



(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) 
1-0020556

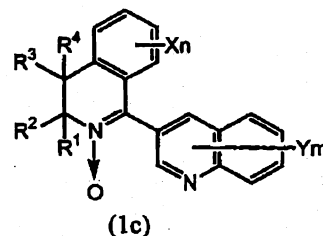
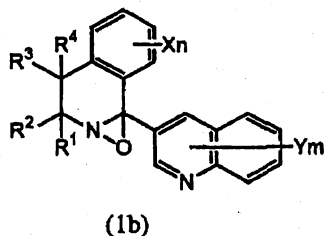
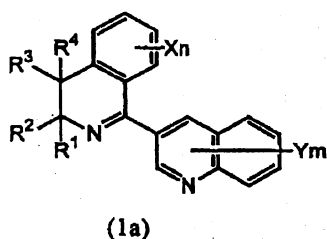
(51)⁷ A01N 25/00, 43/42, 43/90, A01P 3/00

(13) B

- (21) 1-2016-00794 (22) 30.11.2007
(62) 1-2009-01379
(86) PCT/JP2007/073143 30.11.2007 (87) WO2008/066148A1 05.06.2008
(30) 2006-325344 01.12.2006 JP
(45) 25.03.2019 372 (43) 25.05.2016 338
(73) MITSUI CHEMICALS AGRO, INC (JP)
1-19-1, Nihonbashi, Chuo-ku, Tokyo 103-0027, Japan
(72) ITO, Hiroyuki (JP), TAMAGAWA, Yasushi (JP), TANAKA, Harukazu (JP),
OHARA, Toshiaki (JP)
(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) TÁC NHÂN XỬ LÝ ĐẤT CHỨA CÁC HỢP CHẤT QUINOLIN HOẶC CÁC MUỐI CỦA CHÚNG LÀM HOẠT CHẤT VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG NGỪA CÁC BỆNH CHO THỰC VẬT BẰNG CÁCH SỬ DỤNG TÁC NHÂN NÀY

(57) Sáng chế đề xuất tác nhân xử lý đất có các hiệu quả phòng ngừa xuất sắc chống lại các bệnh thực vật khác nhau (đặc biệt là bệnh đạo ôn hại lúa). Tác nhân xử lý đất chứa một hoặc nhiều hợp chất có công thức chung (Ia), (Ib) hoặc (Ic):



trong đó R¹, R² là C₁-C₆ alkyl (có thể được thế), aryl (có thể được thế), heteroaryl (có thể được thế), aralkyl (có thể được thế) và tương tự; R³, R⁴ là H, C₁-C₆ alkyl (có thể được thế), halogen, C₁-C₆ alkoxy và tương tự; X là halogen, C₁-C₆ alkyl (có thể được thế), C₂-C₆ alkenyl (có thể được thế), C₂-C₆ alkynyl (có thể được thế), aryl (có thể được thế), heteroaryl (có thể được thế), C₁-C₆ alkoxy và tương tự; Y là halogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, OH; n là một số từ 0 đến 4; m là một số từ 0 đến 6 hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính. Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến phương pháp phòng ngừa bệnh cho thực vật bao gồm bước sử dụng tác nhân xử lý đất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến tác nhân xử lý đất (hợp phần để phòng ngừa bệnh cho cây trồng được đặc trưng bởi việc xử lý đất) chứa một hoặc nhiều hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính.

Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến phương pháp phòng ngừa bệnh cho thực vật bằng cách sử dụng tác nhân xử lý đất (hợp phần để phòng ngừa bệnh được đặc trưng bởi việc xử lý đất) chứa một hoặc nhiều hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin là các hợp chất được biết đến rộng rãi, và đã biết là hữu ích đối với thuốc diệt nấm dùng trong nông nghiệp và lâm nghiệp (tài liệu sáng chế 1). Tài liệu này đặc biệt giải thích rõ ràng về hiệu quả diệt nấm chống lại bệnh đạo ôn hại lúa (*Pyricularia oryzae*) và mốc xám hại cà chua (*Botrytis cinerea*).

Tuy nhiên, tài liệu này không mô tả hiệu quả diệt nấm chống lại bệnh đạo ôn hại lúa bằng cách xử lý đất trong hộp ươm để trồng các cây con trong thời kỳ từ lúc gieo hạt đến lúc cấy chuyển, và chưa được biết rằng các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin có hiệu quả diệt nấm chống lại bệnh đạo ôn hại lúa bằng cách xử lý đất.

Ngoài ra, tài liệu này không mô tả các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin có hiệu quả diệt nấm chống lại các bệnh về đất bằng cách xử lý

ngâm nước đất và chưa được biết rằng các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin có thể được sử dụng làm tác nhân phòng ngừa chống lại các bệnh về đất.

Hơn nữa, tài liệu này không mô tả việc sử dụng các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin làm tác nhân xử lý hạt giống và chưa được biết rằng các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin có thể được sử dụng làm tác nhân xử lý hạt giống. Tài liệu sáng chế 1: Công bố đơn quốc tế số WO 2005/70917.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

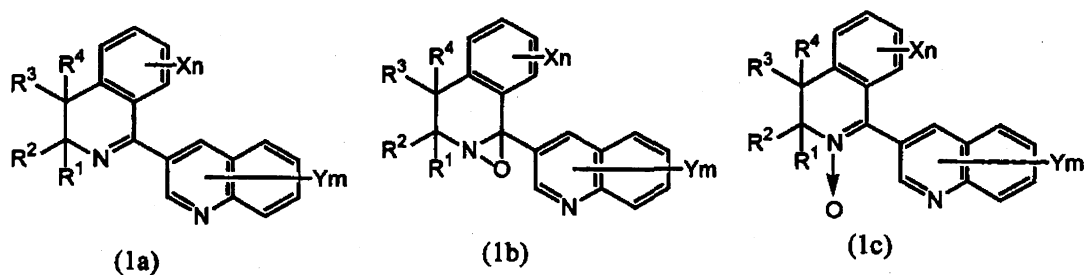
Theo kết quả của các nghiên cứu được tiến hành trên phạm vi rộng đối với các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin trong nhiều năm, các tác giả sáng chế gần đây đã phát hiện ra rằng các hợp chất này hữu ích làm tác nhân xử lý đất, do đó, hoàn thành sáng chế.

Sáng chế đề xuất tác nhân xử lý đất (hợp phần để phòng ngừa bệnh cho thực vật được đặc trưng bởi việc xử lý đất) chứa một hoặc nhiều hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính.

Ngoài ra, sáng chế còn đề xuất phương pháp phòng ngừa bệnh cho thực vật bằng cách sử dụng tác nhân xử lý đất (hợp phần để phòng ngừa bệnh cho thực vật được đặc trưng bởi việc xử lý đất) chứa một hoặc nhiều hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính.

Theo sáng chế, "hiệu quả phòng ngừa" nghĩa là hiệu quả phòng ngừa và/hoặc hiệu quả chữa bệnh.

Sáng chế đề xuất tác nhân xử lý đất chứa một hoặc nhiều hợp chất có công thức chung (Ia), (Ib) hoặc (Ic):



trong đó

R^1 và R^2 có thể giống hoặc khác nhau, và là:

nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm C_1-C_6 alkylthio và nhóm phenoxy;

nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl giống hoặc khác nhau hoặc các nhóm axyl, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto, và nhóm C_1-C_6 alkylthio;

nhóm heteroaryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C_1-C_6 alkoxy; hoặc

nhóm aralkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl giống hoặc khác nhau hoặc các nhóm axyl, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và nhóm C_1-C_6 alkylthio, hoặc

R^1 và R^2 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào, tạo thành vòng

C_3 - C_{10} xycloalkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkyl, nhóm C_1 - C_6 alkoxy và nhóm phenoxy,

R^3 và R^4 có thể giống hoặc khác nhau, và là:

nguyên tử hydro;

nhóm C_1 - C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkoxy, nhóm C_1 - C_6 alkylthio và nhóm phenoxy;

nguyên tử halogen;

nhóm C_1 - C_6 alkoxy; hoặc

nhóm hydroxyl, hoặc

R^3 và R^4 cùng nhau tạo thành nhóm C_1 - C_6 alkyliden hoặc nhóm oxo; hoặc

cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào, tạo thành vòng C_3 - C_{10} xycloalkyl có thể được thay thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkyl, nhóm C_1 - C_6 alkoxy và nhóm phenoxy;

X có thể giống hoặc khác nhau khi n là số nguyên từ 2 đến 4, và là:

nguyên tử halogen;

nhóm C_1 - C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkoxy, nhóm hydroxyl, nhóm C_2 - C_7 alkoxy-carbonyl và nhóm phenoxy;

nhóm C_2 - C_6 alkenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkoxy, nhóm C_2 - C_7 alkoxy-carbonyl và nhóm phenoxy;

nhóm C_2-C_6 alkynyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkoxy và nhóm phenoxy;

nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl giống hoặc khác nhau hoặc các nhóm axyl, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và nhóm C_1-C_6 alkylthio;

nhóm heteroaryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C_1-C_6 alkoxy;

nhóm C_1-C_6 alkoxy;

nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl giống hoặc khác nhau hoặc các nhóm axyl;

nhóm axyl;

nhóm xyano; hoặc

nhóm N-hydroxyalkanimidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng một phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C_1-C_6 alkyl, nhóm C_2-C_6 alkenyl, nhóm C_2-C_6 alkynyl, nhóm aralkyl, nhóm aryl và nhóm heteroaryl,

Y có thể giống hoặc khác nhau khi m là số nguyên từ 2 đến 6, và là:

nguyên tử halogen; nhóm C_1-C_6 alkyl; nhóm C_1-C_6 alkoxy; hoặc nhóm hydroxyl,

n là số nguyên từ 0 đến 4, và

m là số nguyên từ 0 đến 6)

hoặc các muối của chúng làm thành phần hoạt tính.

Ở đây, trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic), X là nguyên tử hydro khi n bằng 0, và Y là nguyên tử hydro khi m bằng 0.

Hiệu quả của sáng chế

Các hợp chất 3-(dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế có thể được sử dụng làm tác nhân xử lý đất, và thể hiện các hiệu quả nổi bật chống lại các bệnh của thực vật khác nhau, đặc biệt là chống lại bệnh đạo ôn hại lúa mà không gây hư hại cho các cây chủ và cho các hiệu quả phòng ngừa chống lại các bệnh của thực vật tốt hơn là tác nhân xử lý đất.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C_1 - C_6 alkyl" có thể là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm isopropyl, nhóm butyl, nhóm isobutyl, nhóm s-butyl, nhóm t-butyl, nhóm pentyl, nhóm isopentyl, nhóm 2-metyl-butyl, nhóm neopentyl, nhóm 1-etylpropyl, nhóm hexyl, nhóm 4-metylpentyl, nhóm 3-metylpentyl, nhóm 2-metylpentyl, nhóm 1-metylpentyl, nhóm 3,3-dimetylbutyl, nhóm 2,2-dimetylbutyl, nhóm 1,1-dimetylbutyl, nhóm 1,2-dimetylbutyl, nhóm 1,3-dimetylbutyl, nhóm 2,3-dimetylbutyl hoặc nhóm 2-etylbutyl, tốt hơn là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 5 nguyên tử cacbon (nhóm C_1 - C_5 alkyl), tốt hơn nữa là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (nhóm C_1 - C_4 alkyl), tốt hơn nữa là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon (nhóm C_1 - C_3 alkyl), tốt hơn nữa là nhóm metyl, nhóm etyl hoặc nhóm propyl và tốt nhất là nhóm metyl hoặc nhóm etyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₂-C₆ alkenyl" có thể là mạch thẳng hoặc mạch nhánh và có thể chứa một hoặc một số tùy ý liên kết đôi, bao gồm, ví dụ, nhóm vinyl, nhóm prop-1-en-1-yl, nhóm alyl, nhóm isopropenyl, nhóm but-1-en-1-yl, nhóm but-2-en-1-yl, nhóm but-3-en-1-yl, nhóm 2-methylprop-2-en-1-yl, nhóm 1-methylprop-2-en-1-yl, nhóm pent-1-en-1-yl, nhóm pent-2-en-1-yl, nhóm pent-3-en-1-yl, nhóm pent-4-en-1-yl, nhóm 3-methylbut-2-en-1-yl, nhóm 3-methylbut-3-en-1-yl, nhóm hex-1-en-1-yl, nhóm hex-2-en-1-yl, nhóm hex-3-en-1-yl, nhóm hex-4-en-1-yl, nhóm hex-5-en-1-yl hoặc nhóm 4-methylpent-3-en-1-yl, tốt hơn là nhóm vinyl, nhóm alyl, nhóm isopropenyl hoặc nhóm but-1-en-1-yl và tốt hơn nữa là nhóm alyl hoặc nhóm isopropenyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₂-C₆ alkynyl" có thể là mạch thẳng hoặc mạch nhánh và có thể chứa một hoặc một số tùy ý liên kết ba, bao gồm, ví dụ, nhóm etynyl, nhóm prop-1-yn-1-yl, nhóm prop-2-yn-1-yl, nhóm but-1-yn-1-yl, nhóm but-3-yn-1-yl, nhóm 1-methylprop-2-yn-1-yl, nhóm pent-1-yn-1-yl, nhóm pent-4-yn-1-yl, nhóm hex-1-yn-1-yl hoặc nhóm hex-5-yn-1-yl và tốt hơn là nhóm etynyl hoặc nhóm prop-1-yn-1-yl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm aryl" có thể là, ví dụ, nhóm C₆-C₁₆ hydrocacbon thơm (có từ 6 đến 16 nguyên tử cacbon), bao gồm, ví dụ, nhóm phenyl, nhóm 1-naphtyl, nhóm 2-naphtyl, nhóm antraxenyl, nhóm phenantrenyl hoặc nhóm axenaphtylenyl, tốt hơn là nhóm phenyl, nhóm 1-naphtyl hoặc nhóm 2-naphtyl và tốt hơn nữa là nhóm phenyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm heteroaryl" có thể có một vòng hoặc nhiều vòng, và có thể chứa một hoặc hai hoặc nhiều hơn vòng chứa nguyên tử khác loại giống hoặc khác nhau, trong đó không có các giới hạn đặc biệt đối với loại nguyên tử khác loại, và có thể là, ví dụ, nguyên tử nitơ, nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh. Nhóm heteroaryl có thể là, ví dụ, nhóm hetero-aryl có từ 5 đến 7 phần tử đơn vòng, bao gồm nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm pyrolyl, nhóm oxazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm

dihydroisoxazolyl, nhóm thiazolyl, nhóm isothiazolyl, nhóm imidazolyl, nhóm pyrazolyl, nhóm oxadiazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm triazolyl, nhóm tetrazolyl, nhóm pyridyl, nhóm azepinyl và nhóm oxazepinyl, và nhóm heteroaryl đa vòng chứa nhóm heteroaryl có thể có từ 8 đến 14 phần tử đa vòng, bao gồm nhóm benzofuranyl, nhóm isobenzofuranyl, nhóm benzothienyl, nhóm indolyl, nhóm isoindolyl, nhóm indazolyl, nhóm benzoxazolyl, nhóm benzisoxazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzisothiazolyl, nhóm benzoxadiazolyl, nhóm benzothiadiazolyl, nhóm benzotriazolyl, nhóm quinolyl, nhóm iso-quinolyl, nhóm xinoliny, nhóm quinazolinyl, nhóm quinoxalinyl, nhóm phtalazinyl, nhóm naphthyridinyl, nhóm purinyl, nhóm pteridinyl, nhóm cacbazolyl, nhóm cacbolinyl, nhóm acridinyl, nhóm 2-acridinyl, nhóm 3-acridinyl, nhóm 4-acridinyl, nhóm 9-acridinyl, nhóm phenoxazinyl, nhóm phenotiazinyl hoặc nhóm phenazinyl, tốt hơn là nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm oxazolyl, nhóm pyridyl, nhóm benzofuranyl hoặc nhóm isobenzofuranyl, tốt hơn nữa là nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm oxazolyl hoặc nhóm pyridyl, và tốt hơn nữa là nhóm furyl hoặc nhóm thienyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm aralkyl" có thể là nhóm trong đó một, hoặc hai hoặc nhiều hơn nguyên tử hydro (tốt hơn là từ 1 đến 3 nguyên tử hydro, tốt hơn nữa là từ 1 đến 2 nguyên tử hydro) của "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng "nhóm aryl" nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm benzyl, nhóm 1-naphtylmetyl, nhóm 2-naphtylmetyl, nhóm antraxenylmetyl, nhóm phenantrenylmetyl, nhóm axenaphtylenylmetyl, nhóm diphenylmetyl, nhóm 1-phenetyl, nhóm 2-phenetyl, nhóm 1-(1-naphtyl)etyl, nhóm 1-(2-naphtyl)etyl, nhóm 2-(1-naphtyl)etyl, nhóm 2-(2-naphtyl)etyl, nhóm 3-phenylpropyl, nhóm 3-(1-naphtyl)propyl, nhóm 3-(2-naphtyl)propyl, nhóm 4-phenylbutyl, nhóm 4-(1-naphtyl)butyl, nhóm 4-(2-naphtyl)butyl, nhóm 5-phenylpentyl, nhóm 5-(1-naphtyl)pentyl, nhóm 5-(2-naphtyl)pentyl, nhóm 6-phenylhexyl, nhóm 6-(1-naphtyl)hexyl hoặc nhóm 6-(2-naphtyl)hexyl, tốt hơn là nhóm benzyl, nhóm diphenylmetyl, nhóm 1-phenetyl hoặc nhóm 2-phenetyl và tốt hơn là nhóm benzyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "vòng C₃-C₁₀ xycloalkyl" là nhóm hydrocacbon vòng được tạo thành bằng cách liên kết một nhóm alkylen có từ 2 đến 9 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm etylen, nhóm trimetylen, nhóm tetrametylen, nhóm pentametylen, nhóm hexametylen, nhóm heptametylen, nhóm octametylen và tương tự vào một nguyên tử cacbon, tốt hơn là nhóm hydrocacbon vòng được tạo thành bằng cách liên kết nhóm trimetylen, nhóm tetrametylen hoặc nhóm pentametylen (vòng xyclobutyl, vòng xyclopentyl hoặc vòng xyclohexyl) và tốt hơn là nhóm hydrocacbon vòng được tạo thành bằng cách liên kết nhóm pentametylen (vòng xyclohexyl).

