 136 138 140
141 142 143 144 145 146 147 148 149 151 159 161
162 163 164 165 166 188 189 191 201 203 204 205
206 207 208 209 213 214 216 217 219 220 221 222
223 224 226 235 236 237 243 259 261 262 263 264
265 266 271 272 273 274 275 276 286 287 291 292
293 294 295 296 297 299 300 301 302 303 305 307
308 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử

nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ 7: *Fusarium Culmorum* (Thối chân ở ngũ cốc):

Các hợp chất được hòa tan trong 0,3% dimetyl sunfoxit và sau đó được thêm vào môi trường potato dextrose agar ngay trước khi được phân phối vào các đĩa petri. 5 mL môi trường với hợp chất ở nồng độ mong muốn được phân phối vào các đĩa petri vô trùng 60 mm. Sau khi hóa rắn, mỗi tấm được cấy một đĩa sợi nấm kích thước 5 mm, được lấy từ ngoại vi của đĩa nuôi cấy độc lực đang phát triển mạnh. Các tấm được ủ trong buồng tăng trưởng ở nhiệt độ 25 °C và độ ẩm tương đối là 60% trong bảy ngày, sau đó tiến hành đo tốc độ tăng trưởng hướng tâm và so sánh với khả năng kiểm soát sâu bệnh của nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc. Các hợp chất 1 2 3 4 5 12 13 17 18 20 25 26 35 44 46 51 52 54 55 56 59 73 77 87 88 105 112 116 120 124 125 126 129 142 162 163 164 188 190 204 207 208 214 220 221 222 223 224 236 246 261 262 263 264 265 266 271 275 286 287 292 293 294 295 299 305 307 ở nồng độ 300 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ về thử nghiệm sinh học thử nghiệm *in vivo* trên thực vật

Ví dụ A: Thử nghiệm *Pyricularia oryzae trên lúa (Nấm đạo ôn ở lúa)*

Các hợp chất được hòa tan trong 2% dimetyl sunfoxit/axeton và sau đó trộn với nước có chứa chất nhũ hóa đến thể tích phun đã hiệu chuẩn là 50 mL. Dung dịch phun 50 mL này được đổ vào bình xịt để sử dụng tiếp.

Để kiểm tra hoạt động phòng bệnh của các hợp chất, cây lúa/cây lúa non khỏe mạnh được nuôi trong nhà kính đã được phun chế phẩm hợp chất hoạt động với tỷ lệ sử dụng đã nêu

bên trong tủ phun bằng vòi phun hình nón hallowcone. Một ngày sau khi xử lý, cây được cấy với huyền phù bào tử (nước vô trùng) có chứa $1,4x10^6$ chủng nấm *Pyricularia oryzae*. Sau đó, các cây đã cấy được giữ trong buồng nhà kính ở nhiệt độ 24 °C và độ ẩm tương đối 95% để biểu hiện bệnh.

Một đánh giá trực quan về hiệu quả của hợp chất đã được thực hiện bằng cách đánh giá mức độ nghiêm trọng của bệnh (tỷ lệ 0-100%) trên các cây được xử lý bằng thuốc trong 3, 7, 10 và 15 ngày sau khi sử dụng. Hiệu quả (% kiểm soát) của các hợp chất được tính bằng cách so sánh xếp hạng bệnh trong các điều trị với kiểm soát nhóm không được điều trị. Các cây được xử lý bằng thuốc cũng được đánh giá về khả năng tương thích của cây bằng cách ghi lại các triệu chứng như hoại tử, úa lá và còi cọc. Các hợp chất 50 51 52 54 55 94 178 180 181 277 ở nồng độ 500 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ B: *Thử nghiệm Botrytis cinera* trên cà chua

Các hợp chất được hòa tan trong 2% dimetyl sunfoxit/axeton và sau đó trộn với nước có chứa chất nhũ hóa đến thể tích phun đã hiệu chuẩn là 50 mL. Dung dịch phun 50 mL này được đổ vào bình xịt để sử dụng tiếp.

