



مدينة الملك عبدالعزيز
للعلوم والتقنية KACST

[11] رقم البراءة: ٢٥٢١
[45] تاريخ المنح: ١٤٣١/١١/٢٥ هـ
الموافق: ٢٠١٠/١١/٠٢ م

[19] المملكة العربية السعودية SA
مدينة الملك عبدالعزيز للعلوم والتقنية

[12] براءة اختراع

[72]	اسم المخترع: مايكل موهليباش، كريستوفر جون ماثيوز، جيمس نيقولاس سكوت، مانجالا جوفينكار
[73]	مالك البراءة : (١) سينجيتا بارتسبشنز ايه جي عنوانه: ٢١٥ سوارتز والدالي، بازل سي اتش - ٤٠٥٨، سويسرا (٢) سينجيتا ليمنتد عنوانه: يورويان ريجيونال سنتر، بريستلي رود، سوري ريسيرش بارك، جولدفورد سوري جي يو ٢ واي اتش، المملكة المتحدة جنسيته: سويسرية
[74]	الوكيل: سليمان ابراهيم العمار
[21]	رقم الطلب: ٠٧٢٨٠٦٩١
[22]	تاريخ الإيداع : ١٤٢٨/١٢/٠٢ هـ الموافق: ٢٠٠٧/١٢/١٢ م

[30]	بيانات الأسبقية:	
GB	٠٦٢٤٩٦١	٢٠٠٦/١٢/١٤ م
GB	٠٧٠٥٠٤٤	٢٠٠٧/٠٣/١٥ م
[51]	التصنيف الدولي (IPC ⁸) : C07D 309/10	
[56]	المراجع:	
WO	٠٣٠٤٨١٣٨	٢٠٠٣/٠٦/١٢ م
EP	١٤٨١٩٧٠	٢٠٠٤/١٢/٠١ م
US	٢٠٠٥١٦٤٨٨٣	٢٠٠٥/٠٧/٢٨ م

اسم الفاحص: عبدالله بن سعد عبدالجبار

[54] اسم الاختراع: مركبات جديدة من ٤ - باي فينيل -

بيران - ٥،٣ - دايون وإستخدامها كمبيدات أعشاب
Novel 4-biphenyl-pyran-3,5-diones and
their use as herbicides

[57] الملخص: يتعلق الاختراع الحالي بمركبات

pyrandione ، thiopyrandione و

cyclohexanetrione المناسبة لاستخدامها

كمبيدات للأعشاب.

عدد عناصر الحماية (٢٩)

مركبات جديدة من ٤- باي فينيل - بيران - ٣،٥- دايون وإستخدامها كمبيدات أعشاب

Novel 4-biphenyl-pyran-3,5-diones and their use as herbicides

الوصف الكامل

خلفية الاختراع

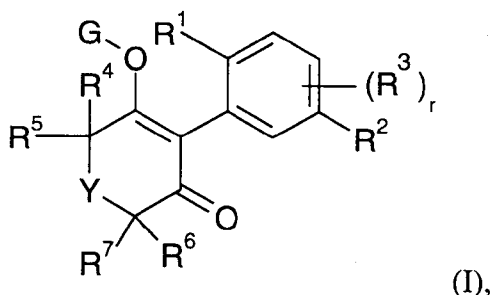
يتعلق الاختراع الحالي بمركبات دايون حلقية cyclic dione جديدة فعالة في إبادة الأعشاب ومشتقات من تلك المركبات، ويتعلق بعمليات لتحضير تلك المركبات والتركيبات التي تشتمل على تلك المركبات واستخدامها في مكافحة الأعشاب وبشكل أخص في محاصيل النباتات المفيدة أو في تثبيط نمو النبات.

وقد تم وصف مركبات دايون الحلقية cyclic dione التي لها فعالية في إبادة الأعشاب في، على سبيل المثال، الطلب الدولي رقم ٠١/٧٤٧٧٠.

وقد تم الآن اكتشاف مركبات pyrandione ، thiopyrandione و cyclohexanetrione التي لها خصائص إبادة الأعشاب وتثبيط النمو.