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nguyên tử halogen" là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom hoặc nguyên tử iot, tốt hơn là nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom, tốt hơn nữa là nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo và tốt nhất là nguyên tử flo.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkoxy" là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm propoxy, nhóm isopropoxy, nhóm butoxy, nhóm isobutoxy, nhóm s-butoxy, nhóm t-butoxy, nhóm pentyloxy, nhóm isopentyloxy, nhóm 2-metylbutoxy, nhóm neopentyloxy, nhóm 1-etylpropoxy, nhóm hexyloxy, nhóm (4-metylpentyl)oxy, nhóm (3-metylpentyl)oxy, nhóm (2-metylpentyl)oxy, nhóm (1-metylpentyl)oxy, nhóm 3,3-dimetylbutoxy, nhóm 2,2-dimetylbutoxy, nhóm 1,1-dimetylbutoxy, nhóm 1,2-dimetylbutoxy, nhóm 1,3-dimetylbutoxy, nhóm 2,3-dimetylbutoxy hoặc nhóm 2-etylbutoxy, tốt hơn là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (nhóm C₁-C₄ alkoxy), tốt hơn nữa là nhóm metoxy, nhóm etoxy hoặc nhóm isopropoxy, tốt hơn nữa là nhóm metoxy hoặc nhóm etoxy và tốt nhất là nhóm metoxy.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkylthio" là nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm metylthio, nhóm etylthio, nhóm propylthio,

nhóm isopropylthio, nhóm butylthio, nhóm isopentylthio, nhóm neopentylthio, nhóm 3,3-dimethylbutylthio hoặc nhóm 2-ethylbutylthio, tốt hơn là nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon và tốt hơn nữa là nhóm methylthio.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm axyl" có thể là nhóm formyl, nhóm carbonyl mà "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được liên kết (nhóm C₂-C₇ alkylcarbonyl), nhóm carbonyl mà "nhóm C₂-C₆ alkenyl" nêu trên được liên kết (C₃-C₇ nhóm alkenylcarbonyl), nhóm carbonyl mà "nhóm aryl" nêu trên được liên kết ("nhóm arylcarbonyl"), nhóm carbonyl mà "nhóm C₁-C₆ alkoxy" nêu trên được liên kết (nhóm C₂-C₇ alkoxycarbonyl) hoặc nhóm carbonyl mà "nhóm C₁-C₆ alkylthio" nêu trên được liên kết (nhóm C₂-C₇ alkylthiocarbonyl), tốt hơn là nhóm formyl, nhóm C₂-C₅ alkylcarbonyl, nhóm C₃-C₅ alkenylcarbonyl, nhóm benzoyl, nhóm naphthoyl, nhóm C₂-C₅ alkoxycarbonyl hoặc nhóm C₂-C₅ alkylthiocarbonyl, tốt hơn nữa là nhóm formyl, nhóm C₂-C₅ alkylcarbonyl, nhóm benzoyl hoặc nhóm C₂-C₅ alkoxycarbonyl, tốt hơn nữa là nhóm axetyl, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl hoặc nhóm benzoyl và tốt nhất là nhóm axetyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₂-C₇ alkoxy-carbonyl" là nhóm alkoxycarbonyl có từ 2 đến 7 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl hoặc nhóm propoxycarbonyl, trong đó phần alkoxy của nó có thể là mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn là nhóm alkoxycarbonyl có từ 2 đến 4 nguyên tử cacbon và tốt hơn nữa là nhóm metoxycarbonyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" là, ngoài "các nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên, "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 "nguyên tử halogen" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm diflometyl, nhóm diclometyl, nhóm dibrommetyl, nhóm flometyl, nhóm clometyl, nhóm brommetyl, nhóm iotmetyl,

nhóm 2,2,2-tricloetyl, nhóm 2,2,2-tri-floetyl, nhóm 2-brommetyl, nhóm 2-cloetyl, nhóm 2-floetyl, nhóm 3-clopropyl, nhóm 3,3,3-triflopropyl, nhóm 4-flobutyl, nhóm 3-flo-2-metylpropyl, nhóm 3,3,3-triflo-2-metylpropyl hoặc nhóm 6,6,6-triclohexyl, tốt hơn là "nhóm C₁-C₄ alkyl" nêu trên có thể được thế bằng từ 1 đến 3 "nguyên tử halogen" nêu trên giống hoặc khác nhau, tốt hơn nữa là "nhóm C₁-C₃ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 "nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo" nêu trên giống hoặc khác nhau, tốt hơn nữa là nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm clometyl hoặc nhóm triflometyl và tốt hơn nữa là nhóm metyl, nhóm etyl hoặc nhóm triflometyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm N-hydroxyalkan-imidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C₁-C₆ alkyl, nhóm C₂-C₆ alkenyl, nhóm C₂-C₆ alkynyl, nhóm aralkyl, nhóm aryl và nhóm heteroaryl" có thể, thêm vào nhóm hydroxyalkanimidoyl có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm hydroxyiminometyl, nhóm N-hydroxyetanimidoyl, nhóm N-hydroxy-propanimidoyl hoặc nhóm N-hydroxybutanimidoyl, nhóm trong đó nhóm hydroxyl được thế bằng "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên, "nhóm C₂-C₆ alkenyl" nêu trên, "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên, "nhóm aralkyl" nêu trên, "nhóm aryl" nêu trên hoặc "nhóm heteroaryl" nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxyiminometyl, nhóm N-metoxyetanimidoyl, nhóm N-etoxyetanimidoyl, nhóm N-butoxyetanimidoyl, nhóm N-alyloxyetanimidoyl, nhóm N-propargyloxyetanimidoyl, nhóm N-benzyloxy-etanimidoyl, nhóm N-phenoxyetanimidoyl, nhóm N-pyridyloxyetanimidoyl, nhóm N-metoxypropanimidoyl, nhóm N-metoxybutanimidoyl hoặc nhóm N-metoxyhexanimidoyl, tốt hơn là nhóm N-hydroxyalkanimidoyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng một phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C₁-C₆ alkyl và nhóm phenyl, tốt hơn nữa là nhóm hydroxyimino metyl, nhóm N-hydroxyetanimidoyl, nhóm metoxyiminometyl, nhóm N-metoxyetanimidoyl hoặc nhóm N-etoxyetanimidoyl và tốt hơn nữa là nhóm metoxyiminometyl hoặc nhóm N-

metoxyetanimidoyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkoxy, nhóm C₁-C₆ alkylthio và nhóm phenoxy" của R¹ và tương tự có thể là, thêm vào "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ một đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên, "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 "nhóm C₁-C₆ alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm etoxyetyl hoặc nhóm propoxymetyl, "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 "nhóm C₁-C₆ alkylthio" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm methylthiometyl, nhóm ethylthiometyl hoặc nhóm ethylthioetyl, hoặc "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng nhóm phenoxy, bao gồm, ví dụ, nhóm phenoxymetyl hoặc nhóm phenoxyetyl, và hơn nữa bao gồm "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 2 đến 3 loại phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, nhóm C₁-C₆ alkoxy nêu trên, nhóm C₁-C₆ alkylthio và nhóm phenoxy nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm 2-metoxi-1-cloetyl, nhóm 3-phenoxy-2-brom-2-metoxipropyl, nhóm 3-phenoxy-2-brom-2-methylthio-propyl, tốt hơn là nhóm methyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm phenoxymetyl hoặc nhóm methylthiometyl và tốt hơn nữa là nhóm methyl hoặc nhóm etyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkoxy, nhóm hydroxyl, nhóm C₂-C₇ alkoxy-carbonyl và nhóm phenoxy" trong X và tương tự có thể là, ngoài "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên, "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 "nhóm C₁-C₆ alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm etoxyetyl hoặc nhóm propoxymetyl, "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 nhóm hydroxyl như nhóm hydroxymetyl, nhóm 2-

hydroxyetyl hoặc nhóm 3-hydroxypropyl, "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C_2-C_7 alkoxy carbonyl" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxycarbonylmetyl, nhóm etoxycarbonylmetyl, nhóm 2-(metoxy-carbonyl)etyl, hoặc "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên được thể bằng nhóm phenoxy, bao gồm, ví dụ, nhóm phenoxymetyl nhóm hoặc phenoxyetyl, và hơn nữa bao gồm "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên được thể bằng từ 2 đến 3 loại phần tử thể được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, nhóm C_1-C_6 alkoxy nêu trên, nhóm hydroxyl, nhóm C_2-C_7 alkoxy carbonyl và nhóm phenoxy nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm 2-metoxy-1-cloetyl, nhóm 2-hydroxy-1-cloetyl, nhóm 3-phenoxy-2-brom-2-metoxycarbonylpropyl, tốt hơn là nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm phenoxymetyl, nhóm methylthio-metyl, nhóm metoxycarbonylmetyl hoặc nhóm etoxycarbonylmetyl và tốt hơn nữa là nhóm metyl hoặc nhóm etyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C_2-C_6 alkenyl" có thể được thể bằng từ 1 đến 3 phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm C_2-C_7 alkoxy carbonyl và nhóm phenoxy" trong X và tương tự có thể là, ngoài nhóm "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên, "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ nhóm 3-cloalyl hoặc nhóm 4-brom-2-butenyl, "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm 3-metoxy-2-propenyl hoặc nhóm 4-etoxi-3-butenyl, "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C_2-C_7 alkoxy carbonyl" nêu trên giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm metoxycarbonylvinyl, nhóm 3-(etoxycarbonyl)-2-propenyl hoặc nhóm 4-(metoxycarbonyl)-2-butenyl, hoặc "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên được thể bằng một nhóm phenoxy, bao gồm, ví dụ, nhóm 3-phenoxy-2-butenyl, và hơn nữa bao gồm "nhóm C_2-C_6 alkenyl" nêu trên được thể bằng từ 2 đến 3 loại phần tử thể được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, nhóm C_1-C_6 alkoxy nêu trên, nhóm C_2-C_7 alkoxy carbonyl và nhóm phenoxy nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm 4-metoxy-3-

clo-2-butenyl, nhóm 4-metoxycarbonyl-3-clo-2-butenyl hoặc nhóm 4-phenoxy-3-clo-2-butenyl, tốt hơn là nhóm vinyl, nhóm alyl, nhóm isopropenyl, nhóm but-1-en-1-yl, nhóm 3-cloalyl, nhóm 4-brom-2-butenyl, nhóm metoxycarbonylvinyl hoặc nhóm 4-metoxycarbonyl-butenyl và tốt hơn nữa là nhóm alyl hoặc nhóm isopropenyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₂-C₆ alkynyl" có thể được thể bằng từ 1 đến 3 phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkoxy và nhóm phenoxy" trong X và tương tự có thể là, ngoài "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên, "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, bao gồm, ví dụ, nhóm 3-clo-2-propynyl hoặc nhóm 4-brom-2-butylnyl, "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C₁-C₆ alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau bao gồm, ví dụ, nhóm 3-metox-2-propynyl hoặc nhóm 4-etox-3-butylnyl, hoặc "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên được thể bằng nhóm phenoxy, bao gồm, ví dụ, nhóm 3-phenoxy-2-butylnyl, và ngoài ra, bao gồm "nhóm C₂-C₆ alkynyl" nêu trên được thể bằng từ 2 đến 3 loại phần tử thể được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, nhóm C₁-C₆ alkoxy và nhóm phenoxy nêu trên, bao gồm, ví dụ, nhóm 4-metox-4-clo-2-butylnyl hoặc nhóm 4-phenoxy-4-clo-2-butylnyl, tốt hơn là nhóm etynyl, nhóm prop-1-yn-1-yl, nhóm 3-clo-2-propynyl, nhóm 3-metox-2-propynyl, nhóm 4-metox-4-clo-2-butylnyl hoặc nhóm 4-phenoxy-4-clo-2-butylnyl và tốt hơn nữa là nhóm etynyl hoặc nhóm prop-1-yn-1-yl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm amino có thể được thể bằng từ 1 đến 2 nhóm C₁-C₆ alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau" trong X và tương tự là, ngoài nhóm amino, nhóm amino được thể bằng từ 1 đến 2 "nhóm C₁-C₆ alkyl" nêu trên giống hoặc khác nhau hoặc bởi từ 1 đến 2 "nhóm axyl" nêu trên giống hoặc khác nhau, tốt hơn là nhóm amino được thể bằng từ 1 đến 2 "nhóm C₁-C₄ alkyl" nêu trên hoặc bởi 1 hoặc 2 "nhóm axyl" nêu trên giống hoặc khác nhau và tốt hơn là nhóm dimetylamino, nhóm dietylamino

hoặc nhóm axetyl amino.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm C₁-C₆ alkyliden" mà R³ và R⁴ cùng với nhau tạo thành và tương tự, ví dụ, nhóm alkyliden mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, bao gồm, ví dụ, nhóm metyliden (nhóm metylen), nhóm etyliden, nhóm propyliden hoặc nhóm isopropyliden, tốt hơn là nhóm alkyliden mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon và tốt hơn nữa là nhóm metyliden (nhóm metylen).

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, nhóm C₁-C₆ alkoxy, nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và nhóm C₁-C₆ alkylthio" trong R¹ và tương tự có thể là, ngoài "nhóm aryl" nêu trên, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C₁-C₆ alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C₁-C₂ alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm nitro, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm xyano hoặc "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm hydroxyl, "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm mercapto hoặc "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C₁-C₆ alkylthio" nêu trên giống hoặc khác nhau, và ngoài ra bao gồm "nhóm aryl" nêu trên được thế bằng từ 2 đến 6 loại phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, "nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen

giống hoặc khác nhau" nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên, "nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau" nêu trên, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và "nhóm C_1-C_6 alkylthio" nêu trên, tốt hơn là nhóm phenyl, nhóm 1-naphtyl, nhóm 2-naphtyl, nhóm 4-flophenyl, nhóm 4-clophenyl, nhóm 3-metoxi-phenyl, nhóm 3-xyanophenyl, nhóm 2-metylthiophenyl hoặc nhóm 2-triflometyl-phenyl và tốt hơn nữa là nhóm phenyl, nhóm 4-flophenyl hoặc nhóm 4-clophenyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm heteroaryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C_1-C_6 alkoxy" trong R^1 và tương tự có thể là, ngoài "nhóm heteroaryl" nêu trên, "nhóm heteroaryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, "nhóm heteroaryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên giống hoặc khác nhau hoặc "nhóm heteroaryl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, và ngoài ra bao gồm "nhóm heteroaryl" nêu trên được thế bằng từ 2 đến 6 loại phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên và "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên, tốt hơn là nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm oxazolyl, nhóm pyridyl, nhóm benzofuranyl, nhóm isobenzofuranyl, nhóm 5-bromfuryl, nhóm 6-clopyridyl, nhóm 4-triflometylpyridyl, nhóm 3-flothienyl hoặc nhóm 3-metoxithienyl và tốt hơn là nhóm furyl hoặc nhóm thienyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "nhóm aralkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, nhóm C_1-C_6 alkoxy, nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và nhóm C_1-C_6

alkylthio" trong R^1 và tương tự có thể là, ngoài "nhóm aralkyl" nêu trên, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau" nêu trên giống hoặc khác nhau, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm nitro, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm xyano, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm hydroxyl, "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 nhóm mercapto hoặc "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 6 "nhóm C_1-C_6 alkylthio" nêu trên giống hoặc khác nhau, và ngoài ra bao gồm "nhóm aralkyl" nêu trên được thế bằng hai hoặc nhiều hơn phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau" nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên, "nhóm amino có thể được thế bằng từ 1 đến 2 nhóm C_1-C_6 alkyl hoặc nhóm axyl giống hoặc khác nhau" nêu trên, nhóm nitro, nhóm xyano, nhóm hydroxyl, nhóm mercapto và "nhóm C_1-C_6 alkylthio" nêu trên, trong đó trong trường hợp nhóm aralkyl có phần tử thế, phần tử thế có thể thế ở một hoặc cả hai vòng aryl và nhóm alkyl, tốt hơn là nhóm benzyl, nhóm diphenylmetyl, nhóm 1-phenetyl, nhóm 2-phenetyl, nhóm 4-clo-benzyl, nhóm 3-xyanobenzyl hoặc nhóm 4-metylthio-2-phenetyl và tốt hơn là nhóm benzyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl đã tạo thành cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào, có thể được thế bằng từ một đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl, nhóm C_1-C_6 alkoxy và nhóm phenoxy" trong R^1 và R^2 , và tương tự có thể là, ngoài "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu trên, ví dụ, "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu trên được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu

trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên giống hoặc khác nhau, "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 "nhóm C_1-C_6 alkoxy" nêu trên giống hoặc khác nhau, hoặc "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu trên được thể bằng từ 1 đến 3 nhóm phenoxy giống hoặc khác nhau, và ngoài ra bao gồm "vòng C_3-C_{10} xycloalkyl" nêu trên được thể bằng từ 2 đến 3 loại phần tử thể được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkyl" nêu trên, "nhóm C_1-C_6 alkoxy" và nhóm phenoxy nêu trên, tốt hơn là vòng xyclobutyl, vòng xyclopentyl, vòng xyclohexyl, vòng 2-cloxyxyclopentyl, vòng 4-metyl-xyclohexyl, vòng 3-metoxycyclohexyl hoặc vòng 3-phenoxyxyclohexyl và tốt hơn là vòng xyclohexyl.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, X có thể được thể tại các vị trí có thể được thể tùy ý từ 1 đến 4 trên vòng isoquinolin, và trong trường hợp có từ 2 đến 4 X có mặt (trong trường hợp n bằng 2 hoặc nhiều hơn), chúng có thể giống hoặc khác nhau.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế, Y có thể được thể tại các vị trí có thể được thể tùy ý từ 1 đến 6 trên vòng quinolin, và trong trường hợp có từ 2 đến 6 Y có mặt (trong trường hợp m bằng 2 hoặc nhiều hơn), chúng có thể giống hoặc khác nhau.