Để kiểm tra khả năng phòng bệnh của các hợp chất, cây đậu/ớt non khỏe mạnh được nuôi trong nhà kính đã được phun dạng điều chế hợp chất hoạt tính với tỷ lệ sử dụng đã nêu bên trong thùng phun bằng vòi phun hình phễu. Một ngày sau khi được xử lý bằng thuốc, cây được cấy với huyền phù bào tử có chứa $1,2x10^6$ (2% mạch nha) chủng nấm *Botrytis cinerea.* Các cây được tiêm sau đó được giữ trong buồng nhà kính ở nhiệt độ 18-20 °C và độ ẩm tương đối 90-100 % để thấy được biểu hiện bệnh.

Một đánh giá trực quan về hiệu quả của hợp chất đã được thực hiện bằng cách đánh giá mức độ nghiêm trọng của bệnh (tỷ lệ 0-100%) trên các cây được xử lý bằng thuốc trong 3,

7, 10 và 15 ngày sau khi sử dụng. Hiệu quả (% kiểm soát) của các hợp chất được tính bằng cách bằng cách đánh giá cây trồng được xử lý thuốc và cây không được xử lý thuốc. Các cây được xử lý bằng thuốc cũng được đánh giá về khả năng tương thích của cây bằng cách ghi lại các triệu chứng như hoại tử, úa lá và còi cọc. Các hợp chất 27 36 39 45 49 192 258 263 264 269 282 ở nồng độ 500 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh.

Ví dụ C: Thử nghiệm *Phakopsora pachyrhizi* ở đậu tương

Các hợp chất được hòa tan trong 2% dimetyl sunfoxit/axeton và sau đó trộn với nước có chứa chất nhũ hóa đến thể tích phun đã hiệu chuẩn là 50 mL. Dung dịch phun 50 mL này được đổ vào bình xịt để sử dụng tiếp.

Để kiểm tra tác dụng phòng bệnh của các hợp chất, những cây đậu tương non khỏe mạnh được nuôi trong nhà kính đã được phun bằng chế phẩm hợp chất hoạt động với tỷ lệ sử dụng đã nêu bên trong tủ phun bằng vòi phun hình nón hallowcone. Một ngày sau khi xử lý, cây được cấy với huyền phù có chứa bào tử $2x10^5$ bào tử *Phakopsora pachyrhizi*. Các cây được tiêm sau đó được giữ trong buồng nhà kính ở nhiệt độ 22-24 °C và độ ẩm tương đối 80-90 % để thấy được biểu hiện bệnh.

Một đánh giá trực quan về hiệu quả của hợp chất đã được thực hiện bằng cách đánh giá mức độ nghiêm trọng của bệnh (tỷ lệ 0-100%) trên các cây được xử lý bằng thuốc trong 3, 7, 10 và 15 ngày sau khi sử dụng. Hiệu quả (% kiểm soát) của các hợp chất được tính bằng cách so sánh xếp hạng bệnh trong điều trị với kiểm soát nhóm không được điều trị. Các cây được phun thuốc cũng được đánh giá về khả năng tương thích của cây bằng cách ghi lại các triệu chứng như hoại tử, úa lá và còi cọc. Các hợp chất 14 16 17 18 20 21 22 23 26 28 29 30 31 32 33 34 36 38 39 40 41 42 43 44 45 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 65 66 67 68

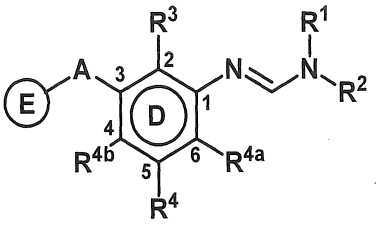
69	70	71	77	79	80	81	84	85	86	87	88
89	90	91	92	93	94	95	98	100	101	102	103
104	105	109	111	113	114	115	116	117	119	120	121
122	123	124	125	126	127	128	129	130	131	133	134
143	144	145	146	147	148	149	150	151	152	153	155
156	157	159	160	161	178	179	181	182	183	184	185
187	188	189	190	191	192	193	194	195	196	201	202
203	204	205	206	207	208	209	210	211	214	215	216
217	218	219	220	221	222	223	224	229	230	231	232
233	234	235	236	237	239	242	253	255	259	261	262
263	264	266	270	273	274	275	276	277	278	279	281
282	284	286	287	294	295	296	297	298	299	300	301

ở nồng độ 500 ppm cung cấp khả năng kiểm soát tối thiểu 70% trong các thử nghiệm này khi so sánh với kết quả kiểm tra trên nhóm đối chứng không được xử lý bằng thuốc thì cho thấy sự phát triển nhanh của sâu bệnh