الوصف العام للاختراع

يتعلق الاختراع الحالي وفقاً لذلك بمركبات لها الصيغة I



حيث

R¹ عبارة عن halogen ، alkyl C₁-C₄ haloalkyl C₁-C₄ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو C₂-C₄ alkenyl أو haloalkenyl C₂-C₄ أو alkynyl C₂-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو C₁-C₄ haloalkoxy أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو nitro أو cyano ؛

٥ R² عبارة عن aryl بها استبدال اختياري أو aryl غير متجانس بها استبدال اختياري ؛

r عبارة عن صفر أو ١ أو ٢ أو ٣ ؛

R³، عندما تكون قيمة r هي ١، تكون عبارة عن halogen أو alkyl C₁-C₆ أو haloalkyl C₁-C₆ أو alkoxy C₁-C₆ أو haloalkoxy C₁-C₆ أو alkenyl C₂-C₆ أو alkynyl C₂-C₆ أو C₁-C₆ alkylthio أو alkylsulfinyl C₁-C₆ أو alkylsulfonyl C₁-C₆ أو cyano أو nitro ؛ أو تكون مجموعات الاستبدال R³، إذا كانت r عبارة عن ٢ أو ٣، كل منهما على حدة عبارة عن halogen ١٠ أو alkyl C₁-C₆ أو haloalkyl C₁-C₆ أو alkoxy C₁-C₆ أو haloalkoxy C₁-C₆ أو C₂-C₆ alkenyl أو alkynyl C₂-C₆ أو alkylthio C₁-C₆ أو alkylsulfinyl C₁-C₆ أو alkylsulfonyl C₁-C₆ أو cyano أو nitro ؛

تكون R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷، كل منها على حدة، عبارة عن hydrogen أو alkyl C₁-C₄ أو C₁- ١٥ haloalkyl C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو alkylthio C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو cyclopropyl أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو cyclopropyl أو cyclobutyl بها استبدال بواسطة C₁- أو alkyl C₂ أو C₁- أو haloalkyl C₂ أو halogen أو cyclobutyl بها استبدال بواسطة C₁- أو alkyl C₂ ؛ oxetanyl أو oxetanyl بها استبدال بواسطة C₁- أو alkyl C₂ ؛ cycloalkyl C₆-C₇ أو cycloalkyl C₅-C₇ بها استبدال ٢٠ بواسطة C₁- أو alkyl C₂ أو C₁- أو haloalkyl C₂ ، حيث methylene تكون عبارة عن

- مجموعة موجودة في جزء cycloalkyl والتي تم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ cycloalkenyl C₄-C₇ أو C₄-C₇ حيث cycloalkenyl به استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو haloalkyl C₂ ، حيث methylene عبارة عن مجموعة من جزء cycloalkenyl والتي تم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ alkyl C₁-C₅ cyclopropyl أو haloalkyl C₂ أو alkyl C₁-C₅ cyclopropyl بها استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو haloalkyl C₂ أو halogen ؛ alkyl C₁-C₅ cyclobutyl أو alkyl C₁-C₅ cyclobutyl بها استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ ؛ alkyl oxetanyl C₁-C₅ أو alkyl oxetanyl C₁-C₅ بها استبدال بواسطة -C₁ أو C₂ ؛ alkyl C₁-C₅ cycloalkyl C₅-C₇ أو alkyl C₁-C₅ cycloalkyl C₁-C₇ بها استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو haloalkyl C₂ ، حيث أن مجموعة methylene من جزء cycloalkyl يتم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ alkyl C₁-C₅ cycloalkenyl C₄-C₇ أو C₁-C₅ cycloalkenyl C₄-C₇ حيث يكون بها استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو haloalkyl C₂ ، حيث أن مجموعة methylene هي من جزء cycloalkenyl التي يتم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ phenyl أو phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₄ alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو halogen أو nitro أو cyano أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو alkylcarbonyl ؛ benzyl أو benzyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو halogen أو nitro أو cyano أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو alkylcarbonyl C₁-C₄ ؛ aryl غير متجانس أو

aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو C₁-alkylthio أو cyano أو nitro أو halogen أو C₁-alkylsulfinyl أو C₁-C₄alkylsulfonyl أو C₄alkylcarbonyl ؛ أو

R⁴ و R⁵، أو R⁶ و R⁷، تم ربطهما معاً لتكوين حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى ٧ ذرات والتي تم فيها استبدال مجموعة methylene بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى ٧ ذرات وبها استبدال بواسطة C₁- أو C₂-alkyl حيث أن مجموعة methylene من الحلقة يتم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur ؛ أو