Các hợp chất (Ia), (Ib) hoặc (Ic) theo sáng chế có thể được chuyển hóa thành các muối, bao gồm, ví dụ, các muối khoáng như hydroclorit, sulfat và nitrat; các phosphat; các sulfonat như metansulfonat, etansulfonat, benzensulfonat và p-toluensulfonat; hoặc các cacboxylat hữu cơ như axetat, benzoat, oxalat, fumat và salixylat (tốt hơn là các hydroclorit, các sulfat, các nitrat, các metansulfonat, các oxalat, các fumarat hoặc các salixylat). Các muối này nằm trong phạm vi sáng chế này miễn là chúng có thể được sử dụng làm tác nhân xử lý đất.

Hợp chất (Ia), (Ib) hoặc (Ic) theo sáng chế hoặc các muối của chúng có thể được chuyển hóa thành các solvat, và các solvat này cũng nằm trong phạm vi

sáng chế này. Các solvat tốt hơn là các hydrat.

Hợp chất (Ia), (Ib) hoặc (Ic) theo sáng chế có thể có các hợp chất có các nguyên tử cacbon không đối xứng, và trong các trường hợp đó sáng chế cũng bao gồm một trong số các dạng hoạt quang hoặc hỗn hợp bao gồm một vài dạng hoạt quang với tỷ lệ tùy ý.

Trong các hợp chất (Ia), (Ib) hoặc (Ic) theo sáng chế,

R^1 và R^2 là:

(Ia) tốt hơn là nhóm C_1 - C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkoxy và nhóm phenoxy hoặc nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1 - C_6 alkyl, nhóm C_1 - C_6 alkoxy và nhóm hydroxyl,

(Ib) tốt hơn nữa là nhóm C_1 - C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau, hoặc nhóm phenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 5 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau,

(Ic) tốt hơn nữa là nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm triflometyl, nhóm trifloetyl, nhóm phenyl, nhóm flophenyl hoặc nhóm clophenyl,

R^3 và R^4 là:

(2a) tốt hơn là nguyên tử hydro, nhóm C_1 - C_4 alkyl, nguyên tử halogen, nhóm metoxy, nhóm etoxy hoặc nhóm hydroxyl,

(2b) tốt hơn nữa là nguyên tử hydro, nhóm metyl, nhóm etyl, nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

(2c) tốt hơn nữa là nguyên tử hydro, nhóm metyl hoặc nguyên tử flo,

Xn là:

(3a) tốt hơn là X là nguyên tử halogen; nhóm C₁-C₆ alkyl; nhóm C₂-C₆ alkynyl; nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C₁-C₆ alkoxy; nhóm heteroaryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C₁-C₆ alkoxy; nhóm xyano; hoặc nhóm N-hydroxy-C₁-C₆ alkanimidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng một phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C₁-C₆ alkyl và nhóm phenyl, và n là một số nguyên từ 0 đến 2,

(3b) tốt hơn nữa là X là nguyên tử halogen; nhóm C₁-C₄ alkyl; nhóm C₂-C₃ alkynyl; nhóm phenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 2 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nhóm C₁-C₂ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử flo và nhóm C₁-C₂ alkoxy; nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm oxazolyl hoặc nhóm pyridyl, mỗi nhóm này có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nhóm C₁-C₂ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử flo và nhóm C₁-C₂ alkoxy; nhóm xyano; hoặc nhóm N-hydroxy-C₁-C₂ alkanimidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C₁-C₂ alkyl và nhóm phenyl, và n là một số nguyên từ 0 đến 2,

(3c) tốt hơn nữa là X là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nhóm metyl, nhóm etynyl, nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm xyano, nhóm metoxyetanimidoyl, nhóm etoxyetanimidoyl hoặc nhóm phenoxyetanimidoyl, và n là số nguyên 0 hoặc 1,

Ym là:

(4a) tốt hơn là Y là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nhóm C_1-C_3 alkyl, nhóm metoxy, nhóm etoxy hoặc nhóm hydroxyl và m là một số nguyên từ 0 đến 2,

(4b) tốt hơn nữa là Y là nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm metyl, và m là số nguyên 0 hoặc 1,

(4c) tốt hơn nữa là Y là nhóm metyl, và m là số nguyên 0 hoặc 1.

Ngoài ra, các hợp chất thu được bằng cách, ví dụ, kết hợp R^1 và R^2 được chọn từ (Ib)-(Ic), R^3 và R^4 được chọn từ (2a)-(2c), Xn được chọn từ (3a)-(3c) và Ym được chọn từ (4a)-(4c) cũng được ưu tiên,

(Al) hợp chất trong đó R^1 và R^2 là nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkoxy và nhóm phenoxy; hoặc nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl, nhóm C_1-C_6 alkoxy và nhóm hydroxyl,

R^3 và R^4 là nguyên tử hydro, nhóm C_1-C_4 alkyl, nguyên tử halogen, nhóm metoxy, nhóm etoxy hoặc nhóm hydroxyl,

X là nguyên tử halogen; nhóm C_1-C_6 alkyl; nhóm C_2-C_6 alkynyl; nhóm aryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống nhau và khác nhau và nhóm C_1-C_6 alkoxy; nhóm heteroaryl có thể được thế bằng từ 1 đến 6 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử halogen, nhóm C_1-C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau và nhóm C_1-C_6 alkoxy; nhóm xyano; hoặc nhóm N-hydroxy- C_1-C_6 alkanimidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C_1-C_6 alkyl và nhóm phenyl, và n là một số

nguyên từ 0 đến 2,

Y là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nhóm C₁-C₃ alkyl, nhóm metoxy, nhóm etoxy hoặc nhóm hydroxyl, và m là một số nguyên từ 0 đến 2,

(A2) hợp chất trong đó R¹ và R² là nhóm C₁-C₆ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau; hoặc nhóm phenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 5 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau,

R³ và R⁴ là nguyên tử hydro, nhóm metyl, nhóm etyl, nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

X là nguyên tử halogen; nhóm C₁-C₄ alkyl; nhóm C₂-C₃ alkynyl; nhóm phenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 2 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nhóm C₁-C₂ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử flo và nhóm C₁-C₂ alkoxy; nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm oxazolyl hoặc nhóm pyridyl, mà (4 nhóm) có thể được thế bằng từ 1 đến 3 phần tử thế giống hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nhóm C₁-C₂ alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử flo và nhóm C₁-C₂ alkoxy; nhóm xyano; hoặc nhóm N-hydroxy-C₁-C₂ alkanimidoyl trong đó nguyên tử hydro của nhóm hydroxyl có thể được thế bằng phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm nhóm C₁-C₂ alkyl và nhóm phenyl, và n là một số nguyên từ 0 đến 2,

Y là nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm metyl, và m là số nguyên 0 hoặc 1, hoặc

(A3) hợp chất trong đó R¹ và R² là nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm propyl, nhóm triflometyl, nhóm trifloetyl, nhóm phenyl, nhóm flophenyl hoặc nhóm clophenyl,

R³ và R⁴ là nguyên tử hydro, nhóm metyl hoặc nguyên tử flo,

X là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nhóm metyl, nhóm etynyl, nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm xyano, nhóm metoxyetanimidoyl, nhóm etoxyetanimidoyl hoặc nhóm phenoxyetanimidoyl, và n là số nguyên 0 hoặc 1,

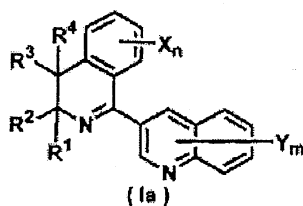
Y là nhóm metyl, và m là số nguyên 0 hoặc 1,

có thể được đề cập.

Liên quan đến các hợp chất (Ia), (Ib) hoặc (Ic) theo sáng chế, các hợp chất tiêu biểu được nêu trong các bảng sau đây, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở các hợp chất này.

Trong các bảng sau đây, "Me" là nhóm metyl, "Et" là nhóm etyl, "Pr" là nhóm propyl, "iPr" là nhóm isopropyl, "iBu" là nhóm isobutyl, "tBu" là nhóm t-butyl, "iPen" là nhóm isopentyl, "Vinyl" là nhóm vinyl, "Alyl" là nhóm alyl, "Etynyl" là nhóm etynyl, "Ph." là nhóm phenyl, "4FPh" là nhóm 4-flophenyl, "FUR" là nhóm furyl, "2THI" là nhóm 2-thienyl, "OXA" là nhóm oxazolyl, "Ac" là nhóm axetyl, "HEtIMD" là nhóm N-hydroxyetanimidoyl, "MeEtIMD" là nhóm N-metoxi-etanimidoyl, "3PYD" là nhóm 3-pyridyl, "Bn" là nhóm benzyl, "Ms" là nhóm metan-sulfonyl, "cBu" là vòng xyclobutan mà R^1 và R^2 hoặc R^3 và R^4 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành, "cPen" là vòng xyclopentyl mà R^1 và R^2 hoặc R^3 và R^4 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành, "3-MecPen" là vòng 3-metylxcyclopentyl mà R^1 và R^2 hoặc R^3 và R^4 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành, "cHex" là vòng xyclohexyl mà R^1 và R^2 hoặc R^3 và R^4 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành, "cHep" là vòng xycloheptyl mà R^1 và R^2 hoặc R^3 và R^4 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành, "O=" là nhóm oxo mà R^3 và R^4 cùng nhau tạo thành, "CH₂=" là nhóm metyliden mà R^3 và R^4 cùng nhau tạo thành, "H" trong "Xn" và "Ym" biểu thị rằng n bằng 0 hoặc m bằng 0, và chỗ trống trong "loại muối" biểu thị rằng nó ở dạng tự do.

Bảng 1



Hợp chất

số	R ¹ , R ²	R ³ , R ⁴	X _n	Y _m	Loại muối
1-1	Me, Me	H, H	H	H	
1-2	Me, Me	H, H	H	2-F	
1-3	Me, Me	H, H	H	4-F	
1-4	Me, Me	H, H	H	5-F	
1-5	Me, Me	H, H	H	6-F	
1-6	Me, Me	H, H	H	7-F	
1-7	Me, Me	H, H	H	8-F	
1-8	Me, Me	H, H	H	2-Cl	
1-9	Me, Me	H, H	H	4-Cl	
1-10	Me, Me	H, H	H	5-Cl	
1-11	Me, Me	H, H	H	6-Cl	
1-12	Me, Me	H, H	H	7-Cl	
1-13	Me, Me	H, H	H	8-Cl	
1-14	Me, Me	H, H	H	2-Me	
1-15	Me, Me	H, H	H	4-Me	
1-16	Me, Me	H, H	H	5-Me	
1-17	Me, Me	H, H	H	6-Me	
1-18	Me, Me	H, H	H	7-Me	
1-19	Me, Me	H, H	H	8-Me	
1-20	Me, Me	H, H	H	2-MeO	
1-21	Me, Me	H, H	H	4-MeO	
1-22	Me, Me	H, H	H	5-MeO	
1-23	Me, Me	H, H	H	6-MeO	
1-24	Me, Me	H, H	H	7-MeO	
1-25	Me, Me	H, H	H	8-MeO	

1-26	Me, Me	H, H	H	2-OH
1-27	Me, Me	H, H	H	4-OH
1-28	Me, Me	H, H	H	5-OH
1-29	Me, Me	H, H	H	6-OH
1-30	Me, Me	H, H	H	7-OH
1-31	Me, Me	H, H	H	8-OH
1-32	Me, Me	H, H	5-F	H
1-33	Me, Me	H, H	5-F	4-F
1-34	Me, Me	H, H	5-F	8-F
1-35	Me, Me	H, H	5-F	4-Cl
1-36	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
1-37	Me, Me	H, H	5-F	4-MeO
1-38	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
1-39	Me, Me	H, H	5-F	8-MeO
1-40	Me, Me	H, H	5-F	8-OH
1-41	Me, Me	H, H	6-F	H
1-42	Me, Me	H, H	7-F	H
1-43	Me, Me	H, H	8-F	H
1-44	Me, Me	H, H	5-Cl	H
1-45	Me, Me	H, H	5-Cl	4-F
1-46	Me, Me	H, H	5-Cl	8-F
1-47	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Cl
1-48	Me, Me	H, H	5-Cl	6-Cl
1-49	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Me
1-50	Me, Me	H, H	5-Cl	8-Me
1-51	Me, Me	H, H	5-Cl	8-MeO
1-52	Me, Me	H, H	5-Cl	8-OH
1-53	Me, Me	H, H	6-Cl	H
1-54	Me, Me	H, H	7-Cl	H
1-55	Me, Me	H, H	8-Cl	H
1-56	Me, Me	H, H	5-Br	H
1-57	Me, Me	H, H	5-Br	4-F
1-58	Me, Me	H, H	5-Br	8-F
1-59	Me, Me	H, H	5-Br	4-Cl
1-60	Me, Me	H, H	5-Br	6-Cl
1-61	Me, Me	H, H	5-Br	4-Me

1-62	Me, Me	H, H	5-Br	8-Me
1-63	Me, Me	H, H	5-Br	8-MeO
1-64	Me, Me	H, H	5-Br	8-OH
1-65	Me, Me	H, H	6-Br	H
1-66	Me, Me	H, H	7-Br	H
1-67	Me, Me	H, H	8-Br	H
1-68	Me, Me	H, H	5-I	H
1-69	Me, Me	H, H	5-Me	H
1-70	Me, Me	H, H	6-Me	H
1-71	Me, Me	H, H	7-Me	H
1-72	Me, Me	H, H	8-Me	H
1-73	Me, Me	H, H	5-Et	H
1-74	Me, Me	H, H	6-Et	H
1-75	Me, Me	H, H	7-Et	H
1-76	Me, Me	H, H	8-Et	H
1-77	Me, Me	H, H	5-Pr	H
1-78	Me, Me	H, H	6-Pr	H
1-79	Me, Me	H, H	7-Pr	H
1-80	Me, Me	H, H	8-Pr	H
1-81	Me, Me	H, H	5-Vinyl	H
1-82	Me, Me	H, H	6-Vinyl	H
1-83	Me, Me	H, H	7-Vinyl	H
1-84	Me, Me	H, H	8-Vinyl	H
1-85	Me, Me	H, H	5-Etynyl	H
1-86	Me, Me	H, H	6-Etynyl	H
1-87	Me, Me	H, H	7-Etynyl	H
1-88	Me, Me	H, H	8-Etynyl	H
1-89	Me, Me	H, H	5-Ph	H
1-90	Me, Me	H, H	6-Ph	H
1-91	Me, Me	H, H	7-Ph	H
1-92	Me, Me	H, H	8-Ph	H
1-93	Me, Me	H, H	5-FUR	H
1-94	Me, Me	H, H	5-2THI	H
1-95	Me, Me	H, H	5-3THI	H
1-96	Me, Me	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-97	Me, Me	H, H	OXA	H

1-98	Me, Me	H, H	5-HEtIMD	H
1-99	Me, Me	H, H	5-MeMeIMD	H
1-100	Me, Me	H, H	5-MeEtIMD	H
1-101	Me, Me	H, H	5-EtEtIMD	H
1-102	Me, Me	H, H	5-PrEtIMD	H
1-103	Me, Me	H, H	5-tBulEtIMD	H
1-104	Me, Me	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-105	Me, Me	H, H	5-BnEtIMD	H
1-106	Me, Me	H, H	5-PhEtIMD	H
1-107	Me, Me	H, H	5-MeO	H
1-108	Me, Me	H, H	6-MeO	H
1-109	Me, Me	H, H	7-MeO	H
1-110	Me, Me	H, H	8-MeO	H
1-111	Me, Me	H, H	5-NH ₂	H
1-112	Me, Me	H, H	5-NHAc	H
1-113	Me, Me	H, H	5-CHO	H
1-114	Me, Me	H, H	5-Ac	H
1-115	Me, Me	H, H	5-CONHMe	H
1-116	Me, Me	H, H	5-CN	H
1-117	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
1-118	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	4-F
1-119	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	8-F
1-120	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	4-Cl
1-121	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	6-Cl
1-122	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	4-Me
1-123	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	8-Me
1-124	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	8-MeO
1-125	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	8-OH
1-126	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-127	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	4-F
1-128	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	8-F
1-129	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	4-Cl
1-130	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	6-Cl
1-131	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	4-Me
1-132	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	8-Me
1-133	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	8-MeO

1-134	Me, Me	H, H	5,6-Cl ₂	8-OH
1-135	Me, Me	H, H	5-F,7-Me	H
1-136	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
1-137	Me, Et	H, H	H	H
1-138	Me, Et	H, H	H	4-F
1-139	Me, Et	H, H	H	8-F
1-140	Me, Et	H, H	H	4-Cl
1-141	Me, Et	H, H	H	6-Cl
1-142	Me, Et	H, H	H	8-Cl
1-143	Me, Et	H, H	H	4-Me
1-144	Me, Et	H, H	H	8-Me
1-145	Me, Et	H, H	H	8-MeO
1-146	Me, Et	H, H	H	8-OH
1-147	Me, Et	H, H	5-F	H
1-148	Me, Et	H, H	6-F	H
1-149	Me, Et	H, H	7-F	H
1-150	Me, Et	H, H	5-Cl	H
1-151	Me, Et	H, H	6-Cl	H
1-152	Me, Et	H, H	7-Cl	H
1-153	Me, Et	H, H	5-Br	H
1-154	Me, Et	H, H	6-Br	H
1-155	Me, Et	H, H	7-Br	H
1-156	Me, Et	H, H	5-I	H
1-157	Me, Et	H, H	5-Me	H
1-158	Me, Et	H, H	5-Vinyl	H
1-159	Me, Et	H, H	5-Etynyl	H
1-160	Me, Et	H, H	5-Ph	H
1-161	Me, Et	H, H	5-FUR	H
1-162	Me, Et	H, H	5-2THI	H
1-163	Me, Et	H, H	5-3THI	H
1-164	Me, Et	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-165	Me, Et	H, H	OXA	H
1-166	Me, Et	H, H	5-MeMeIMD	H
1-167	Me, Et	H, H	5-MeEtIMD	H
1-168	Me, Et	H, H	5-EtEtIMD	H
1-169	Me, Et	H, H	5-AllylEtIMD	H