Sau khi mô tả sáng chế có tham chiếu đến các khía cạnh được ưu tiên nhất định, các khía cạnh khác sẽ trở nên rõ ràng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này khi xem xét mô tả sáng chế này. Đối với những người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này, sẽ thấy rõ rằng nhiều sửa đổi, cả về nguyên liệu và phương pháp, có thể được thực hiện mà không cần rời khỏi phạm vi của sáng chế.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I),



Công thức (I)

trong đó,

R^1 là C_1-C_6-alkyl;

R^2 là C_2-C_6-alkyl;

R^3 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″ và C_3-C_8-xycloalkyl;

R^4 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$, (C=O)-R″, C_3-C_8-xycloalkyl và C_7-C_{12}-aralkyl;

R^{4a} và R^{4b} là hydro;

A tương ứng với $-\{[C(R^6R^7)]_{0-2}-(B)_{0-1}\}-$; trong đó B tương ứng với NR^5 hoặc CR^6R^7; hoặc A tương ứng với $-O-CR^6R^7-C(O)-$ hoặc $-NR^5-CR^6R^7-C(O)-$;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro và C_1-C_6-alkyl;;

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-haloalkyl và C_3-C_4-xycloalkyl;

vòng E được chọn từ nhóm gồm có phenyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, indolyl, benzimidazolyl, indazolyl, benzofuranyl, benzothiophenyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolinyl, isoquinolinyl, quinazolinyl and indolizinyl, có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều nhóm R^8;

R^8 được chọn từ nhóm gồm có hydro, X, xyano, nitro, C_1-C_6-alkyl, C_2-C_6-alkenyl, C_2-C_6-alkynyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_2-C_6-haloalkynyl, C_3-C_6-xycloalkyl, C_6-aryl, C_3-C_6-heteroxyclyl, SCN, SF_5, N(R′R‴), OR″, $S(O)_nR'''$ và (C=O)-R‴;

hai R^8 cùng với các nguyên tử mà chúng được gắn vào hoặc cùng với các nguyên tử khác được chọn từ nhóm gồm có C, N, O, $S(O)_m$ và tùy ý bao gồm 1 đến 3 phần tử vòng được chọn từ nhóm gồm có C(=O) hoặc C(=S), có thể tạo thành một vòng có từ ba đến sáu phần tử, trong đó thành phần nó có thể được thế bởi một hoặc nhiều nhóm được chọn từ nhóm gồm có X, CN, R′, OR′, SR′, và $N(R')_2$;

X tương ứng với halogen;

R′ được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_6-alkyl và C_3-C_6-xycloalkyl; trong đó nhóm alkyl và xycloalkyl có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều X;

R″ được chọn từ nhóm gồm có hydro, C_1-C_6-alkyl, C_1-C_6-haloalkyl, C_3-C_6-xycloalkyl, $N(R')_2$, OR′ và C_6-C_{10}-aryl;

R‴ được chọn từ các nhóm gồm có xyano và R″;

n tương ứng với số nguyên 0, 1 hoặc 2;

m tương ứng với một số nguyên 0, 1 hoặc 2;

hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp, hoặc đồng phân lập thể của chúng.

2. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó

R^1 là C_1-C_6-alkyl;

R^2 là C_2-C_6-alkyl;

R^3 và R^4 được chọn độc lập từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_1-C_6-haloalkyl, OR″ và $S(O)_nR'''$;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro và C_1-C_6-alkyl;

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-haloalkyl and C_3-C_4-xycloalkyl;

vòng E được chọn từ nhóm gồm có phenyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, indolyl, benzimidazolyl, benzofuranyl, benzothiophenyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolinyl, isoquinolinyl and indolizinyl, có thể được thế tùy ý bởi một hoặc nhiều nhóm R^8;

hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp, hoặc đồng phân lập thể của chúng.

3. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó

R^1 là C_1-C_6-alkyl;

R^2 là C_2-C_6-alkyl;

R^3 và R^4 được chọn độc lập từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, và OR″;

R^5 được chọn từ nhóm gồm có hydro, và C_1-C_6-alkyl;

R^6 và R^7 được chọn độc lập từ nhóm gồm có hydro, X, C_1-C_4-alkyl, và C_1-C_4-haloalkyl;

vòng E được chọn từ phenyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl hoặc benzothiazolyl được thế bằng một hoặc nhiều R^8;

hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp, đồng phân lập thể của chúng.

4. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó hợp chất có công thức (I) này được

chọn từ nhóm gồm có N'-(2-clo-5-metyl-3-(p-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2,5-dimetyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(3-(3-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N'-(2,5-dimetyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit, N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-metylformimidamit, N'-(2-clo-5-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(2-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((4-(tert-butyl)phenyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((4-((triflometyl)thio)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-clobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-

((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-clophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(2-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-xyanobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3,5-dimetylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3-clo-2-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-

isopropylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-clophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-isopropylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-flo-2-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-benzyl-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(3,5-diflo-4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((2,4-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3,5-diflophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-benzyl-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3,4-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3,5-diflophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyridin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-

clo-5-metyl-3-((3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-flo-3,5-dimetylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(2-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(2,6-diflobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(2-clo-6-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin 2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(3-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(2-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-clo-5-flophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-metylpyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((5-clo-2-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-

etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((5-clo-2-metylphenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((5-clo-3-metylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-clo-5-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-clobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-clo-3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((4-clo-2-flophenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit , N'-(2-clo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((4-

clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(2-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-6-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-benzyl-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-metoxybenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((2-flo-3-metylphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(m-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(phenylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-clo-2-flophenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(m-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-clo-5-(triflometyl)phenyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-((3-bromophenyl)amino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-

xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-clobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2-(diflometoxy)phenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((2-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-flophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-clophenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometyl)benzyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((4-flo-3-metylbenzyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-clobenzyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(o-tolylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-bromo-3-(3-flobenzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metyl-2-(metylthio)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(o-tolyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-

yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-xyanobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-clo-3-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-benzyl-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2,5-dimetyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-bromo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyrazin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyrimidin-2-ylamino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrazin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(pyrimidin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-clobenzyl)-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-

metylformimidamit; N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromo-4-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metylbenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromo-2-flobenzyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-(3-flo-5-metoxybenzyl)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-5-flo-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-yl(metyl)amino)-2-clo-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(benzo[d]thiazol-6-ylamino)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-clo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(4-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-(3-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-

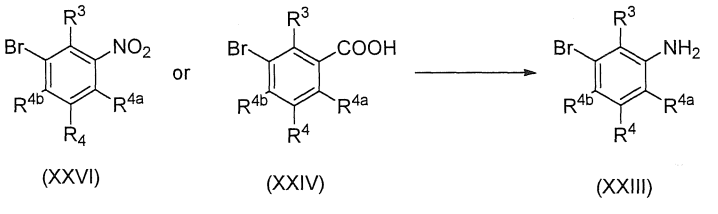
metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((6-etylpyridin-2-yl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(2-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-3-((2-metoxyphenyl)(metyl)amino)-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((3-flo-4-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(3-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)phenyl)-N-

metylformimidamit; N'-(3-(4-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3,4-diflobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-3-((4-flo-3-metoxyphenyl)(metyl)amino)-5-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-(metyl(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(3-(3-flo-5-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-xyano-3-(3-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-benzyl-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(5-clo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(2-clo-5-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-flo-2-metyl-3-((2-(triflometoxy)phenyl)amino)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)axetyl)-5-flo-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(3-

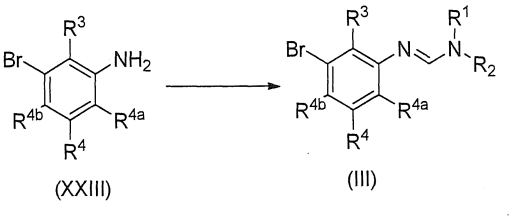
(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-xyanobenzyl)-5-metoxy-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N-etyl-N'-(5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)phenyl)-N-metylformimidamit , N'-(3-benzyl-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit , N'-(5-xyano-3-(3-xyanobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-xyano-3-(4-flobenzyl)-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(4-clobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(5-xyano-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit; N'-(3-(3-bromobenzyl)-5-xyano-2-metylphenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit và N'-(5-xyano-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)phenyl)-N-etyl-N-metylformimidamit.

5. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó quy trình này gồm các bước từ (a) đến (c) hoặc các bước từ (d) đến (e) hoặc từ (f) đến (h) sau:

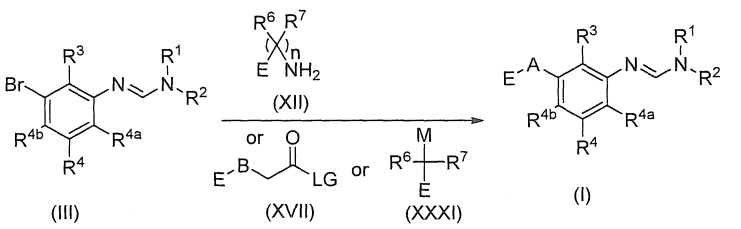
a) chuyển đổi hợp chất có công thức (XXVI) hoặc (XXIV) thành hợp chất có công thức (XXIII) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



b) cho một hợp chất có công thức (XXIII) phản ứng với một amin bậc hai thích hợp (HNR^1R^2) để thu được một hợp chất có công thức (III) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:

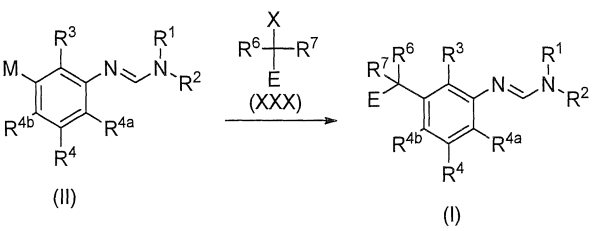


c) cho hợp chất có công thức (III) phản ứng với hợp chất có công thức (XII), (XVII) hoặc (XXXI) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:

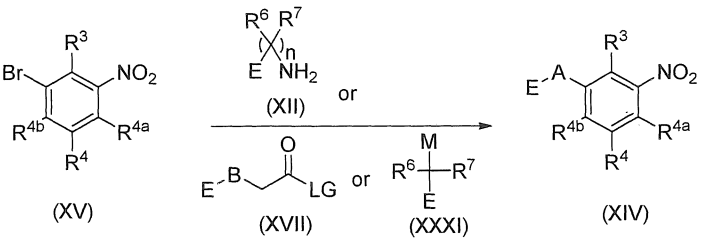


d) chuyển đổi hợp chất có công thức (III) thành hợp chất có công thức (II) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:

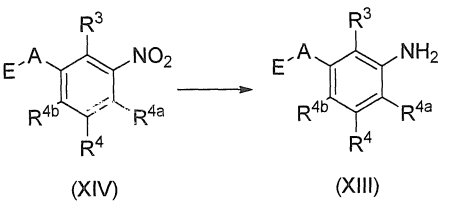
e) cho hợp chất có công thức (II) phản ứng với hợp chất có công thức (XXX) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:



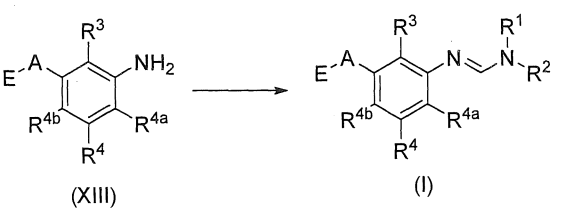
f) cho hợp chất có công thức (XV) phản ứng với hợp chất có công thức (XII), (XVII) hoặc (XXXI) để thu được hợp chất có công thức (XIV) theo sơ đồ phản ứng như mô tả dưới đây:



g) chuyển đổi hợp chất có công thức (XIV) thành hợp chất có công thức (XIII) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



h) cho hợp chất có công thức (XIII) phản ứng với một amin bậc hai thích hợp (HNR^1R^2) để thu được hợp chất có công thức (I) theo sơ đồ phản ứng như được mô tả dưới đây:



trong đó trong sơ đồ phản ứng trên, LG là nhóm xuất, M được chọn từ nhóm gồm có liti, este boronic, axit boronic, MgX và ZnX; B, R^1, R^2, R^3, R^4, R^{4a}, R^{4b}, E, R^6, R^7 và n được định nghĩa như trong điểm 1.

6. Chế phẩm để kiểm soát và/hoặc ngăn ngừa vi sinh vật gây bệnh thực vật, gồm có hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp của chúng, theo điểm 1 và một hoặc nhiều chất mang có tính trơ.