R⁴ و R⁷ تم ربطهما لتشكيل حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى ٧ ذرات ليس بها استبدال أو بها استبدال بواسطة C₁- أو C₂-alkyl ، C₁- أو C₂-alkoxy ، C₁-C₂alkoxy ، C₁-alkyl ، hydroxy ، halogen ، phenyl أو phenyl بها استبدال بواسطة C₁-C₄alkyl ، C₁-C₄alkylthio ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ، C₄alkoxy ، C₁-C₄alkylthio ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ، C₁-C₄alkylsulfonyl ، C₁-C₄alkylcarbonyl ؛ اрил غير متجانس أو اрил غير متجانس بها استبدال بواسطة C₁-C₄alkyl ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ، C₁-C₄alkylsulfonyl ، C₁-C₄alkylthio ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ؛ alkylcarbonyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ ؛ اрил غير متجانس أو اрил غير متجانس بها استبدال بواسطة C₁-C₄alkyl ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ، C₁-C₄alkylsulfonyl ، C₁-C₄alkylthio ، C₁-C₄alkoxy ، C₁-C₄haloalkyl ؛ alkylcarbonyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ ؛

Y عبارة عن O أو C=O أو S(O)_m أو S(O)_nNR⁸؛ بشرط أنه عندما تكون Y هي C=O، تكون R⁶ و R⁷ مختلفتين عن hydrogen عندما تكون واحدة من R⁴ أو R⁵ عبارة عن hydrogen ، و R⁴ و R⁵ تكونان مختلفتين عن hydrogen عندما تكون واحدة من R⁶ أو R⁷ عبارة عن hydrogen ؛

٢٠ m عبارة عن صفر أو ١ أو ٢ و n عبارة عن صفر أو ١ ؛

R⁸ عبارة عن hydrogen أو alkyl C₁-C₆ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو alkoxy carbonyl C₁-C₆ أو tri(C₁-C₆alkyl)silyl-ethyloxy carbonyl أو cyano أو haloalkoxy carbonyl C₁-C₆ أو haloalkyl C₁-C₆ أو alkyl hydroxy C₁-C₆ أو alkyl C₂-C₆ أو alkynyl C₂-C₈ أو haloalkenyl C₂-C₆ أو alkyl carbonyl C₁-C₆ أو haloalkyl-carbonyl C₁-C₆ أو phenyl carbonyl أو cycloalkyl carbonyl أو phenyl carbonyl بها استبدال بواسطة R⁹؛ benzyl carbonyl أو benzyl carbonyl بها استبدال بواسطة R⁹؛ pyridyl carbonyl أو pyridyl carbonyl بها استبدال بواسطة R⁹؛ phenoxycarbonyl أو phenoxycarbonyl بها استبدال بواسطة R⁹؛ phenoxycarbonyl أو phenoxycarbonyl بها استبدال بواسطة R⁹؛

R⁹ عبارة عن haloalkyl C₁-C₆ أو alkoxy carbonyl C₁-C₆ أو nitro أو cyano أو formyl أو carboxyl أو halogen ، و G عبارة عن hydrogen ، أو cation مقبول زراعياً أو مجموعة مؤخره للمفعول.

في تعريفات مجموعات الاستبدال الخاصة بمركبات الصيغة I تكون مجموعات استبدال alkyl وأجزاء alkyl من مجموعة alkoxy أو alkylthio إلخ، لها من ١-٦ ذرات كربون وبفضل أن تكون methyl ، ethyl ، propyl ، butyl ، pentyl و hexyl ، في صورة أيزومراتها المستقيمة أو المتفرعة. يفضل أن تشتمل مجموعات alkyl الكبرى والتي بها حتى ١٠ ذرات كربون على decyl و nonyl في صورة أيزومراتها المتفرعة أو المستقيمة. يمكن أن يكون alkynyl و شقوق alkynyl المشتملة على من ٢ إلى ٦ ذرات كربون وحتى ١٠ ذرات كربون مستقيماً أو متفرعاً ويمكن أن يكون مشتملاً على أكثر من رابطة ثنائية أو ثلاثية . تشتمل الأمثلة على vinyl, allyl, propargyl, butenyl, butynyl, pentenyl and pentynyl. تشتمل مجموعات