1-170	Me, Et	H, H	5-BnEtIMD	H
1-171	Me, Et	H, H	5-PhEtIMD	H
1-172	Me, Et	H, H	5-CN	H
1-173	Me, Et	H, H	5,6-F ₂	H
1-174	Me, Et	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-175	Me, Pr	H, H	H	H
1-176	Me, Pr	H, H	H	4-F
1-177	Me, Pr	H, H	H	8-F
1-178	Me, Pr	H, H	H	4-Cl
1-179	Me, Pr	H, H	H	6-Cl
1-180	Me, Pr	H, H	H	8-Cl
1-181	Me, Pr	H, H	H	4-Me
1-182	Me, Pr	H, H	H	8-Me
1-183	Me, Pr	H, H	H	8-MeO
1-184	Me, Pr	H, H	H	8-OH
1-185	Me, Pr	H, H	5-F	H
1-186	Me, Pr	H, H	6-F	H
1-187	Me, Pr	H, H	7-F	H
1-188	Me, Pr	H, H	5-Cl	H
1-189	Me, Pr	H, H	6-Cl	H
1-190	Me, Pr	H, H	7-Cl	H
1-191	Me, Pr	H, H	5-Br	H
1-192	Me, Pr	H, H	6-Br	H
1-193	Me, Pr	H, H	7-Br	H
1-194	Me, Pr	H, H	5-I	H
1-195	Me, Pr	H, H	5-Me	H
1-196	Me, Pr	H, H	5-Vinyl	H
1-197	Me, Pr	H, H	5-Etynyl	H
1-198	Me, Pr	H, H	5-Ph	H
1-199	Me, Pr	H, H	5-FUR	H
1-200	Me, Pr	H, H	5-2THI	H
1-201	Me, Pr	H, H	5-3THI	H
1-202	Me, Pr	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-203	Me, Pr	H, H	OXA	H
1-204	Me, Pr	H, H	5-MeMeIMD	H
1-205	Me, Pr	H, H	5-MeEtIMD	H

1-206	Me, Pr	H, H	5-EtEtIMD	H
1-207	Me, Pr	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-208	Me, Pr	H, H	5-BnEtIMD	H
1-209	Me, Pr	H, H	5-PhEtIMD	H
1-210	Me, Pr	H, H	5-CN	H
1-211	Me, Pr	H, H	5,6-F ₂	H
1-212	Me, Pr	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-213	Me, iPr	H, H	H	H
1-214	Me, iPr	H, H	H	4-F
1-215	Me, iPr	H, H	H	8-F
1-216	Me, iPr	H, H	H	4-Cl
1-217	Me, iPr	H, H	H	6-Cl
1-218	Me, iPr	H, H	H	8-Cl
1-219	Me, iPr	H, H	H	4-Me
1-220	Me, iPr	H, H	H	8-Me
1-221	Me, iPr	H, H	H	8-MeO
1-222	Me, iPr	H, H	H	8-OH
1-223	Me, iPr	H, H	5-F	H
1-224	Me, iPr	H, H	6-F	H
1-225	Me, iPr	H, H	7-F	H
1-226	Me, iPr	H, H	5-Cl	H
1-227	Me, iPr	H, H	6-Cl	H
1-228	Me, iPr	H, H	7-Cl	H
1-229	Me, iPr	H, H	5-Br	H
1-230	Me, iPr	H, H	6-Br	H
1-231	Me, iPr	H, H	7-Br	H
1-232	Me, iPr	H, H	5-I	H
1-233	Me, iPr	H, H	5-Me	H
1-234	Me, iPr	H, H	5-Vinyl	H
1-235	Me, iPr	H, H	5-Etynyl	H
1-236	Me, iPr	H, H	5-Ph	H
1-237	Me, iPr	H, H	5-FUR	H
1-238	Me, iPr	H, H	5-2THI	H
1-239	Me, iPr	H, H	5-3THI	H
1-240	Me, iPr	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-241	Me, iPr	H, H	OXA	H

1-242	Me, iPr	H, H	5-MeMeIMD	H
1-243	Me, iPr	H, H	5-MeEtIMD	H
1-244	Me, iPr	H, H	5-EtEtIMD	H
1-245	Me, iPr	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-246	Me, iPr	H, H	5-BnEtIMD	H
1-247	Me, iPr	H, H	5-PhEtIMD	H
1-248	Me, iPr	H, H	5-CN	H
1-249	Me, iPr	H, H	5,6-F ₂	H
1-250	Me, iPr	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-251	Me, iBu	H, H	H	H
1-252	Me, iBu	H, H	H	4-F
1-253	Me, iBu	H, H	H	8-F
1-254	Me, iBu	H, H	H	4-Cl
1-255	Me, iBu	H, H	H	6-Cl
1-256	Me, iBu	H, H	H	8-Cl
1-257	Me, iBu	H, H	H	4-Me
1-258	Me, iBu	H, H	H	8-Me
1-259	Me, iBu	H, H	H	8-MeO
1-260	Me, iBu	H, H	H	8-OH
1-261	Me, iBu	H, H	5-F	H
1-262	Me, iBu	H, H	6-F	H
1-263	Me, iBu	H, H	7-F	H
1-264	Me, iBu	H, H	5-Cl	H
1-265	Me, iBu	H, H	6-Cl	H
1-266	Me, iBu	H, H	7-Cl	H
1-267	Me, iBu	H, H	5-Br	H
1-268	Me, iBu	H, H	6-Br	H
1-269	Me, iBu	H, H	7-Br	H
1-270	Me, iBu	H, H	5-I	H
1-271	Me, iBu	H, H	5-Me	H
1-272	Me, iBu	H, H	5-Vinyl	H
1-273	Me, iBu	H, H	5-Etynyl	H
1-274	Me, iBu	H, H	5-Ph	H
1-275	Me, iBu	H, H	5-FUR	H
1-276	Me, iBu	H, H	5-2THI	H
1-277	Me, iBu	H, H	5-3THI	H

1-278	Me, iBu	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-279	Me, iBu	H, H	OXA	H
1-280	Me, iBu	H, H	5-MeMeIMD	H
1-281	Me, iBu	H, H	5-MeEtIMD	H
1-282	Me, iBu	H, H	5-EtEtIMD	H
1-283	Me, iBu	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-284	Me, iBu	H, H	5-BnEtIMD	H
1-285	Me, iBu	H, H	5-PhEtIMD	H
1-286	Me, iBu	H, H	5-CN	H
1-287	Me, iBu	H, H	5,6-F ₂	H
1-288	Me, iBu	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-289	Me, iBu	H, H	H	H
1-290	Me, iBu	H, H	5-F	H
1-291	Me, iBu	H, H	5-Cl	H
1-292	Me, iBu	H, H	5-Br	H
1-293	Me, tBu	H, H	5-I	H
1-294	Me, tBu	H, H	5-Me	H
1-295	Me, tBu	H, H	5-Vinyl	H
1-296	Me, tBu	H, H	5-Etynyl	H
1-297	Me, tBu	H, H	5-Ph	H
1-298	Me, tBu	H, H	5-FUR	H
1-299	Me, tBu	H, H	5-2THI	H
1-300	Me, tBu	H, H	5-3THI	H
1-301	Me, tBu	H, H	5-MeEtIMD	H
1-302	Me, tBu	H, H	5-EtEtIMD	H
1-303	Me, tBu	H, H	5-PhEtIMD	H
1-304	Me, tBu	H, H	5-CN	H
1-305	Me, tBu	H, H	5,6-F ₂	H
1-306	Me, tBu	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-307	Me, iPen	H, H	H	H
1-308	Me, iPen	H, H	H	4-F
1-309	Me, iPen	H, H	H	8-F
1-310	Me, iPen	H, H	H	4-Cl
1-311	Me, iPen	H, H	H	6-Cl
1-312	Me, iPen	H, H	H	8-Cl
1-313	Me, iPen	H, H	H	4-Me

1-314	Me, iPen	H, H	H	8-Me
1-315	Me, iPen	H, H	H	8-MeO
1-316	Me, iPen	H, H	H	8-OH
1-317	Me, iPen	H, H	5-F	H
1-318	Me, iPen	H, H	6-F	H
1-319	Me, iPen	H, H	7-F	H
1-320	Me, iPen	H, H	5-Cl	H
1-321	Me, iPen	H, H	6-Cl	H
1-322	Me, iPen	H, H	7-Cl	H
1-323	Me, iPen	H, H	5-Br	H
1-324	Me, iPen	H, H	6-Br	H
1-325	Me, iPen	H, H	7-Br	H
1-326	Me, iPen	H, H	5-I	H
1-327	Me, iPen	H, H	5-Me	H
1-328	Me, iPen	H, H	5-Vinyl	H
1-329	Me, iPen	H, H	5-Etynyl	H
1-330	Me, iPen	H, H	5-Ph	H
1-331	Me, iPen	H, H	5-FUR	H
1-332	Me, iPen	H, H	5-2THI	H
1-333	Me, iPen	H, H	5-3THI	H
1-334	Me, iPen	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-335	Me, iPen	H, H	OXA	H
1-336	Me, iPen	H, H	5-MeMeIMD	H
1-337	Me, iPen	H, H	5-MeEtIMD	H
1-338	Me, iPen	H, H	5-EtEtIMD	H
1-339	Me, iPen	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-340	Me, iPen	H, H	5-BnEtIMD	H
1-341	Me, iPen	H, H	5-PhEtIMD	H
1-342	Me, iPen	H, H	5-CN	H
1-343	Me, iPen	H, H	5,6-F ₂	H
1-344	Me, iPen	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-345	Et, Et	H, H	H	H
1-346	Et, Et	H, H	H	4-F
1-347	Et, Et	H, H	H	8-F
1-348	Et, Et	H, H	H	4-Cl
1-349	Et, Et	H, H	H	6-Cl

20556

1-350	Et, Et	H, H	H	8-Cl
1-351	Et, Et	H, H	H	4-Me
1-352	Et, Et	H, H	H	8-Me
1-353	Et, Et	H, H	H	8-MeO
1-354	Et, Et	H, H	H	8-OH
1-355	Et, Et	H, H	5-F	H
1-356	Et, Et	H, H	6-F	H
1-357	Et, Et	H, H	7-F	H
1-358	Et, Et	H, H	5-Cl	H
1-359	Et, Et	H, H	6-Cl	H
1-360	Et, Et	H, H	7-Cl	H
1-361	Et, Et	H, H	5-Br	H
1-362	Et, Et	H, H	6-Br	H
1-363	Et, Et	H, H	7-Br	H
1-364	Et, Et	H, H	5-I	H
1-365	Et, Et	H, H	5-Me	H
1-366	Et, Et	H, H	5-Vinyl	H
1-367	Et, Et	H, H	5-Etynyl	H
1-368	Et, Et	H, H	5-Ph	H
1-369	Et, Et	H, H	5-FUR	H
1-370	Et, Et	H, H	5-2THI	H
1-371	Et, Et	H, H	5-3THI	H
1-372	Et, Et	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-373	Et, Et	H, H	OXA	H
1-374	Et, Et	H, H	5-MeMeIMD	H
1-375	Et, Et	H, H	5-MeEtIMD	H
1-376	Et, Et	H, H	5-EtEtIMD	H
1-377	Et, Et	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-378	Et, Et	H, H	5-BnEtIMD	H
1-379	Et, Et	H, H	5-PhEtIMD	H
1-380	Et, Et	H, H	5-CN	H
1-381	Et, Et	H, H	5,6-F ₂	H
1-382	Et, Et	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-383	Et, iBu	H, H	H	H
1-384	Pr, Pr	H, H	H	H
1-385	Me, ClCH ₂	H, H	H	H

1-386	Me, Cl ₂ CH	H, H	H	H
1-387	Me, CF ₃	H, H	H	H
1-388	Me, CF ₃	H, H	H	4-F
1-389	Me, CF ₃	H, H	H	8-F
1-390	Me, CF ₃	H, H	H	4-Cl
1-391	Me, CF ₃	H, H	H	6-Cl
1-392	Me, CF ₃	H, H	H	8-Cl
1-393	Me, CF ₃	H, H	H	4-Me
1-394	Me, CF ₃	H, H	H	8-Me
1-395	Me, CF ₃	H, H	H	8-MeO
1-396	Me, CF ₃	H, H	H	8-OH
1-397	Me, CF ₃	H, H	5-F	H
1-398	Me, CF ₃	H, H	6-F	H
1-399	Me, CF ₃	H, H	7-F	H
1-400	Me, CF ₃	H, H	5-Cl	H
1-401	Me, CF ₃	H, H	6-Cl	H
1-402	Me, CF ₃	H, H	7-Cl	H
1-403	Me, CF ₃	H, H	5-Br	H
1-404	Me, CF ₃	H, H	6-Br	H
1-405	Me, CF ₃	H, H	7-Br	H
1-406	Me, CF ₃	H, H	5-I	H
1-407	Me, CF ₃	H, H	5-Me	H
1-408	Me, CF ₃	H, H	5-Vinyl	H
1-409	Me, CF ₃	H, H	5-Etynyl	H
1-410	Me, CF ₃	H, H	5-Ph	H
1-411	Me, CF ₃	H, H	5-FUR	H
1-412	Me, CF ₃	H, H	5-2THI	H
1-413	Me, CF ₃	H, H	5-3THI	H
1-414	Me, CF ₃	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-415	Me, CF ₃	H, H	OXA	H
1-416	Me, CF ₃	H, H	5-MeMeIMD	H
1-417	Me, CF ₃	H, H	5-MeEtIMD	H
1-418	Me, CF ₃	H, H	5-EtEtIMD	H
1-419	Me, CF ₃	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-420	Me, CF ₃	H, H	5-BnEtIMD	H
1-421	Me, CF ₃	H, H	5-PhEtIMD	H

1-422	Me, CF ₃	H, H	5-CN	H
1-423	Me, CF ₃	H, H	5,6-F ₂	H
1-424	Me, CF ₃	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-425	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	H
1-426	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	4-F
1-427	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	8-F
1-428	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	4-Cl
1-429	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	6-Cl
1-430	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	8-Cl
1-431	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	4-Me
1-432	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	8-Me
1-433	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	8-MeO
1-434	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	H	8-OH
1-435	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-F	H
1-436	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	6-F	H
1-437	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	7-F	H
1-438	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Cl	H
1-439	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	6-Cl	H
1-440	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	7-Cl	H
1-441	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Br	H
1-442	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	6-Br	H
1-443	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	7-Br	H
1-444	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-I	H
1-445	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Me	H
1-446	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Vinyl	H
1-447	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Etynyl	H
1-448	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-Ph	H
1-449	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-FUR	H
1-450	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-2THI	H
1-451	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-3THI	H
1-452	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-453	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	OXA	H
1-454	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-MeMeIMD	H
1-455	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-MeEtIMD	H
1-456	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-EtEtIMD	H
1-457	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-AllylEtIMD	H

1-458	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-BnEtIMD	H
1-459	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-PhEtIMD	H
1-460	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5-CN	H
1-461	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5,6-F ₂	H
1-462	Me, CF ₃ CH ₂	H, H	5,6-Cl ₂	H
	ClCH ₂ ,			
1-463	ClCH ₂	H, H	H	H
1-464	Me, Ph	H, H	H	H
1-465	Me, Ph	H, H	H	4-F
1-466	Me, Ph	H, H	H	8-F
1-467	Me, Ph	H, H	H	4-Cl
1-468	Me, Ph	H, H	H	6-Cl
1-469	Me, Ph	H, H	H	8-Cl
1-470	Me, Ph	H, H	H	4-Me
1-471	Me, Ph	H, H	H	8-Me
1-472	Me, Ph	H, H	H	8-MeO
1-473	Me, Ph	H, H	H	8-OH
1-474	Me, Ph	H, H	5-F	H
1-475	Me, Ph	H, H	6-F	H
1-476	Me, Ph	H, H	7-F	H
1-477	Me, Ph	H, H	5-Cl	H
1-478	Me, Ph	H, H	6-Cl	H
1-479	Me, Ph	H, H	7-Cl	H
1-480	Me, Ph	H, H	5-Br	H
1-481	Me, Ph	H, H	6-Br	H
1-482	Me, Ph	H, H	7-Br	H
1-483	Me, Ph	H, H	5-I	H
1-484	Me, Ph	H, H	5-Me	H
1-485	Me, Ph	H, H	5-Vinyl	H
1-486	Me, Ph	H, H	5-Etynyl	H
1-487	Me, Ph	H, H	5-Ph	H
1-488	Me, Ph	H, H	5-FUR	H
1-489	Me, Ph	H, H	5-2THI	H
1-490	Me, Ph	H, H	5-3THI	H
1-491	Me, Ph	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-492	Me, Ph	H, H	OXA	H