7. Chế phẩm theo điểm 6, trong đó chế phẩm này có thể gồm có thêm một hoặc nhiều hợp chất tương thích hoạt động được chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun

tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, kháng sinh, chất dinh dưỡng hoặc phân bón.

8. Chế phẩm theo điểm 6 hoặc điểm 7, trong đó nồng độ của hợp chất có công thức (I) nằm trong khoảng từ 10 đến 90% trọng lượng đối với tổng trọng lượng của chế phẩm.

9. Hỗn hợp gồm có hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp theo điểm 1 và một hoặc nhiều hợp chất tương thích hoạt động được lựa chọn từ thuốc diệt nấm, thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve, thuốc trừ sâu sinh học, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, thuốc kháng sinh, chất dinh dưỡng hoặc phân bón.

10. Hạt giống gồm có hợp chất có công thức (I), muối được sử dụng trong nông nghiệp, hoặc đồng phân lập thể của chúng theo điểm 1, trong đó lượng hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể, hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp của chúng là từ 0,1 g đến 1 kg trên 100 kg hạt giống.

11. Phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự xâm nhập của các vi sinh vật gây bệnh đối với cây trồng có ích trong cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng làm vườn, trong đó hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể, hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp theo điểm 1, chế phẩm theo điểm 6 hoặc hỗn hợp theo điểm 9, được ứng dụng cho thực vật, cho các bộ phận của chúng hoặc cho một vị trí xung quanh.

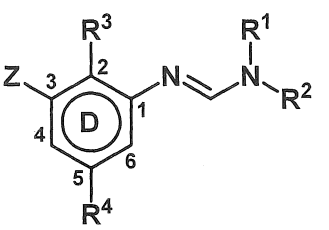
12. Phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự xâm nhập của các vi sinh vật gây bệnh đối với cây trồng có ích trong cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng làm vườn, trong đó hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể, hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp theo điểm 1, chế phẩm theo điểm 6 hoặc hỗn hợp theo điểm 9, được ứng dụng cho hạt giống cây trồng.

13. Phương pháp để kiểm soát hoặc ngăn chặn vi sinh vật gây bệnh thực vật trong cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng làm vườn bằng cách sử dụng hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể, hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp theo điểm 1, chế phẩm theo

điểm 6 hoặc hỗn hợp theo điểm 9, gồm có bước áp dụng liều lượng hiệu quả của hợp chất hoặc chế phẩm hoặc hỗn hợp, với số lượng từ 1 g đến 2 kg mỗi héc ta cây nông nghiệp và/hoặc cây trồng làm vườn.

14. Phương pháp để chống lại nấm gây bệnh ở thực vật, gồm có điều trị thực vật, đất, hạt giống hoặc nguyên liệu cần được bảo vệ bằng hợp chất có công thức (I), đồng phân lập thể, hoặc muối được sử dụng trong nông nghiệp theo điểm 1, chế phẩm theo điểm 6 hoặc hỗn hợp theo điểm 9.

15. Hợp chất có công thức (A),



công thức (A)

trong đó,

Z tương ứng với OH, NH_2, SH hoặc X;

R^1 là C_1-C_6-alkyl;

R^2 là C_2-C_6-alkyl;

R^3 được chọn từ nhóm gồm có X, C_1-C_6-alkyl, C_1-C_6-haloalkyl, OR″, $S(O)_nR'''$, và C_3-C_6-xycloalkyl;

R^4 được chọn từ nhóm gồm có X, xyano, C_1-C_6-alkyl, C_1-C_6-haloalkyl, OR″, $S(O)_nR'''$, và C_3-C_6-xycloalkyl trong đó X, R″, R‴ được định nghĩa như trong điểm 1.

16. Hợp chất được chọn từ 2-clo-5-metyl-N^1-(p-tolyl)benzen-1,3-diamin, 2,5-dimetyl-3-(4-metylbenzyl)anilin; 3-(3-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 2,5-dimetyl-3-(2-