cycloalkyl المناسبة على من ٣ إلى ٧ ذرات كربون وهي على سبيل المثال cyclopropyl ،

، cyclopropyl ، cyclobutyl ، cyclopentyl ، cyclohexyl و cycloheptyl . ويفضل منها cyclopropyl ، fluorine و cyclobutyl ، cyclopentyl و cyclohexyl . ومركبات halogen المفضلة هي عبارة عن chlorine و bromine . تكون الأمثلة المفضلة من aryl عبارة عن phenyl و naphthyl . تكون الأمثلة المفضلة من aryl غير المتجانس عبارة عن :

thienyl, furyl, pyrrolyl, isoxazolyl, oxazolyl, isothiazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, ٥
imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, oxadiazolyl,
thiadiazolyl and pyridazinyl,

وعندما يكون من الملائم، N-oxides و الأملاح منها. يمكن أن يكون بمركبات aryl هذه و
ومركبات aryl غير متجانس استبدال بواسطة واحدة أو أكثر من مجموعات الاستبدال، حيث تكون
١٠ مجموعات الاستبدال المفضلة عبارة عن halogen ، alkyl C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو
alkenyl C₁-C₄ أو haloalkenyl C₂-C₄ أو alkynyl C₁-C₂ أو alkoxy C₁-C₄ أو C₁-C₄
haloalkoxy أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو
haloalkylthio C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو sulfinyl haloalkyl C₁-C₄ أو sulfonyl
أو nitro أو cyano . المجموعة G تعبر عن hydrogen أو cation مقبول زراعياً (مثل cation
١٥ فلز قلوي alkali metal أو cation فلز قلوي alkali metal أرضي أو sulfonium cation) بشكل
مفضل :

tri(C₁-C₆)alkylsulfonium cation, ammonium cation, C₁-C₆alkylammonium cation, di(C₁-
C₆alkyl)ammonium cation, tri(C₁-C₆alkyl)ammonium cation or tetra(C₁-
C₆alkylammonium cation),

أو مجموعة مؤخرة للمفعول. يتم اختيار تلك المجموعات المؤخرة للمفعول G حتى يسهل إزالتها عن طريق واحدة أو توليفة من العمليات الكيميائية الحيوية أو العمليات الكيميائية أو العمليات الطبيعية لتعطي مركبات الصيغة I، حيث تكون G عبارة عن H من قبل، وذلك أثناء أو بعد وضعها على الكان أو النبات الذي تتم معالجته. تشتمل أمثلة هذه العمليات على الانشطار الإنزيمي والتحليل المائي الكيميائي و التحليل الضوئي. يمكن أن تعرض المركبات التي تحمل هذه الصيغة المؤخرة

٥

للمفعول مزايا معينة مثل الاختراق المتطور لجليدة النباتات التي تمت معالجتها، والتحمل المتزايد للمحاصيل والمواجمة المحسنة لها أو الاستقرار في خلائط الصياغة المشتملة على مبيدات أعشاب أخرى أو وسائل تقليل السمية الخاصة بمبيدات الأعشاب أو وسائل تنظيم نمو الأعشاب أو وسائل قتل الفطريات أو الحشرات أو تقليل التسرب في التربة. يفضل أن يتم اختيار مجموعة G من

المجموعات G والتي تكون عبارة عن alkyl C₁-C₈ أو haloalkyl C₂-C₈ أو phenyl C₁-C₅ alkyl

١٠

(حيث أن phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃

haloalkyl أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو C₁-C₃

alkylsulfinyl أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro)، يمكن أن

يكون هناك استبدال اختياري في مجموعة aryl غير متجانس alkyl C₁-C₈ (حيث أن مجموعة aryl

غير المتجانس يكون بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃

١٥

alkoxy أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو C₁-C₃

alkylsulfonyl أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro) أو alkenyl C₃-C₈ أو C₃-C₈

haloalkenyl أو alkynyl C₃-C₈ أو C(X^a)-R^a أو C(X^b)-XC-R^b أو C(X^d)-N(R^c)-R^d أو -SO₂-

R^e أو -P(X^e)(R^f)-R^g أو CH₂-X^f-R^h أو حيث X^a أو X^b أو X^c أو X^d أو X^e و X^f كل منهما