1-493	Me, Ph	H, H	5-MeMeIMD	H
1-494	Me, Ph	H, H	5-MeEtIMD	H
1-495	Me, Ph	H, H	5-EtEtIMD	H
1-496	Me, Ph	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-497	Me, Ph	H, H	5-BnEtIMD	H
1-498	Me, Ph	H, H	5-PhEtIMD	H
1-499	Me, Ph	H, H	5-CN	H
1-500	Me, Ph	H, H	5,6-F ₂	H
1-501	Me, Ph	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-502	Me, 4FPh	H, H	H	H
1-503	Me, 4FPh	H, H	H	4-F
1-504	Me, 4FPh	H, H	H	8-F
1-505	Me, 4FPh	H, H	H	4-Cl
1-506	Me, 4FPh	H, H	H	6-Cl
1-507	Me, 4FPh	H, H	H	8-Cl
1-508	Me, 4FPh	H, H	H	4-Me
1-509	Me, 4FPh	H, H	H	8-Me
1-510	Me, 4FPh	H, H	H	8-MeO
1-511	Me, 4FPh	H, H	H	8-OH
1-512	Me, 4FPh	H, H	5-F	H
1-513	Me, 4FPh	H, H	6-F	H
1-514	Me, 4FPh	H, H	7-F	H
1-515	Me, 4FPh	H, H	5-Cl	H
1-516	Me, 4FPh	H, H	6-Cl	H
1-517	Me, 4FPh	H, H	7-Cl	H
1-518	Me, 4FPh	H, H	5-Br	H
1-519	Me, 4FPh	H, H	6-Br	H
1-520	Me, 4FPh	H, H	7-Br	H
1-521	Me, 4FPh	H, H	5-I	H
1-522	Me, 4FPh	H, H	5-Me	H
1-523	Me, 4FPh	H, H	5-Vinyl	H
1-524	Me, 4FPh	H, H	5-Etynyl	H
1-525	Me, 4FPh	H, H	5-Ph	H
1-526	Me, 4FPh	H, H	5-FUR	H
1-527	Me, 4FPh	H, H	5-2THI	H
1-528	Me, 4FPh	H, H	5-3THI	H

1-529	Me, 4FPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-530	Me, 4FPh	H, H	OXA	H
1-531	Me, 4FPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-532	Me, 4FPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-533	Me, 4FPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-534	Me, 4FPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-535	Me, 4FPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-536	Me, 4FPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-537	Me, 4FPh	H, H	5-CN	H
1-538	Me, 4FPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-539	Me, 4FPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-540	Me, 4ClPh	H, H	H	H
1-541	Me, 4ClPh	H, H	H	4-F
1-542	Me, 4ClPh	H, H	H	8-F
1-543	Me, 4ClPh	H, H	H	4-Cl
1-544	Me, 4ClPh	H, H	H	6-Cl
1-545	Me, 4ClPh	H, H	H	8-Cl
1-546	Me, 4ClPh	H, H	H	4-Me
1-547	Me, 4ClPh	H, H	H	8-Me
1-548	Me, 4ClPh	H, H	H	8-MeO
1-549	Me, 4ClPh	H, H	H	8-OH
1-550	Me, 4ClPh	H, H	5-F	H
1-551	Me, 4ClPh	H, H	6-F	H
1-552	Me, 4ClPh	H, H	7-F	H
1-553	Me, 4ClPh	H, H	5-Cl	H
1-554	Me, 4ClPh	H, H	6-Cl	H
1-555	Me, 4ClPh	H, H	7-Cl	H
1-556	Me, 4ClPh	H, H	5-Br	H
1-557	Me, 4ClPh	H, H	6-Br	H
1-558	Me, 4ClPh	H, H	7-Br	H
1-559	Me, 4ClPh	H, H	5-I	H
1-560	Me, 4ClPh	H, H	5-Me	H
1-561	Me, 4ClPh	H, H	5-Vinyl	H
1-562	Me, 4ClPh	H, H	5-Etynyl	H
1-563	Me, 4ClPh	H, H	5-Ph	H
1-564	Me, 4ClPh	H, H	5-FUR	H

1-565	Me, 4ClPh	H, H	5-2THI	H
1-566	Me, 4ClPh	H, H	5-3THI	H
1-567	Me, 4ClPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-568	Me, 4ClPh	H, H	OXA	H
1-569	Me, 4ClPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-570	Me, 4ClPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-571	Me, 4ClPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-572	Me, 4ClPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-573	Me, 4ClPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-574	Me, 4ClPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-575	Me, 4ClPh	H, H	5-CN	H
1-576	Me, 4ClPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-577	Me, 4ClPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-578	Ph, CF ₃	H, H	H	H
1-579	Ph, CF ₃	H, H	5-F	H
1-580	Ph, CF ₃	H, H	5-Cl	H
1-581	Ph, CF ₃	H, H	5-Br	H
1-582	Ph, CF ₃	H, H	5-I	H
1-583	Ph, CF ₃	H, H	5-Me	H
1-584	Ph, CF ₃	H, H	5-Vinyl	H
1-585	Ph, CF ₃	H, H	5-Etynyl	H
1-586	Ph, CF ₃	H, H	5-Ph	H
1-587	Ph, CF ₃	H, H	5-FUR	H
1-588	Ph, CF ₃	H, H	5-2THI	H
1-589	Ph, CF ₃	H, H	5-3THI	H
1-590	Ph, CF ₃	H, H	5-MeEtIMD	H
1-591	Ph, CF ₃	H, H	5-EtEtIMD	H
1-592	Ph, CF ₃	H, H	5-PhEtIMD	H
1-593	Ph, CF ₃	H, H	5-CN	H
1-594	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	H
1-595	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	4-F
1-596	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	8-F
1-597	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	4-Cl
1-598	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	6-Cl
1-599	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	8-Cl
1-600	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	4-Me

1-601	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	8-Me
1-602	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	8-MeO
1-603	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	H	8-OH
1-604	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-F	H
1-605	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	6-F	H
1-606	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	7-F	H
1-607	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Cl	H
1-608	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	6-Cl	H
1-609	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	7-Cl	H
1-610	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Br	H
1-611	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	6-Br	H
1-612	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	7-Br	H
1-613	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-I	H
1-614	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Me	H
1-615	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Vinyl	H
1-616	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Etynyl	H
1-617	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-Ph	H
1-618	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-FUR	H
1-619	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-2THI	H
1-620	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-3THI	H
1-621	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-622	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	OXA	H
1-623	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-624	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-625	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-626	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-627	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-628	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-629	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5-CN	H
1-630	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-631	ClCH ₂ , 4FPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-632	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	H
1-633	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	4-F
1-634	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	8-F
1-635	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	4-Cl
1-636	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	6-Cl

1-637	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	8-Cl
1-638	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	4-Me
1-639	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	8-Me
1-640	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	8-MeO
1-641	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	H	8-OH
1-642	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-F	H
1-643	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	6-F	H
1-644	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	7-F	H
1-645	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Cl	H
1-646	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	6-Cl	H
1-647	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	7-Cl	H
1-648	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Br	H
1-649	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	6-Br	H
1-650	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	7-Br	H
1-651	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-I	H
1-652	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Me	H
1-653	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Vinyl	H
1-654	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Etynyl	H
1-655	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Ph	H
1-656	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-FUR	H
1-657	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-2THI	H
1-658	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-3THI	H
1-659	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-660	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	OXA	H
1-661	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-MeMeIMD	H
1-662	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-MeEtIMD	H
1-663	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-EtEtIMD	H
1-664	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-665	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-BnEtIMD	H
1-666	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-PhEtIMD	H
1-667	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-CN	H
1-668	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5,6-F ₂	H
1-669	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-670	Me, 3PYD	H, H	H	H
1-671	Me, 4PYD	H, H	H	H
1-672	Me, Bn	H, H	H	H

1-673	Me, Bn	H, H	H	4-F
1-674	Me, Bn	H, H	H	8-F
1-675	Me, Bn	H, H	H	4-Cl
1-676	Me, Bn	H, H	H	6-Cl
1-677	Me, Bn	H, H	H	8-Cl
1-678	Me, Bn	H, H	H	4-Me
1-679	Me, Bn	H, H	H	8-Me
1-680	Me, Bn	H, H	H	8-MeO
1-681	Me, Bn	H, H	H	8-OH
1-682	Me, Bn	H, H	5-F	H
1-683	Me, Bn	H, H	6-F	H
1-684	Me, Bn	H, H	7-F	H
1-685	Me, Bn	H, H	5-Cl	H
1-686	Me, Bn	H, H	6-Cl	H
1-687	Me, Bn	H, H	7-Cl	H
1-688	Me, Bn	H, H	5-Br	H
1-689	Me, Bn	H, H	6-Br	H
1-690	Me, Bn	H, H	7-Br	H
1-691	Me, Bn	H, H	5-I	H
1-692	Me, Bn	H, H	5-Me	H
1-693	Me, Bn	H, H	5-Vinyl	H
1-694	Me, Bn	H, H	5-Etynyl	H
1-695	Me, Bn	H, H	5-Ph	H
1-696	Me, Bn	H, H	5-FUR	H
1-697	Me, Bn	H, H	5-2THI	H
1-698	Me, Bn	H, H	5-3THI	H
1-699	Me, Bn	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-700	Me, Bn	H, H	OXA	H
1-701	Me, Bn	H, H	5-MeMeIMD	H
1-702	Me, Bn	H, H	5-MeEtIMD	H
1-703	Me, Bn	H, H	5-EtEtIMD	H
1-704	Me, Bn	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-705	Me, Bn	H, H	5-BnEtIMD	H
1-706	Me, Bn	H, H	5-PhEtIMD	H
1-707	Me, Bn	H, H	5-CN	H
1-708	Me, Bn	H, H	5,6-F ₂	H

1-709	Me, Bn	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-710	cPen	H, H	H	H
1-711	cPen	H, H	H	4-F
1-712	cPen	H, H	H	8-F
1-713	cPen	H, H	H	4-Cl
1-714	cPen	H, H	H	6-Cl
1-715	cPen	H, H	H	8-Cl
1-716	cPen	H, H	H	4-Me
1-717	cPen	H, H	H	8-Me
1-718	cPen	H, H	H	8-MeO
1-719	cPen	H, H	H	8-OH
1-720	cPen	H, H	5-F	H
1-721	cPen	H, H	6-F	H
1-722	cPen	H, H	7-F	H
1-723	cPen	H, H	6-F	4-Me
1-724	cPen	H, H	5-Cl	H
1-725	cPen	H, H	6-Cl	H
1-726	cPen	H, H	7-Cl	H
1-727	cPen	H, H	5-Br	H
1-728	cPen	H, H	6-Br	H
1-729	cPen	H, H	7-Br	H
1-730	cPen	H, H	5-I	H
1-731	cPen	H, H	5-Me	H
1-732	cPen	H, H	5-Vinyl	H
1-733	cPen	H, H	5-Etynyl	H
1-734	cPen	H, H	5-Ph	H
1-735	cPen	H, H	5-FUR	H
1-736	cPen	H, H	5-2THI	H
1-737	cPen	H, H	5-3THI	H
1-738	cPen	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-739	cPen	H, H	OXA	H
1-740	cPen	H, H	5-MeMeIMD	H
1-741	cPen	H, H	5-MeEtIMD	H
1-742	cPen	H, H	5-EtEtIMD	H
1-743	cPen	H, H	5-AllylEtIMD	H
1-744	cPen	H, H	5-BnEtIMD	H

1-745	cPen	H, H	5-PhEtIMD	H
1-746	cPen	H, H	5-CN	H
1-747	cPen	H, H	5,6-F ₂	H
1-748	cPen	H, H	5,6-Cl ₂	H
1-749	cHex	H, H	H	H
1-750	cHex	H, H	H	4-F
1-751	cHex	H, H	H	8-F
1-752	cHex	H, H	H	4-Cl
1-753	cHex	H, H	H	6-Cl
1-754	cHex	H, H	H	8-Cl
1-755	cHex	H, H	H	4-Me
1-756	cHex	H, H	H	8-Me
1-757	cHex	H, H	H	8-MeO
1-758	cHex	H, H	H	8-OH
1-759	cHex	H, H	5-F	H
1-760	cHex	H, H	6-F	H
1-761	cHex	H, H	7-F	H
1-762	cHex	H, H	5-F	4-Me
1-763	cHex	H, H	5-Cl	H
1-764	cHex	H, H	6-Cl	H
1-765	cHex	H, H	7-Cl	H
1-766	cHex	H, H	5-Cl	4-Me
1-767	cHex	H, H	5-Br	H
1-768	cHex	H, H	6-Br	H
1-769	cHex	H, H	7-Br	H
1-770	cHex	H, H	5-I	H
1-771	cHex	H, H	5-Me	H
1-772	cHex	H, H	6-Me	H
1-773	cHex	H, H	7-Me	H
1-774	cHex	H, H	6-Me	4-Me
1-775	cHex	H, H	5-FUR	H
1-776	cHex	H, H	5-2THI	H
1-777	cHex	H, H	5-3THI	H
1-778	cHex	H, H	5-(2-Cl-2THI)	H
1-779	cHex	H, H	OXA	H
1-780	cHex	H, H	5-MeMeIMD	H

1-781	cHex	H, H	5-MeEtIMD	H	
1-782	cHex	H, H	5-EtEtIMD	H	
1-783	cHex	H, H	5-AllylEtIMD	H	
1-784	cHex	H, H	5-BnEtIMD	H	
1-785	cHex	H, H	5-PhEtIMD	H	
1-786	cHex	H, H	6-CN	H	
1-787	cHex	H, H	5,6-F ₂	H	
1-788	cHex	H, H	5,6-Cl ₂	H	
1-789	cHeP	H, H	H	H	
1-790	3-MecPen	H, H	H	H	
1-791	3-MecPen	H, H	5-F	H	
1-792	Me, Me	H, H	H	H	Muối HCl
1-793	Me, Me	H, H	5-F	H	Muối HCl
1-794	Me, Me	H, H	5-Cl	H	Muối HCl
1-795	Me, Me	H, H	H	H	Muối H ₂ SO ₄
1-796	Me, Me	H, H	5-F	H	Muối H ₂ SO ₄
1-797	Me, Me	H, H	5-Cl	H	Muối H ₂ SO ₄
1-798	Me, Me	H, H	H	H	Muối HNO ₃
1-799	Me, Me	H, H	5-F	H	Muối HNO ₃
1-800	Me, Me	H, H	5-Cl	H	Muối HNO ₃
1-801	Me, Me	H, H	H	H	Muối (COOH):
1-802	Me, Me	H, H	5-F	H	Muối (COOH):
1-803	Me, Me	H, H	H	H	Muối MsOH
1-804	Me, Me	H, H	5-F	H	Muối MsOH
1-805	Me, Me	H, H	H	H	Salixylat
1-806	Me, Me	H, H	5-F	H	Salixylat
1-807	Me, Me	H, H	5-F	H	Fumarat
1-808	Me, Et	H, H	H	H	Muối HCl
1-809	Me, Et	H, H	5-F	H	Muối HCl
1-810	Me, Et	H, H	5-Cl	H	Muối HCl
1-811	Me, Et	H, H	H	H	Muối H ₂ SO ₄
1-812	Me, Et	H, H	5-F	H	Muối H ₂ SO ₄
1-813	Me, Et	H, H	5-Cl	H	Muối H ₂ SO ₄
1-814	Me, Et	H, H	H	H	Muối HNO ₃
1-815	Me, Et	H, H	5-F	H	Muối HNO ₃
1-816	Me, Et	H, H	5-Cl	H	Muối HNO ₃

1-817	Me, Et	H, H	H	H	Muối (COOH):
1-818	Me, Et	H, H	5-F	H	Muối (COOH):
1-819	Me, Et	H, H	H	H	Muối MsOH
1-820	Me, Et	H, H	5-F	H	Muối MsOH
1-821	Me, Et	H, H	H	H	Salixylat
1-822	Me, Et	H, H	5-F	H	Salixylat
1-823	Me, Et	H, H	5-F	H	Fumarat
1-824	Me, Pr	H, H	H	H	Muối HCl
1-825	Me, Pr	H, H	5-F	H	Muối HCl
1-826	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	Muối HCl
1-827	Me, Pr	H, H	H	H	Muối H ₂ SO ₄
1-828	Me, Pr	H, H	5-F	H	Muối H ₂ SO ₄
1-829	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	Muối H ₂ SO ₄
1-830	Me, Pr	H, H	H	H	Muối HNO ₃
1-831	Me, Pr	H, H	5-F	H	Muối HNO ₃
1-832	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	Muối HNO ₃
1-833	Me, Pr	H, H	H	H	Muối (COOH):
1-834	Me, Pr	H, H	5-F	H	Muối (COOH):
1-835	Me, Pr	H, H	H	H	Muối MsOH
1-836	Me, Pr	H, H	5-F	H	Muối MsOH
1-837	Me, Pr	H, H	H	H	Salixylat
1-838	Me, Pr	H, H	5-F	H	Salixylat
1-839	Me, Pr	H, H	5-F	H	Fumarat
1-840	Me, Ph	H, H	H	H	Muối HCl
1-841	Me, Ph	H, H	5-F	H	Muối HCl
1-842	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	Muối HCl
1-843	Me, Ph	H, H	H	H	Muối H ₂ SO ₄
1-844	Me, Ph	H, H	5-F	H	Muối H ₂ SO ₄
1-845	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	Muối H ₂ SO ₄
1-846	Me, Ph	H, H	H	H	Muối HNO ₃
1-847	Me, Ph	H, H	5-F	H	Muối HNO ₃
1-848	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	Muối HNO ₃
1-849	Me, Ph	H, H	H	H	Muối (COOH):
1-850	Me, Ph	H, H	5-F	H	Muối (COOH):
1-851	Me, Ph	H, H	H	H	Muối MsOH
1-852	Me, Ph	H, H	5-F	H	Muối MsOH

20556

1-853	Me, Ph	H, H	H	H	Salixylat
1-854	Me, Ph	H, H	5-F	H	Salixylat
1-855	Me, Ph	H, H	5-F	H	Fumarat
1-856	Me, Me	H, Me	H	H	
1-857	Me, Me	H, Me	5-F	H	
1-858	Me, Me	H, Me	5-Cl	H	
1-859	Me, Me	H, Et	H	H	
1-860	Me, Me	H, Et	5-F	H	
1-861	Me, Me	H, Et	5-Cl	H	
1-862	Me, Me	H, Pr	H	H	
1-863	Me, Me	H, Pr	5-F	H	
1-864	Me, Me	H, Pr	5-Cl	H	
1-865	Me, Me	Me, Me	H	H	
1-866	Me, Me	Me, Me	5-F	H	
1-867	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H	
1-868	Me, Et	H, Me	H	H	
1-869	Me, Et	H, Me	5-F	H	
1-870	Me, Et	H, Me	5-Cl	H	
1-871	Me, Pr	H, Me	H	H	
1-872	Me, Pr	H, Me	5-F	H	
1-873	Me, Pr	H, Me	5-Cl	H	
1-874	Me, Ph	H, Me	H	H	
1-875	Me, Ph	H, Me	5-F	H	
1-876	Me, Ph	H, Me	5-Cl	H	
1-877	Me, Ph	Me, Me	H	H	
1-878	Me, Ph	Me, Me	5-F	H	
1-879	Me, Ph	Me, Me	5-Cl	H	
1-880	Me, Me	H, H	5-iPr	H	
			5-		
1-881	Me, Me	H, H	CH(Me)CH ₂ CH ₃	H	
1-882	Me, Me	H, H	5-C(Me)=CH ₂	H	
			5-		
1-883	Me, Me	H, H	CH=CHCO ₂ Me	H	
1-884	Me, Me	H, H	5-CH ₂ F	H	
1-885	Me, Me	H, H	5-CH ₂ Cl	H	
1-886	Me, Me	H, H	5-CHF ₂	H	