metylbenzyl)anilin; 3-(3-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin; N^1-(2-flophenyl)-2,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(2-flophenyl)-N^1,2,5-trimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin; 2-clo-3-(2-clobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(2-flobenzyl)-5-metylanilin; 5-flo-2-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(4-((triflometyl)thio)phenyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin; 2-clo-5-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin; 5-flo-N^1-(2-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(4-(tert-butyl)phenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin; 2-clo-3-(3-flobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-N^1-(2-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin; N^1-(4-(tert-butyl)phenyl)-2-clo-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(4-((triflometyl)thio)phenyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-3-(3-clobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(3-metoxybenzyl)-5-metylanilin; 5-flo-N^1-(3-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3-clophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; N^1-(3-clophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-3-(4-flobenzyl)-5-metylanilin; 3-(2-bromobenzyl)-2-clo-5-metylanilin; 4-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril; 2-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril; 3-(3-amino-2-clo-5-metylbenzyl)benzonitril; 2-clo-N^1-(3-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin; 2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin; 2-clo-5-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)anilin; 2-clo-5-

metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin; 2-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(3,5-dimetylbenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(3-clo-2-flobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-N^1-(3-isopropylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-clophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-clophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-isopropylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-3-(4-flo-2-metylbenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-5-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin; 2-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-N^1-(4-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 3-benzyl-2-clo-5-metylanilin; 2-clo-3-(3,5-diflo-4-metoxybenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-N^1-(3,4-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3,4-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3,5-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2,4-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(2,4-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3,5-diflophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3,5-diflophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 3-benzyl-5-clo-2-metylanilin; N^1-(2,4-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3,4-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2,4-diflophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3,4-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3,5-diflophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(3-metylpyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-3-(4-flo-3,5-dimetylbenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin; 5-clo-3-(2-clobenzyl)-2-metylanilin; 3-(2-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin; 2-clo-3-(2,6-diflobenzyl)-5-metylanilin; 2-clo-3-(2-clo-6-flobenzyl)-5-metylanilin; 3-(4-bromobenzyl)-2-clo-5-metylanilin; 5-clo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin; 5-flo-2-metyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clo-5-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-

1,3-diamin; 2-clo-N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-3-(3-clobenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-3-(3-flobenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-3-(2-flobenzyl)-2-metylanilin; 2-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril; 5-clo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin; N^1-(3-clo-5-flophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(3-metylpyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(5-clo-3-metylpyridin-2-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(5-clo-2-metylphenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(5-clo-3-metylpyridin-2-yl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-flo-5-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-clo-5-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-3-(4-flobenzyl)-2-metylanilin; 3-(4-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin; 5-clo-3-(4-clobenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin; 5-clo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-3-(3,4-diflobenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-3-(3-clo-4-flobenzyl)-2-metylanilin; 5-clo-3-(4-clo-3-flobenzyl)-2-metylanilin; 5-flo-2-metyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(4-clo-2-flophenyl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-3-(2-flobenzyl)-2-metylanilin; 3-(2-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin; 3-

(3-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-N^1-(2-flo-6-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin; 5-flo-3-(3-flobenzyl)-2-metylanilin; 5-flo-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin; 3-benzyl-5-flo-2-metylanilin; 2-clo-3-(4-metoxybenzyl)-5-metylanilin; 3-(2-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-N^1-(2-flo-3-metylphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-clo-2-flophenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(3-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-phenylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(m-tolyl)benzen-1,3-diamin; N^1-(3-clo-5-(triflometyl)phenyl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-clophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3-bromophenyl)-5-clo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(2-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-flophenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril; 2-clo-N^1-(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin; 5-flo-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin; 3-(4-clobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin; 3-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril; 3-(4-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometoxy)benzyl)anilin; 2-clo-N^1-(2-(diflometoxy)phenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(2-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-flophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-clophenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(2-(triflometyl)benzyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-clobenzyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin; 2-bromo-3-(3-