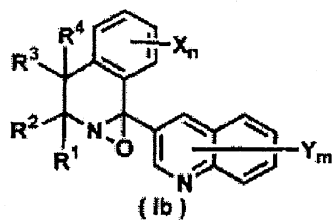
1-887	Me, Me	H, H	5-CH ₂ OH	H	
1-888	Me, Me	H, H	5-C(Me) ₂ OH	H	
1-889	Me, Me	H, H	5-CH ₂ OMe	H	
1-890	Me, Me	H, H	5-CH ₂ CO ₂ Me	H	
1-891	Me, Me	H, H	5-NHCOPh	H	
1-892	Me, Me	H, H	5-NHCO(2-FPh)	H	
1-893	Me, Me	H, H	5-NHCO(3-FPh)	H	
1-894	Me, Me	H, H	5-NHCO(4-FPh)	H	
1-895	Me, Me	H, H	5-CO ₂ H	H	
1-896	Me, Me	H, H	5-CO ₂ Me	H	
1-897	Me, Me	H, H	5-CO ₂ Et	H	
1-898	Me, Me	H, H	5-CONH ₂	H	
1-899	Me, Me	H, H	5-F	2-Me	
1-900	Me, Me	H, H	5-F	4-Me	
1-901	Me, Me	H, Me	5-F	2-Me	
1-902	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me	
1-903	Me, Me	H, Me	5-F	8-MeO	
1-904	Me, Me	Me, Me	6-F	H	
1-905	Me, Me	Me, Me	7-F	H	
1-906	Me, Me	Me, Me	5-F	2-Me	
1-907	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me	
1-908	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H	
1-909	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H	
1-910	Me, Me	Me, Me	5-F	H	Muối HCl
1-911	Me, Me	Me, Me	5-F	H	Muối H ₂ SO ₄
1-912	Me, Me	Me, Me	5-F	H	Muối HNO ₃
1-913	Me, Me	Me, Me	5-F	H	Muối MsOH
1-914	Me, Me	Me, Me	5-Me	H	
1-915	Me, Me	Me, Me	6-Me	H	
1-916	Me, Me	Me, Me	7-Me	H	
1-917	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F	
1-918	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F	
1-919	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me	
1-920	Me, Me	Me, Me	5-F	8-MeO	
1-921	Me, Me	cPen	H	H	
1-922	cPen	Me, Me	H	H	

20556

1-923	Me, Me	cHex	H	H
1-924		cHex	Me, Me	H
1-925		cBu	H, H	5-F
1-926	Me, Me	CH ₂ =	5-F	H
1-927	Me, Me	H, F	5-F	H
1-928	Me, Me	H, Cl	5-F	H
1-929	Me, Me	F, F	H	H
1-930	Me, Me	F, F	5-F	H
1-931	Me, Me	H, OH	5-F	H
1-932	Me, Me	H, OMe	5-F	H
1-933	Me, Me	O=	H	H
1-934	Me, Me	O=	5-F	H
1-935	Me, Me	Me, OH	5-F	H
1-936	Me, Me	Et, OH	5-F	H
		Me,		
1-937	Me, Me	OMe	5-F	H
1-938	Me, Me	Me, OEt	5-F	H
1-939	Me, Me	Et, OMe	5-F	H
1-940	Me, Me	F, F	6-F	H
1-941	Me, Me	F, F	7-F	H
1-942	Me, Me	F, F	5-Cl	H
1-943	Me, Me	F, F	6-Cl	H
1-944	Me, Me	F, F	7-Cl	H
1-945	Me, Me	F, F	5-Br	H
1-946	Me, Me	F, F	6-Br	H
1-947	Me, Me	F, F	7-Br	H
1-948	Me, Me	F, F	5-Me	H
1-949	Me, Me	F, F	6-Me	H
1-950	Me, Me	F, F	6-MeO	H
1-951	Me, Me	F, F	5,7-Cl ₂	H
1-952	Me, Me	F, F	6-F,7-Me	H
1-953	Me, Me	O=	6-F	H
1-954	Me, Me	O=	7-F	H
1-955	Me, Me	O=	5-Cl	H
1-956	Me, Me	O=	6-Cl	H
1-957	Me, Me	O=	7-Cl	H

1-958	Me, Me	O=	5-Br	H
1-959	Me, Me	O=	6-Br	H
1-960	Me, Me	O=	7-Br	H

Bảng 2



Hợp chất

số	R ¹ , R ²	R ³ , R ⁴	X _n	Y _m
2-1	Me, Me	H, H	H	H
2-2	Me, Me	H, H	H	5-F
2-3	Me, Me	H, H	H	6-F
2-4	Me, Me	H, H	H	7-F
2-5	Me, Me	H, H	H	8-F
2-6	Me, Me	H, H	H	5-Cl
2-7	Me, Me	H, H	H	6-Cl
2-8	Me, Me	H, H	H	7-Cl
2-9	Me, Me	H, H	H	8-Cl
2-10	Me, Me	H, H	H	2-Me
2-11	Me, Me	H, H	H	4-Me
2-12	Me, Me	H, H	H	5-Me
2-13	Me, Me	H, H	H	6-Me
2-14	Me, Me	H, H	H	7-Me
2-15	Me, Me	H, H	H	8-Me
2-16	Me, Me	H, H	H	8-MeO
2-17	Me, Me	H, H	H	2-OH
2-18	Me, Me	H, H	H	4-OH
2-19	Me, Me	H, H	H	8-OH
2-20	Me, Me	H, H	5-F	H
2-21	Me, Me	H, H	5-F	5-F
2-22	Me, Me	H, H	5-F	6-F

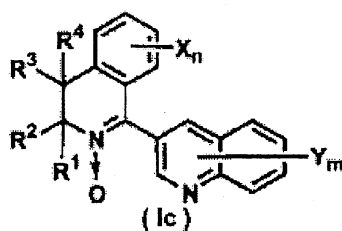
2-23	Me, Me	H, H	5-F	7-F
2-24	Me, Me	H, H	5-F	8-F
2-25	Me, Me	H, H	5-F	5-Cl
2-26	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
2-27	Me, Me	H, H	5-F	7-Cl
2-28	Me, Me	H, H	5-F	8-Cl
2-29	Me, Me	H, H	5-F	2-Me
2-30	Me, Me	H, H	5-F	4-Me
2-31	Me, Me	H, H	5-F	5-Me
2-32	Me, Me	H, H	5-F	6-Me
2-33	Me, Me	H, H	5-F	7-Me
2-34	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
2-35	Me, Me	H, H	5-F	8-MeO
2-36	Me, Me	H, H	5-F	2-OH
2-37	Me, Me	H, H	5-F	4-OH
2-38	Me, Me	H, H	5-F	1-OH
2-39	Me, Me	H, H	6-F	H
2-40	Me, Me	H, H	7-F	H
2-41	Me, Me	H, H	8-F	H
2-42	Me, Me	H, H	5-Cl	H
2-43	Me, Me	H, H	6-Cl	H
2-44	Me, Me	H, H	7-Cl	H
2-45	Me, Me	H, H	7-Me	H
2-46	Me, Me	H, H	8-Me	H
2-47	Me, Me	H, H	5-Et	H
2-48	Me, Me	H, H	5-MeO	H
2-49	Me, Me	H, H	6-MeO	H
2-50	Me, Me	H, H	7-MeO	H
2-51	Me, Me	H, H	8-MeO	H
2-52	Me, Me	H, H	5-EtO	H
2-53	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
2-54	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
2-55	Me, Me	H, H	H	H
2-56	Me, Me	H, Me	H	H
2-57	Me, Me	H, Me	H	5-F
2-58	Me, Me	H, Me	H	6-F

2-59	Me, Me	H, Me	H	7-F
2-60	Me, Me	H, Me	H	8-F
2-61	Me, Me	H, Me	H	2-Me
2-62	Me, Me	H, Me	H	4-Me
2-63	Me, Me	H, Me	H	8-Me
2-64	Me, Me	H, Me	H	8-MeO
2-65	Me, Me	H, Me	5-F	H
2-66	Me, Me	H, Me	5-F	5-F
2-67	Me, Me	H, Me	5-F	6-F
2-68	Me, Me	H, Me	5-F	7-F
2-69	Me, Me	H, Me	5-F	8-F
2-70	Me, Me	H, Me	5-F	2-Me
2-71	Me, Me	H, Me	5-F	4-Me
2-72	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me
2-73	Me, Me	H, Me	5-F	8-MeO
2-74	Me, Me	H, Me	6-F	H
2-75	Me, Me	H, Me	7-F	H
2-76	Me, Me	H, Me	8-F	H
2-77	Me, Me	H, Me	5-Cl	H
2-78	Me, Me	H, Me	6-Cl	H
2-79	Me, Me	H, Me	7-Cl	H
2-80	Me, Me	H, Me	8-Cl	H
2-81	Me, Me	H, Me	5-Me	H
2-82	Me, Me	H, Me	6-Me	H
2-83	Me, Me	H, Me	7-Me	H
2-84	Me, Me	H, Me	8-Me	H
2-85	Me, Me	H, Me	5-MeO	H
2-86	Me, Me	H, Me	6-MeO	H
2-87	Me, Me	H, Me	7-MeO	H
2-88	Me, Me	H, Me	8-MeO	H
2-89	Me, Me	H, Me	5,6-F ₂	H
2-90	Me, Me	H, Me	6-F,7-Me	H
2-91	Me, Me	Me, Me	H	H
2-92	Me, Me	Me, Me	H	5-F
2-93	Me, Me	Me, Me	H	6-F
2-94	Me, Me	Me, Me	H	7-F

2-95	Me, Me	Me, Me	H	8-F
2-96	Me, Me	Me, Me	H	2-Me
2-97	Me, Me	Me, Me	H	4-Me
2-98	Me, Me	Me, Me	H	8-Me
2-99	Me, Me	Me, Me	H	8-MeO
2-100	Me, Me	Me, Me	5-F	H
2-101	Me, Me	Me, Me	5-F	5-F
2-102	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F
2-103	Me, Me	Me, Me	5-F	7-F
2-104	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F
2-105	Me, Me	Me, Me	5-F	2-Me
2-106	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me
2-107	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me
2-108	Me, Me	Me, Me	5-F	8-OH
2-109	Me, Me	Me, Me	6-F	H
2-110	Me, Me	Me, Me	7-F	H
2-111	Me, Me	Me, Me	8-F	H
2-112	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H
2-113	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H
2-114	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H
2-115	Me, Me	Me, Me	8-Cl	H
2-116	Me, Me	Me, Me	5-Me	H
2-117	Me, Me	Me, Me	6-Me	H
2-118	Me, Me	Me, Me	7-Me	H
2-119	Me, Me	Me, Me	8-Me	H
2-120	Me, Me	Me, Me	5-MeO	H
2-121	Me, Me	Me, Me	6-MeO	H
2-122	Me, Me	Me, Me	7-MeO	H
2-123	Me, Me	Me, Me	8-MeO	H
2-124	Me, Me	Me, Me	5,6-F ₂	H
2-125	Me, Me	Me, Me	6-F,7-Me	H
2-126	Me, Me	cPen	H	H
2-127	cPen	Me, Me	H	H
2-128	Me, Me	cHex	H	H
2-129	cHex	Me, Me	H	H
2-130	Me, Et	H, H	5-F	H

2-131	Me, Me	CH ₂ =	5-F	H
2-132	Me, Me	H, F	5-F	H
2-133	Me, Me	H, Cl	5-F	H
2-134	Me, Me	F, F	H	H
2-135	Me, Me	F, F	5-F	H
2-136	Me, Me	H, OH	5-F	H
2-137	Me, Me	H, OMe	5-F	H
2-138	Me, Me	O=	H	H
2-139	Me, Me	O=	5-F	H
2-140	Me, Me	Me, OH	5-F	H
2-141	Me, Me	Et, OH	5-F	H
2-142	Me, Me	Me, OMe	5-F	H
2-143	Me, Me	Me, OEt	5-F	H
2-144	Me, Me	Et, OMe	5-F	H

Bảng 3



Hợp chất

số	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
3-1	Me, Me	H, H	H	H
3-2	Me, Me	H, H	H	5-F
3-3	Me, Me	H, H	H	6-F
3-4	Me, Me	H, H	H	7-F
3-5	Me, Me	H, H	H	8-F
3-6	Me, Me	H, H	H	5-Cl
3-7	Me, Me	H, H	H	6-Cl
3-8	Me, Me	H, H	H	7-Cl
3-9	Me, Me	H, H	H	8-Cl
3-10	Me, Me	H, H	H	2-Me
3-11	Me, Me	H, H	H	4-Me
3-12	Me, Me	H, H	H	5-Me

3-13	Me, Me	H, H	H	6-Me
3-14	Me, Me	H, H	H	7-Me
3-15	Me, Me	H, H	H	8-Me
3-16	Me, Me	H, H	H	8-MeO
3-17	Me, Me	H, H	H	2-OH
3-18	Me, Me	H, H	H	4-OH
3-19	Me, Me	H, H	H	8-OH
3-20	Me, Me	H, H	5-F	H
3-21	Me, Me	H, H	5-F	5-F
3-22	Me, Me	H, H	5-F	6-F
3-23	Me, Me	H, H	5-F	7-F
3-24	Me, Me	H, H	5-F	8-F
3-25	Me, Me	H, H	5-F	5-Cl
3-26	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
3-27	Me, Me	H, H	5-F	7-Cl
3-28	Me, Me	H, H	5-F	8-Cl
3-29	Me, Me	H, H	5-F	2-Me
3-30	Me, Me	H, H	5-F	4-Me
3-31	Me, Me	H, H	5-F	5-Me
3-32	Me, Me	H, H	5-F	6-Me
3-33	Me, Me	H, H	5-F	7-Me
3-34	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
3-35	Me, Me	H, H	5-F	8-MeO
3-36	Me, Me	H, H	5-F	2-OH
3-37	Me, Me	H, H	5-F	4-OH
3-38	Me, Me	H, H	5-F	1-OH
3-39	Me, Me	H, H	6-F	H
3-40	Me, Me	H, H	7-F	H
3-41	Me, Me	H, H	8-F	H
3-42	Me, Me	H, H	5-Cl	H
3-43	Me, Me	H, H	6-Cl	H
3-44	Me, Me	H, H	7-Cl	H
3-45	Me, Me	H, H	7-Me	H
3-46	Me, Me	H, H	8-Me	H
3-47	Me, Me	H, H	5-Et	H
3-48	Me, Me	H, H	5-MeO	H

3-49	Me, Me	H, H	6-MeO	H
3-50	Me, Me	H, H	7-MeO	H
3-51	Me, Me	H, H	8-MeO	H
3-52	Me, Me	H, H	5-EtO	H
3-53	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
3-54	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
3-55	Me, Me	H, H	H	H
3-56	Me, Me	H, Me	H	H
3-57	Me, Me	H, Me	H	5-F
3-58	Me, Me	H, Me	H	6-F
3-59	Me, Me	H, Me	H	7-F
3-60	Me, Me	H, Me	H	8-F
3-61	Me, Me	H, Me	H	2-Me
3-62	Me, Me	H, Me	H	4-Me
3-63	Me, Me	H, Me	H	8-Me
3-64	Me, Me	H, Me	H	8-MeO
3-65	Me, Me	H, Me	5-F	H
3-66	Me, Me	H, Me	5-F	5-F
3-67	Me, Me	H, Me	5-F	6-F
3-68	Me, Me	H, Me	5-F	7-F
3-69	Me, Me	H, Me	5-F	8-F
3-70	Me, Me	H, Me	5-F	2-Me
3-71	Me, Me	H, Me	5-F	4-Me
3-72	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me
3-73	Me, Me	H, Me	5-F	8-MeO
3-74	Me, Me	H, Me	6-F	H
3-75	Me, Me	H, Me	7-F	H
3-76	Me, Me	H, Me	8-F	H
3-77	Me, Me	H, Me	5-Cl	H
3-78	Me, Me	H, Me	6-Cl	H
3-79	Me, Me	H, Me	7-Cl	H
3-80	Me, Me	H, Me	8-Cl	H
3-81	Me, Me	H, Me	5-Me	H
3-82	Me, Me	H, Me	6-Me	H
3-83	Me, Me	H, Me	7-Me	H
3-84	Me, Me	H, Me	8-Me	H