flobenzyl)-5-metylanilin; 3-(3-flobenzyl)-5-metyl-2-(metylthio)anilin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(o-tolyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(1-(pyrazin-2-yl)propan-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-((5-metylpyrazin-2-yl)metyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin; 4-(3-amino-5-flo-2-metylbenzyl)benzonitril; 5-flo-3-(4-flo-3-metylbenzyl)-2-metylanilin; 5-flo-3-(4-flobenzyl)-2-metylanilin; 3-(3-bromobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 3-(4-clo-3-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 3-benzyl-2,5-dimetylanilin; 2,5-dimetyl-3-(3-metylbenzyl)anilin; 2-bromo-5-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrazin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(pyrimidin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 3-(2-bromo-4-flobenzyl)-2-clo-5-metylanilin; 3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-2-clo-5-metylanilin; 3-(4-bromo-2-flobenzyl)-2-clo-5-metylanilin; 2-clo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-5-metylanilin; 3-(2-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 3-(2-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 3-(2-bromobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 3-(4-flobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 3-(4-bromobenzyl)-2,5-dimetylanilin; 3-(4-clobenzyl)-2,5-dimetylanilin; N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-flo-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-2-clo-5-metylbenzen-1,3-diamin; 3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 3-(2-bromo-4-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-3-(5-flo-2-metylbenzyl)-2-metylanilin; 3-(4-bromo-3-metylbenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 3-(2-bromo-5-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-3-(4-flo-3-(triflometyl)benzyl)-2-metylanilin; 5-flo-3-(3-flo-5-metylbenzyl)-2-metylanilin; 3-(4-bromo-2-flobenzyl)-5-flo-2-metylanilin; 5-flo-3-(3-flo-5-metoxybenzyl)-2-

metylanilin; N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-5-flo-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-2-clo-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)anilin; N^1-(benzo[d]thiazol-6-yl)-5-clo-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin; 3-(3-bromobenzyl)-5-clo-2-metylanilin; 4-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril; 5-clo-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin; 5-clo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin; 5-clo-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin; 3-(3-amino-5-clo-2-metylbenzyl)benzonitril; 5-clo-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin; 5-clo-2-metyl-3-(4-(metylthio)benzyl)anilin; 5-clo-N^1-(6-etylpyridin-2-yl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)anilin; 5-flo-2-metyl-3-(pyridin-3-ylmetyl)anilin; 3-(4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(2-metylbenzyl)anilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(4-metylbenzyl)anilin; 3-(3-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 3-(2-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 3-(2-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 5-clo-N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-metoxy-N^1-(2-metoxyphenyl)-2-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metoxy-2-metylbenzen-1,3-diamin; 5-metoxy-N^1-(2-metoxyphenyl)-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; N^1-(3-flo-4-metoxyphenyl)-5-metoxy-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-metoxy-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metylbenzen-1,3-diamin; N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metoxy-2-metylbenzen-1,3-diamin; 3-(3-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(3-metylbenzyl)anilin; 3-(4-clobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(3-nitrobenzyl)anilin; 3-(5-flo-2-metylbenzyl)-5-

metoxy-2-metylanilin; 3-(3-clo-4-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 2-clo-5-metyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-5-metoxy-N^1,2-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-metoxy-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 3-(3,4-diflobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 3-(4-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 2-clo-N^1-(4-flo-3-metoxyphenyl)-N^1,5-dimetylbenzen-1,3-diamin; 5-clo-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-N^1,5-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-N^1,2-dimetyl-N^1-(6-(triflometyl)pyridin-2-yl)benzen-1,3-diamin; 3-(3-flo-5-metylbenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 3-(2-clo-5-flobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 3-(2-bromobenzyl)-5-metoxy-2-metylanilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(4-(triflometyl)benzyl)anilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometyl)benzyl)anilin; 3-amino-5-(3-flobenzyl)-4-metylbenzonitril; 3-benzyl-5-metoxy-2-metylanilin; 5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometoxy)benzyl)anilin; 5-metoxy-2-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin; 5-clo-2-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin; 2-clo-5-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin; 5-flo-2-metyl-N^1-(2-(triflometoxy)phenyl)benzen-1,3-diamin; 1-(3-amino-5-flo-2-metylphenyl)-2-(2-clo-4-metoxyphenoxy)ethan-1-one, 5-metoxy-2-metyl-3-(3-(triflometoxy)benzyl)anilin; 3-(3-amino-5-metoxy-2-metylbenzyl)benzonitril; 5-metoxy-2-metyl-3-(2-(triflometyl)benzyl)anilin; 3-amino-5-benzyl-4-metylbenzonitril; 3-amino-5-(3-xyanobenzyl)-4-metylbenzonitril; 3-amino-5-(4-flobenzyl)-4-metylbenzonitril; 3-amino-5-(4-clobenzyl)-4-metylbenzonitril; 3-amino-4-metyl-5-(3-nitrobenzyl)benzonitril; 3-amino-5-(3-bromobenzyl)-4-metylbenzonitril và 3-amino-4-metyl-5-(2-(triflometoxy)benzyl)benzonitril.