3-85	Me, Me	H, Me	5-MeO	H
3-86	Me, Me	H, Me	6-MeO	H
3-87	Me, Me	H, Me	7-MeO	H
3-88	Me, Me	H, Me	8-MeO	H
3-89	Me, Me	H, Me	5,6-F ₂	H
3-90	Me, Me	H, Me	6-F,7-Me	H
3-91	Me, Me	Me, Me	H	H
3-92	Me, Me	Me, Me	H	5-F
3-93	Me, Me	Me, Me	H	6-F
3-94	Me, Me	Me, Me	H	7-F
3-95	Me, Me	Me, Me	H	8-F
3-96	Me, Me	Me, Me	H	2-Me
3-97	Me, Me	Me, Me	H	4-Me
3-98	Me, Me	Me, Me	H	8-Me
3-99	Me, Me	Me, Me	H	8-MeO
3-100	Me, Me	Me, Me	5-F	H
3-101	Me, Me	Me, Me	5-F	5-F
3-102	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F
3-103	Me, Me	Me, Me	5-F	7-F
3-104	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F
3-105	Me, Me	Me, Me	5-F	2-Me
3-106	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me
3-107	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me
3-108	Me, Me	Me, Me	5-F	8-MeO
3-109	Me, Me	Me, Me	6-F	H
3-110	Me, Me	Me, Me	7-F	H
3-111	Me, Me	Me, Me	8-F	H
3-112	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H
3-113	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H
3-114	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H
3-115	Me, Me	Me, Me	8-Cl	H
3-116	Me, Me	Me, Me	5-Me	H
3-117	Me, Me	Me, Me	6-Me	H
3-118	Me, Me	Me, Me	7-Me	H
3-119	Me, Me	Me, Me	8-Me	H
3-120	Me, Me	Me, Me	5-MeO	H

3-121	Me, Me	Me, Me	6-MeO	H
3-122	Me, Me	Me, Me	7-MeO	H
3-123	Me, Me	Me, Me	8-MeO	H
3-124	Me, Me	Me, Me	5,6-F ₂	H
3-125	Me, Me	Me, Me	6-F,7-Me	H
3-126	Me, Me	cPen	H	H
3-127	cPen	Me, Me	H	H
3-128	Me, Me	cHex	H	H
3-129	cHex	Me, Me	H	H
3-130	Me, Et	H, H	5-F	H
3-131	Me, Me	CH ₂ =	5-F	H
3-132	Me, Me	H, F	5-F	H
3-133	Me, Me	H, Cl	5-F	H
3-134	Me, Me	F, F	H	H
3-135	Me, Me	F, F	5-F	H
3-136	Me, Me	H, OH	5-F	H
3-137	Me, Me	H, OMe	5-F	H
3-138	Me, Me	O=	H	H
3-139	Me, Me	O=	5-F	H
3-140	Me, Me	Me, OH	5-F	H
3-141	Me, Me	Et, OH	5-F	H
3-142	Me, Me	Me, OMe	5-F	H
3-143	Me, Me	Me, OEt	5-F	H
3-144	Me, Me	Et, OMe	5-F	H

Hợp chất ưu tiên trong số các hợp chất nêu trên là,

hợp chất số 1-32: 3-(5-flo-3,3-dimetyl-3,4-dihydro-isoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-44: 3-(5-clo-3,3-dimetyl-3,4-dihydro-isoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-56: 3-(5-brom-3,3-dimetyl-3,4-dihydro-isoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-117: 3-(5,6-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-185: 3-(5-flo-3-metyl-3-propyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-387: 3-(3-metyl-3-triflometyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-425: 3-[3-metyl-3-(2,2,2-trifloetyl)-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl]quinolin,

hợp chất số 1-502: 3-[3-metyl-3-(4-flophenyl)-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl]-quinolin,

hợp chất số 1-865: 3-(3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-866: 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-918: 8-flo-3-(5-flo-3,3,4,4-tetra-metyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 1-919: 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)-8-metylquinolin,

hợp chất số 1-929: 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)-quinolin,

hợp chất số 1-930: 3-(4,4,-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 2-91: 3,3,4,4-tetrametyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,

hợp chất số 2-100: 5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,

hợp chất số 2-134: 4,4-diflo-3,3-dimetyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,

hợp chất số 2-135: 4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,

hợp chất số 3-100: 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 3-109: 3-(6-flo-3,3,4,4-tetrametyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

hợp chất số 3-134: 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, hoặc

hợp chất số 3-135: 3-(4,4-triflo-3,3-dimetyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

Các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế là các hợp chất thông dụng, và được sản xuất, ví dụ, theo các phương pháp được bộc lộ trong công bố quốc tế số WO 2005/070917 hoặc phương pháp tương tự.

Các hợp chất (Ia), (Ib) và (Ic) theo sáng chế hữu ích làm tác nhân xử lý đất chống lại các bệnh thực vật khác nhau trong nông nghiệp và lâm nghiệp. Ví dụ, làm tác nhân xử lý đất, chúng thể hiện các hiệu quả đề phòng và/hoặc phòng ngừa chống lại các bệnh gây ra bởi các bệnh thực vật khác nhau trong nông nghiệp và lâm nghiệp tốt hơn. Chúng thể hiện hiệu quả phòng ngừa chống lại các bệnh khác nhau tốt hơn, bao gồm, ví dụ, bệnh đạo ôn hại lúa, bệnh *Bakanae* hại lúa, bệnh lụi *Fusarium* và bệnh lụi cây con ở lúa mỳ, bệnh lụi cây con *Rhizoctonia* và bệnh chết rạp cây con *Pythium* ở dưa chuột, bệnh héo *Fusarium* ở dưa chuột, bệnh chết rạp cây con hoặc bệnh héo *Fusarium* ở cà chua. Vì các

hợp chất theo sáng chế thể hiện hiệu quả phòng ngừa (đề phòng) tốt hơn, chúng có thể phòng ngừa các bệnh bằng cách xử lý trước khi nhiễm bệnh.

Trong sáng chế, xử lý đất nghĩa là phun lên bề mặt đất, đưa vào trong đất, làm ướt đất hoặc trộn vào trong đất, hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính. Bằng cách xử lý đất bằng các hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính, thực vật có thể được bảo vệ khỏi các bệnh nhiễm khuẩn từ đất và nhiễm khuẩn từ không khí. Phun lên bề mặt đất, làm ướt đất và trộn vào trong đất có thể được thực hiện từ trước hoặc tại thời điểm gieo hạt cho đến khi cây lớn lên.

Trong sáng chế, xử lý hạt giống nghĩa là xử lý hạt giống bằng cách phun hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính lên hạt giống thực vật, xử lý hạt giống bằng cách tẩm hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính lên hạt giống thực vật, xử lý hạt giống bằng cách ngâm hạt giống trong hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính hoặc xử lý hạt giống bằng cách phủ hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính. Bằng cách xử lý hạt giống bằng hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế làm thành phần hoạt tính, được cho rằng có thể thu được các hiệu quả phòng ngừa của hạt chống lại các mầm bệnh bám chặt trên bề mặt và chống lại các mầm bệnh vốn đã xâm nhập bên trong hạt, và các hiệu quả phòng ngừa sự tấn công của bệnh chống lại mầm bệnh (sự nhiễm khuẩn từ đất, v.v.), sự tấn công của mầm bệnh được quan sát sau khi gieo hạt.

Hàm lượng sử dụng và nồng độ sử dụng có thể thay đổi phụ thuộc vào mục đích trồng trọt, các bệnh dự kiến, mức độ của bệnh, dạng thuốc của hợp chất, các phương pháp sử dụng và các điều kiện môi trường khác nhau. Trong trường hợp hạt giống được khử trùng, hàm lượng các hợp chất theo sáng chế được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 50g cho mỗi kilôgam hạt giống, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 10g cho mỗi kilôgam. Trong trường hợp xử lý đất, hàm lượng các hợp chất theo sáng chế được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 20 đến 20.000g cho mỗi hecta, tốt hơn là nằm trong

khoảng từ 100 đến 10.000g cho mỗi hecta. Trong trường hợp xử lý đất bằng cách phun trên bề mặt, xử lý bằng cách đưa vào trong đất hoặc xử lý bằng cách làm ướt đất, quá trình xử lý có thể được thực hiện bằng cách sử dụng chính hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế, hoặc sau khi pha loãng hợp phần này tới nồng độ mong muốn. Trong trường hợp hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế được sản xuất nhằm tiếp xúc với hạt giống, hạt giống có thể được ngâm trong tác nhân ở nguyên dạng của nó. Ngoài ra, hợp phần chứa các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng như nó vốn có hoặc sau khi được pha loãng tới nồng độ mong muốn, bằng cách đưa vào trong hạt giống thực vật, hoặc phủ, phun hoặc tẩm hạt giống thực vật với hợp phần này. Trong trường hợp hạt giống được xử lý bằng cách phủ, phun hoặc tẩm, hàm lượng hợp phần này được sử dụng (hàm lượng của các hợp chất theo sáng chế nằm trong khoảng từ 10 % trọng lượng/trọng lượng đến 70 % trọng lượng/trọng lượng) thường nằm trong khoảng từ xấp xỉ 0,05 đến xấp xỉ 50% tính theo trọng lượng của hạt giống thực vật khô, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 30%, và các hàm lượng được sử dụng đó không bị giới hạn trong phạm vi này, và sẽ khác nhau phụ thuộc vào dạng chế phẩm và loại hạt giống thực vật cần xử lý.

Trong sáng chế, hạt giống thực vật nghĩa là nơi chứa các chất dinh dưỡng để phôi nảy mầm và được sử dụng để nhân giống trong nông nghiệp, bao gồm, cụ thể, hạt của cây ngô, cây đậu nành, cây bông, cây gạo, cây củ cải đường, cây lúa mì, cây lúa mạch, cây hướng dương, cây cà chua, cây dưa chuột, cây cà, cây rau bina, cây đậu khô tách làm đôi, cây bí ngô, cây mía, cây thuốc lá, cây hồ tiêu xanh, cây cải dầu, v.v.; củ giống của cây họ ráy, cây khoai tây, cây khoai lang, cây khoai nua, v.v.; củ của cây hoa huệ tây ăn được, cây hoa tulip, v.v.; hoặc củ giống của cây kiệu, v.v., và ngoài ra bao gồm các hạt giống và tương tự đã được biến đổi gen, bao gồm hạt của cây đậu nành, cây ngô, cây bông, v.v., đã được truyền đặc tính chống lại thuốc diệt cỏ, hạt của cây lúa, cây thuốc lá, v.v., có thể thích nghi ở các vùng lạnh; hoặc hạt của cây ngô, cây bông, cây khoai tây, v.v. có đặc tính sản xuất chất trừ sâu, là các thực vật được tạo ra bằng cách xử lý gen nhân tạo và tương tự và ban đầu không tồn tại trong tự nhiên. Ở đây, sáng chế

không bị giới hạn bởi những điều này.

Khi sử dụng các hợp chất theo sáng chế, theo cách tương tự như đối với các chế phẩm hóa nông thông thường, các hợp chất này có thể được đưa vào các loại chế phẩm khác nhau (các hợp phần), bao gồm, dạng nhũ tương, dạng bụi, dạng bột thấm nước, dạng dung dịch, dạng hạt nhỏ, dạng huyền phù, kết hợp với các tá dược (bao gồm cả các chất mang). Về thực tế sử dụng các chế phẩm này, chúng có thể được sử dụng như nó vốn có, hoặc chúng có thể được pha loãng tới nồng độ đã định bằng chất pha loãng như nước.

Tá dược được sử dụng có thể là chất mang, chất nhũ hóa, tác nhân tạo huyền phù, tác nhân phân tán, tác nhân phân bố, tác nhân thấm, tác nhân làm ẩm, tác nhân làm đặc, chất ổn định và các chất tương tự, và có thể được bổ sung khi cần.

Chất mang được sử dụng có thể được phân loại thành chất mang rắn và chất mang lỏng. Chất mang rắn có thể là các bột từ động vật hoặc từ thực vật như tinh bột, đường, bột xenlulo, xyclodextrin, than hoạt tính, bột đậu nành, bột mỳ, trấu, bột gỗ và bột sữa; hoặc các bột khoáng như hoạt thạch, cao lanh, các bột khoáng như bột tan, kaolanh, bentonit, bentonit hữu cơ, canxi cacbonat, canxi sulfat, natri bicarbonat, zeolit, đất diatome, cacbon trắng, đất sét, alumin, silic oxit và bột lưu huỳnh. Chất mang lỏng có thể là nước; các dầu động vật và thực vật như dầu đậu nành, dầu bông và dầu ngô; các rượu như rượu etyl và etylen glycol; các xeton như axeton và metyl etyl xeton; các ete như dioxan và tetrahydrofuran; các hydrocacbon béo/thơm như dầu lửa, dầu hỏa, parafin lỏng, xylen, trimetylbenzen, tetra-metylbenzen, xyclohexan, naphta dung môi; các hydrocacbon halogen hóa như clorofom và clobenzen; các axit amit như dimetylformamit; các este như etyl axetat và các este glyxerin của các axit béo; các nitril như axetonitril; lưu huỳnh chứa các hợp chất như dimetylsulfoxit; hoặc N-metylpyrolidon.

Tỷ lệ theo trọng lượng đối với chế phẩm của hợp chất theo sáng chế và tá

được thường nằm trong khoảng từ 0,05 : 99,95 đến 90 : 10, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,2 : 99,8 đến 80 : 20.

Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng kết hợp với hoặc cùng với các chất hóa nông khác như thuốc diệt nấm và các tác nhân kháng vi rút nếu cần.

Các thuốc diệt nấm được sử dụng có thể là, ví dụ, các hợp chất pyrimidinamin như 2-anilino-4-metyl-6-(1-propynyl)pyrimidin (tên chung: mepaniprim) và 4,6-dimetyl-N-phenyl-2-pyrimidinamin (tên chung: pyrimetanil); các hợp chất azol như 1-(4-clophenoxy)-3,3-dimetyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butanon (tên chung: triadimefon), 1-(biphenyl-4-yloxy)-3,3-dimetyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (tên chung: bitertanol), 1-{N-(4-clo-2-triflometylphenyl)-2-propoxy-axetoimidoyl}imidazol (tên chung: triflumizol), 1-{2-(2,4-diclophenyl)-4-etyl-1,3-dioxolan-2-ylmetyl}-1H-1,2,4-triazol (tên chung: etaconazol), 1-{2-(2,4-diclophenyl)-4-propyl-1,3-dioxolan-2-ylmetyl}-1H-1,2,4-triazol (tên chung: propiconazol), 1-{2-(2,4-diclophenyl)pentyl}-1H-1,2,4-triazol (tên chung: penconazol), bis(4-flophenyl)(metyl)(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)silan (tên chung: flusilazol), 2-(4-clophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)-hexannitril (tên chung: myclobutanil), (2RS,3RS)-2-(4-clophenyl)-3-xyclo-propyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (tên chung: cyproconazol), (RS)-1-(4-clophenyl)-4,4-dimetyl-3-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)pentan-3-ol (tên chung: terbuconazol), (RS)-2-(2,4-diclophenyl)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)hexan-2-ol (tên chung: hexaconazol), (2RS,5RS)-5-(2,4-diclophenyl)tetrahydro-5-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)-2-niryl 2,2,2-trifloetylete (tên chung: furconazol-cis), N-propyl-N-{2-(2,4,6-triclophenoxy)etyl} imidazol-1-cacboxamit (tên chung: procloraz) và 2-(4-flophenyl)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-trimetylsilyl-propan-2-ol (tên chung: simeconazol); các hợp chất quinoxalin như 6-metyl-1,3-dithiolo[4,5-b]quinoxalin-2-on (tên chung: chinomethionat); các hợp chất dithiocacbammat như polyme của mangan etylenbis(dithiocacbammat) (tên chung: maneb), polyme của kẽm etylenbis(dithiocacbammat) (tên chung: zinep), sản phẩm kết hợp của kẽm (Zn) và mangan etylenbis(dithiocacbammat)(maneb) (tên chung: manzeb),

dizinc bis(dimetyldithiocacbamát)etylenbis(dithiocacbamát) (tên chung: polycacbamát) và polyme của kẽm propylenbis(dithiocacbamát) (tên chung: probineb); các hợp chất clo hữu cơ như 4,5,6,7-tetra-clophthalit (tên chung: fthalit), tetracloisophthalonitril (tên chung: clothalonil) và pentaclonitrobenzen (tên chung: quintozen); các hợp chất benzimidazol như metyl 1-(butylcacbamoyl)benzimidazol-2-yl cacbamát (tên chung: benomyl), dimetyl 4,4'-(o-phenylen)bis(3-thioalophanat) (tên chung: thiphanatmetyl) và metylbenzimidazol-2-yl cacbamát (tên chung: cacbendazim); các hợp chất pyridinamin như 3-clo-N-(3-clo-2,6-dinitro-4- α,α,α -triflotolyl)-5-triflometyl-2-pyridinamin (tên chung: fluazinam); các hợp chất xyanoaxetamit như 1-(2-xyano-2-metoxyminoaxetyl)-3-etyl ure (tên chung: xymoxanil); các hợp chất phenyl amit như metyl N-(2-metoxi-axetyl)-N-(2,6-xylyl)-DL-alaninat (tên chung: metalaxyl), 2-metoxi-N-(2-oxo-1,3-oxazolidin-3-yl)axeto-2',6'-xylidit (tên chung: oxadixyl), ($\pm$)- α -2-clo-N-(2,6-xylylaxetamit)- γ -butyrolacton (tên chung: ofurac), metyl N-phenylaxetyl-N-(2,6-xylyl)-DL-alaninat (tên chung: benalaxyl), metyl N-(2-furoyl)-N-(2,6-xylyl)-DL-alaninat (tên chung: furalaxyl) và ($\pm$)- α -[N-(3-clophenyl)xyclo-propancacboxamit]- γ -butyrolacton (tên chung: cyprofuram); các hợp chất axit sulfenic như N-dicloflometylthio-N',N'-dimetyl-N-phenyl sulfamit (tên chung: diclofluanid); các hợp chất đồng như đồng (II) hydroxit (tên chung: đồng (II) hydroxit) và đồng 8-quinolat (tên chung: oxit đồng); các hợp chất isoxazol như 5-metylisoxazol-3-ol (tên chung: hydroxyisoxazol); các hợp chất phospho hữu cơ như nhôm tris(etylphosphonat) (tên chung: nhôm fosetyl), O-2,6-diclo-p-tolyl-O,O-dimetylphospho-thioat (tên chung: tolclofos-metyl), S-benzyl O,O-diisopropylphosphorothioat, O-etyl S,S-diphenylphosphodithioat và nhôm etyl hydro phosphonat; các hợp chất N-halogenothioalkyl như N-(triclometylthio)xyclohexy-4-en-1,2-dicacboximit (tên chung: captan), N-(1,1,2,2-tetracloetylthio)xyclohexy-4-en-1,2-dicacboximit (tên chung: captafol) và N-(triclometylthio)phthal-imit (tên chung: folpet); các hợp chất dicacboximit như N-(3,-diclo-phenyl)-1,2-dimetylxyclopropan-1,2-dicacboximit (tên chung: procymidon), 3-(3,-diclophenyl)-N-isopropopyl-2,4-

dioxoimidazolidin-1-carboxamit (tên chung: iprodion) và (RS)-3-(3,5-diclophenyl)-5-metyl-5-vinyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion (tên chung: vinclozolin); các hợp chất benzanilit như α,α,α -triflo-3'-isopropoxy-o-toluanilit (tên chung: flutolanil) và 3'-isopropoxy-o-toluanilit (tên chung: mepronil); các hợp chất piperazin như N,N'-[piperazin-1,4-diylbis{(triclometyl)metylen}]diformamit (tên chung: triforin); các hợp chất pyridin như 2',4'-diclo-2-(3-pyridyl)axetophenon O-metyloxim (tên chung: pyrifenox); các hợp chất cacbinol như ($\pm$)-2,4'-diclo-a-(pyrimidin-5-yl)benzhydryl alcohol (tên chung: fenarimol) và ($\pm$)-2,4'-diflo- α -(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)benzhydryl alcohol (tên chung: flutriafol); các hợp chất piperidin như (RS)-1-{3-(4-t-butylphenyl)-2-metylpropyl}piperidin (tên chung: fenpropidin); các hợp chất morpholin như ($\pm$)-cis-4-{3-(4-t-butylphenyl)-2-metylpropyl}-2,6-dimetylmorpholin (tên chung: fenpropimorph); các hợp chất hữu cơ chứa thiếc như triphenyl thiếc hydroxit (tên chung: fentin hydroxit) và triphenyl thiếc axetat (tên chung: fentin axetat); các hợp chất ure như 1-(4-clo-benzyl)-1-xyclopentyl-3-phenylure (tên chung: penxycuron); các hợp chất axit xinamic như (E,Z)4-{3-(4-clophenyl)-3-(3,4-dimetoxyphenyl)acryloyl}morpholin (tên chung: dimethomorph); các hợp chất phenylcacbamat như isopropyl 3,4-dietoxycacbanilat (tên chung: dietofencarb); hoặc các hợp chất xyanopyrol như 3-xyano-4-(2,2-diflo-1,3-benzodioxol-4-yl)pyrol (tên chung: fludioxonil) và 3-(2',3'-diclophenyl)-4-xyano-pyrol (tên chung: fenciclonil); và tác nhân kháng vi rút được sử dụng có thể là tác nhân BT hoặc tác nhân vi rút gây bệnh ở côn trùng.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế sẽ được mô tả chi tiết bằng các ví dụ sau đây, nhưng sáng chế không bị giới hạn bởi các ví dụ này.

Ở đây, mỗi hợp chất trong số các hợp chất 1-32, 1-44, 1-56, 1-117, 1-185, 1-387, 1-425, 1-502, 1-865, 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-91, 2-100, 2-134, 2-135, 3-100, 3-109, 3-134 và 3-135 được sử dụng trong các ví dụ này là, theo thứ tự, được mô tả bằng các ví dụ 2, 18, 22, 52, 58, 68, 69, 72, 122, 114,

164, 165, 177, 178, 196, 193, 237, 203, 204, 209, 218 và 219 trong công bố quốc tế số WO 2005/070917.

Ví dụ 1

Thử nghiệm xử lý tại lúc gieo hạt hoặc lúc cấy chuyển (bệnh đạo ôn hại lúa)

Đất trong hộp ươm các thực vật thử nghiệm (lúa: *Sachikaze*) từng hộp được xử lý tại thời gian gieo hạt hoặc thời gian cấy chuyển bằng dung dịch các bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế được hòa tan trong nước để tỷ lệ phun là 400g thành phần hoạt tính/10a. Các thực vật thử nghiệm được trồng trong thời gian một tuần. Huyền phù của đạo ôn hại lúa được ghép vào bằng cách phun dịch huyền phù lên các thực vật thử nghiệm được trồng bằng cách sử dụng phương pháp nêu trên. Các chậu được đặt trong phòng ươm, nhiệt độ phòng ươm nằm trong khoảng từ 20 đến 23°C, và sự nhiễm bệnh được đẩy mạnh. Tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát vào thời gian 7 ngày sau khi ghép. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

Ở đây, tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật thử nghiệm được quan sát bằng mắt thường, được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây và được diễn tả (ở 4 mức từ 0 đến 3 trong đó tính nghiêm trọng của bệnh ở các thực vật không xử lý là 3).

Tính nghiêm trọng của bệnh:

0 (không có thương tổn của bệnh)

1 (thương tổn của bệnh nhỏ hơn 40% so với khu vực không xử lý)

2 (thương tổn của bệnh nằm trong khoảng từ bằng hoặc lớn hơn 40% đến nhỏ hơn 80%)

3 (thương tổn của bệnh bằng 80% hoặc lớn hơn)

Theo các kết quả của các thử nghiệm, tính nghiêm trọng của bệnh bằng 0, khi các hợp chất số 1-32, 1-44, 1-56, 1-117, 1-185, 1-387, 1-425, 1-502, 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-91, 3-100, 3-109, 3-134 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 2

Thử nghiệm phòng ngừa bệnh cho đất (bệnh héo *Fusarium* ở dưa chuột)

Các hạt giống của các thực vật thử nghiệm được trồng trong chậu (Sagamihanpaku) được gieo vào đất ươm mà đã được điều chỉnh để các bào tử bệnh héo *Fusarium* ở dưa chuột là 1×10^5 cho 1g đất trồng. Vào thời gian gieo hạt, dung dịch bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế hòa tan trong nước được tưới vào đất với tỷ lệ 10.000g/ha. Tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát vào thời gian 3 tuần sau khi xử lý. Các thử nghiệm được thực hiện 2 lần.

Ở đây, tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật thử nghiệm được quan sát bằng mắt thường, được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây, và được diễn tả (ở 4 mức từ 0 đến 3 trong đó tính nghiêm trọng của bệnh ở các thực vật không xử lý là 3).

Tính nghiêm trọng của bệnh:

0: không có triệu chứng của bệnh.

1: chuyển màu vàng.

2: héo úa.

3: chết.

Theo các kết quả của các thử nghiệm, tính nghiêm trọng của bệnh là 0 khi các hợp chất 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 3

Thử nghiệm khử trùng hạt giống (bệnh đạo ôn hại lúa, bệnh *Bakanae* ở lúa)

20g hạt giống được làm ẩm của các thực vật thử nghiệm (*Sachikaze* hoặc *Tanginbouzu*: các hạt giống được chủng bệnh đạo ôn hại lúa hoặc bệnh *Bakanae* ở lúa) được tẩm bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,02% thành phần hoạt tính, bổ sung 20ml nước cất và ủ trong thời gian 1 ngày ở nhiệt độ 25°C. Các thực vật thử nghiệm đã xử lý bằng phương pháp trên được

trồng trong các chậu trong thời gian 3 tuần, và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần. Hiệu quả phòng ngừa bệnh được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây.

Đối với các hạt giống nhiễm bệnh đạo ôn hại lúa, số lượng các thương tổn đối với tỷ lệ nảy mầm được quan sát, và tỷ lệ nhiễm bệnh được tính toán. Giá trị phòng ngừa được tính toán bằng cách lấy tỷ lệ phòng ngừa của các thực vật không xử lý là 100.

Theo các kết quả của thử nghiệm, giá trị phòng ngừa là 80 hoặc lớn hơn, khi các hợp chất số 1-32, 1-866, 1-929, 1-930, 2-100, 2-134, 2-135, 3-100, 3-134 hoặc 3-135 được sử dụng.

Đối với các hạt giống nhiễm bệnh "*Bakanae*" ở lúa, số lượng các cây con nhiễm bệnh và tỷ lệ nảy mầm được quan sát, và tỷ lệ nhiễm bệnh được tính toán. Giá trị phòng ngừa được tính toán bằng cách lấy tỷ lệ nhiễm bệnh của các thực vật không xử lý là 100.

Theo các kết quả của thử nghiệm, giá trị phòng ngừa là 80 hoặc lớn hơn, khi các hợp chất số 1-32, 1-865, 1-866, 1-929, 1-930, 2-100, 2-139, 3-100, 3-134 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 4

Thử nghiệm xử lý hạt giống (bệnh lụi cây con *Fusarium* ở lúa mỳ)

20g hạt giống được làm ẩm (các hạt giống được chủng bệnh lụi cây con *Fusarium* ở lúa mỳ) của các thực vật thử nghiệm (Nourin 61 gou) được tắm bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,1% thành phần hoạt tính. Các hạt (30 hạt) đã xử lý theo phương pháp nêu trên được gieo, và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát trong thời gian sau 2 tuần. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

Ở đây, tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật thử nghiệm được

quan sát bằng mắt thường và được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây, và được diễn tả (ở 4 mức từ 0 đến 3 trong đó tính nghiêm trọng của bệnh của các cây không xử lý là 3).

Tính nghiêm trọng của bệnh:

0: không có triệu chứng của bệnh.

1: chuyển màu vàng.

2: héo.

3: lụi.

Theo các kết quả của các thử nghiệm, tính nghiêm trọng của bệnh bằng 0, khi các hợp chất số 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 5

Thử nghiệm xử lý hạt giống (bệnh lụi *Fusarium* ở dưa chuột)

10g hạt giống được làm ẩm (các hạt giống được chủng bệnh héo *Fusarium* ở dưa chuột) của các thực vật thử nghiệm (*Sagamihanpaku*) được tẩm các bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,1% thành phần hoạt tính. Các hạt giống (10 hạt) đã xử lý bằng phương pháp nêu trên được gieo và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát sau thời gian 3 tuần. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

Ở đây, tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật thử nghiệm được quan sát bằng mắt thường và được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây, và được diễn tả (ở 4 mức từ 0 đến 3 trong đó tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật không xử lý là 3).

Tính nghiêm trọng của bệnh:

0: không có triệu chứng của bệnh.

1: chuyển màu vàng.

2: héo.

3: chết.

Theo các kết quả của các thử nghiệm, tính nghiêm trọng của bệnh bằng 0, khi các hợp chất số 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 6

Thử nghiệm xử lý hạt giống (bệnh lụi *Fusarium* ở dưa chuột)

10g hạt giống được làm ẩm của các thực vật thử nghiệm (giống dưa chuột: *Sagamihanpaku*) được tẩm các bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,1% thành phần hoạt tính. Các hạt giống (10 hạt) đã xử lý bằng phương pháp nêu trên được gieo trong đất đã chủng bệnh lụi *Fusarium* ở dưa chuột (1×10^5 bào tử) và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát sau thời gian 3 tuần. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

Ở đây, tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật thử nghiệm được quan sát bằng mắt thường và được đánh giá phù hợp với các tiêu chuẩn sau đây, và được diễn tả (ở 4 mức từ 0 đến 3 trong đó tính nghiêm trọng của bệnh của các thực vật không xử lý là 3).

Tính nghiêm trọng của bệnh:

0: không có triệu chứng của bệnh.

1: chuyển màu vàng.

2: héo.

3: chết.

Theo các kết quả thử nghiệm, tính nghiêm trọng của bệnh bằng 0, khi các hợp chất số 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 hoặc 3-135 được sử dụng.

Ví dụ 7

Thử nghiệm xử lý hạt giống (bệnh chết rạp cây con ở dưa chuột)

10g hạt giống được làm ẩm của các thực vật thử nghiệm (*Sagamihanpaku*) được tẩm các bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,1% thành phần hoạt tính. Các hạt giống (10 hạt) đã xử lý bằng phương pháp nêu trên được gieo trong đất đã chủng nấm gây bệnh chết rạp cây con ở dưa chuột (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium megalocanthum*) và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát sau thời gian 2 tuần. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

Ví dụ 8

Thử nghiệm xử lý hạt giống 2 (bệnh chết rạp cây con ở dưa chuột)

10g hạt giống được làm ẩm của các thực vật thử nghiệm (*Sagamihanpaku*) được tẩm các bột thấm nước chứa hợp chất theo sáng chế để tỷ lệ phun là 0,1% thành phần hoạt tính. Các hạt giống (10 hạt) đã xử lý bằng phương pháp nêu trên được gieo trong đất đã chủng nấm gây bệnh chết rạp cây con ở dưa chuột (*Rhizoctonia solani*) và tính nghiêm trọng của bệnh được quan sát sau thời gian 2 tuần. Các thử nghiệm được thực hiện hai lần.

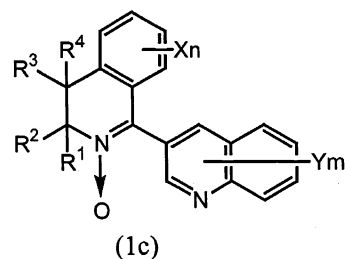
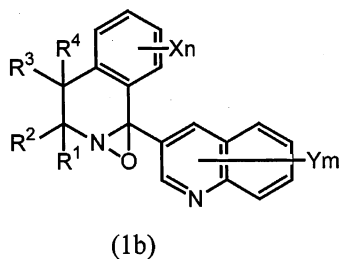
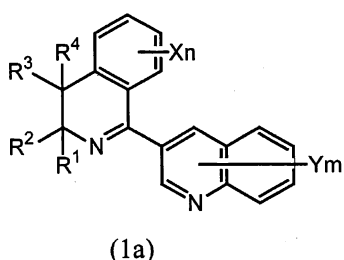
Khả năng áp dụng công nghiệp

Các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng làm tác nhân xử lý đất, và tốt hơn là xử lý đất, vì chúng biểu hiện các hiệu quả nổi bật chống lại các bệnh thực vật khác nhau, đặc biệt là chống lại bệnh đạo ôn hại lúa mà không gây hư hại cho các cây chủ.

Các bệnh thực vật được chống lại mà các hợp chất theo sáng chế biểu lộ hiệu quả xuất sắc là, ví dụ, bệnh đạo ôn hại lúa, bệnh *Bakanae* ở lúa, bệnh lụi *Fusarium* và bệnh lụi cây con ở lúa mỳ, bệnh lụi cây con *Rhizoctonia* và bệnh chết rạp cây con *Pythium* ở dưa chuột, bệnh héo *Fusarium* ở dưa chuột, bệnh chết rạp cây con hoặc bệnh héo *Fusarium* ở cà chua, nhưng phổ nấm của các hợp chất theo sáng chế không bị giới hạn ở những bệnh này.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Tác nhân xử lý đất bao gồm một hoặc nhiều hợp chất có các công thức chung (Ia), (Ib) hoặc (Ic):



trong đó:

R^1 và R^2 có thể là giống nhau hoặc khác nhau, là

nhóm C_1 - C_6 alkyl có thể được thế bằng từ 1 đến 3 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau;

hoặc nhóm phenyl có thể được thế bằng từ 1 đến 5 nguyên tử halogen giống hoặc khác nhau,

R^3 và R^4 có thể là giống nhau hoặc khác nhau, là nguyên tử hydro, nhóm methyl, nhóm ethyl, nguyên tử flo hoặc nguyên tử clo,

X có thể là giống nhau hoặc khác nhau, là nguyên tử halogen;

nhóm C_1 - C_4 alkyl;

hoặc nhóm xyano, và

n là số nguyên từ 0 đến 2, và

Y có thể là giống nhau hoặc khác nhau, là nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm methyl, và

m là số nguyên 0 hoặc 1,

hoặc các muối của chúng là chế phẩm phòng ngừa các bệnh cho thực vật được đặc trưng trong việc xử lý đất,

trong đó tác nhân xử lý đất được sử dụng để bảo vệ thực vật khỏi các mầm bệnh lây nhiễm trong đất và lây nhiễm trong không khí bằng cách phun tác nhân xử lý đất lên bề mặt đất canh tác, đưa tác nhân xử lý đất vào đất canh tác, thấm ướt tác nhân xử lý đất vào đất canh tác hoặc trộn tác nhân xử lý đất vào đất canh tác.

2. Tác nhân xử lý đất theo điểm 1, trong đó liên quan đến các hợp chất có các công thức chung (Ia), (Ib) hoặc (Ic),

R^1 và R^2 là nhóm methyl, nhóm ethyl, nhóm propyl, nhóm triflometyl, nhóm trifloethyl, nhóm phenyl, nhóm flophenyl hoặc nhóm clophenyl,

R^3 và R^4 là nguyên tử hydro, nhóm methyl hoặc nguyên tử flo,

X là nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, nhóm methyl, hoặc nhóm xyano, và n là số nguyên từ 0 đến 2, và

Y là nhóm methyl hoặc nguyên tử flo, và m là 0 hoặc 1.

3. Tác nhân xử lý đất theo điểm 1, trong đó hợp chất có các công thức chung (Ia), (Ib) hoặc (Ic) được chọn từ nhóm bao gồm:

- 3-(5-flo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5-clo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5-brom-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5,6-diflo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5-flo-3-methyl-3-propyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(3-methyl-3-triflometyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-[3-methyl-3-(2,2,2-trifloethyl)-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl]quinolin,
- 3-[3-methyl-3-(4-flophenyl)-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl]quinolin,
- 3-(3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 8-flo-3-(5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)-8-methylquinolin,
- 3-(4,4-diflo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,
- 3,3,4,4-tetramethyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,
- 5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,
- 4,4-diflo-3,3-dimethyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,
- 4,4,5-triflo-3,3-dimethyl-8b-quinolin-3-yl-4,8b-dihydro-3H-oxazireno[3,2-a]isoquinolin,
- 3-(5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-

yl)quinolin,

3-(6-flo-3,3,4,4-tetrametyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-

yl)quinolin,

3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin,

và

3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-2-oxido-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

4. Phương pháp phòng ngừa các bệnh cho thực vật bao gồm việc sử dụng tác nhân xử lý đất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3.