٢٠ على حدة إما oxygen أو كبريت sulfur ؛

- تكون R^a عبارة عن H أو alkyl C_1-C_{18} أو alkenyl C_2-C_{18} أو alkynyl C_2-C_{18} أو C_1-C_{10}
- haloalkyl أو alkyl cyano C_1-C_{10} أو alkyl nitro C_1-C_{10} أو aminoalkyl C_1-C_{10} أو
- alkylamino C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 (alkyl C_2-C_8) amino أو alkyl C_1-C_5 أو C_3-C_7
- cycloalkyl أو alkyl C_1-C_5 alkoxy C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 alkenyloxy C_3-C_5 أو C_1-C_5
- أو alkyl C_1-C_5 alkenyloxy C_3-C_5 أو alkyl C_1-C_5 alkylthio C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 أو C_1-C_5 ٥
- alkylsulfonfyl أو alkyl C_1-C_5 alkylsulfonfyl أو alkyl C_1-C_5 alkylideneaminoxy C_1-C_8 أو
- أو alkyl C_1-C_5 alkylcarbonyl C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 alkoxy carbonyl C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5
- أو alkyl C_1-C_5 aminocarbonyl أو alkyl C_1-C_5 alkylaminocarbonyl C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 أو $di(C_2-$
- أو alkyl C_1-C_5 aminocarbonyl C_1-C_5 أو alkyl C_1-C_5 amino alkylcarbonyl C_1-C_5 أو
- أو alkyl C_1-C_5 -N- alkylcarbonyl C_1-C_5 -N- أو alkyl C_1-C_5 alkylamino C_1-C_5 أو ١٠
- phenyl C_1-C_5 أو tri(C_3-C_6 alkyl)silyl C_1-C_5 alkyl, phenyl C_1-C_5 alkyl (حيث أن
- مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C_1-C_3 أو haloalkyl C_1-C_3
- أو alkoxy C_1-C_3 أو haloalkoxy C_1-C_3 أو alkylthio C_1-C_3 أو alkylsulfonfyl C_1-C_3 أو
- أو alkylsulfonfyl C_1-C_3 أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro) أو aryl غير متجانس C_1-C_5
- أو مجموعة aryl غير المتجانس يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة C_1-C_8 alkyl ١٥
- أو haloalkyl C_1-C_3 أو alkoxy C_1-C_3 أو haloalkoxy C_1-C_3 أو alkylthio C_1-C_3 أو
- أو alkylsulfonfyl C_1-C_5 أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro) أو
- أو haloalkenyl C_2-C_5 أو cycloalkyl C_3-C_a أو phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال
- بواسطة alkyl C_1-C_3 أو haloalkyl C_1-C_5 أو alkoxy C_1-C_3 أو haloalkoxy C_1-C_3 أو
- أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال ٢٠

بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro ،

تكون R^b عبارة عن alkyl C₁-C₁₈ أو alkenyl C₃-C₁₈ أو alkynyl C₃-C₁₈ أو haloalkyl C₂-C₁₀

أو alkyl cyano C₁-C₁₀ أو alkyl nitro C₁-C₁₀ أو aminoalkyl C₂-C₁₀ أو alkylamino C₁-C₅

أو alkyl C₁-C₈ أو di (alkyl C₂-C₈) amino أو alkyl C₁-C₅ أو cycloalkyl C₃-C₇ أو alkyl C₁-C₅ ٥

أو alkyl C₁-C₅ alkoxy C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅

أو alkyl C₅ alkylthio C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₈ أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfinyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅

أو alkyl C₁-C₅ alkylideneaminoxy C₂-C₈ أو alkyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfonyl C₅

أو alkyl C₁-C₈ alkylcarbonyl أو alkyl C₁-C₅ alkoxy carbonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ aminocarbonyl

أو alkyl C₁-C₅ alkylaminocarbonyl C₁-C₅ أو di (alkyl C₂-C₈) ١٠

أو alkyl C₁-C₅ aminocarbonyl أو alkyl C₁-C₅ amino alkylcarbonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₈ amino -N- C₁-

C₅ alkylcarbonyl -N- أو alkyl C₁-C₅ alkylamino C₁-C₅ أو tri (alkyl C₃-C₆) سيليل C₁-C₅

أو alkyl C₁-C₅ phenyl (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري

بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃

أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو ١٥

بواسطة nitro) أو aryl غير متجانس alkyl C₁-C₅ أو (حيث أن مجموعة aryl غير المتجانس يمكن

أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو

أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃

أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro) أو haloalkenyl C₃-C₅ أو cycloalkyl C₃-C₈ أو

phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو C₁- ٢٠

alkoxy C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃ alkoxy أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro ،

تكون R^C و R^d كل منهما على حدة hydrogen أو alkyl C₁-C₁₀ أو alkenyl C₃-C₁₀ أو C₃-C₁₀

٥ alkynyl أو haloalkyl C₂-C₁₀ أو alkyl cyano C₁-C₁₀ أو alkyl nitro C₁-C₁₀ أو C₁-C₁₀

aminoalkyl أو alkylamino C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ (alkyl C₂-C₈) di أو alkyl C₁-C₅ amino

أو cycloalkyl C₃-C₇ أو alkyl C₁-C₅ alkoxy C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو C₁-

alkyl C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylthio C₁-C₅ أو C₁-C₅

alkylsulfinyl أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylideneaminoxy C₂-C₅

١٠ alkyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylcarbonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkoxycarbonyl C₁-C₅

أو aminocarbonyl أو alkyl C₁-C₅ alkylaminocarbonyl C₁-C₅ أو di (C₂-)

أو alkyl C₁-C₅ aminocarbonyl (alkyl C₈ أو alkyl C₁-C₅ amino alkylcarbonyl C₁-C₅ أو

alkyl C₂-C₅ - N- alkylcarbonyl C₁-C₅-N أو aminoalkyl alkyl C₂-C₅ - N- tri(C₃-C₆alkyl)silylC₁-C₅alkyl

أو phenyl C₁-C₅ phenyl (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة

١٥ alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₅

alkylthio أو alkylsulfinyl C₁-C₅ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو بواسطة

(nitro أو aryl غير متجانس alkyl C₁-C₅ (حيث يمكن أن تكون مجموعة aryl غير متجانس بها

استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-

C₃haloalkoxy أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₅ أو halogen

٢٠ أو cyano أو بواسطة nitro (أو haloalkenyl C₂-C₅ أو cycloalkyl C₃-C₅ أو phenyl أو مجموعة

phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₅ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl amino غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₅ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl amino غير متجانس أو مجموعة di aryl amino غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl amino غير متجانس أو مجموعة amino phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl amino غير متجانس أو مجموعة di amino phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkoxy أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl amino غير متجانس أو مجموعة amino (alkyl C₁-C₃) أو cycloalkoxy C₃-C₇ أو R^c و R^d يمكن ربطهما معا ليتم تكوين حلقة لها من ٣ إلى ٧ ذرات أو تشتمل بشكل اختياري على ذرة واحدة غير متجانسة تم اختيارها من O أو S أو يتم بها استبدال اختياري بواسطة ١ أو ٢ من مجموعات C₁-C₃alkyl .

تكون R^c عبارة عن alkyl C₁-C₁₀ أو alkenyl C₂-C₁₀ أو alkynyl C₂-C₁₀ أو C₁-C₁₀haloalkyl أو alkyl cyano C₁-C₁₀ أو alkyl nitro C₁-C₁₀ أو aminoalkyl C₁-C₁₀ أو alkylamino C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ amino (alkyl C₂-C₅) di أو alkyl C₁-C₅ أو cycloalkyl C₃-C₇ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₈ أو alkyl C₁-C₅ cycloalkyl

- alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylthio C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو C₁-C₅
- alkyl C₁-C₅ alkylsulfinyl أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfonyl أو alkyl C₁-C₅ أو C₂-C₈
- alkyl C₁-C₅ alkylideneaminoxy أو alkyl C₁-C₅ alkylcarbonyl أو alkyl C₁-C₅ أو C₁-C₅
- alkoxycarbonyl أو alkyl C₁-C₅ aminocarbonyl أو C₁-C₅alkyl aminocarbonyl أو alkylaminocarbonyl C₁-C₅
- أو alkyl C₁-C₅ aminocarbonyl (alkyl C₂-C₈) di أو alkyl C₁-C₅ أو alkylcarbonyl C₁-C₅ ٥
- أو alkyl C₁-C₅ amino أو alkyl C₁-C₅ -N- alkylcarbonyl C₁-C₅ -N- alkylamino C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅
- phenylC₁-C₅alkyl, tri(C₃-C₆alkyl)silylC₁-C₅alkyl (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون
- بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃
- أو haloalkoxy أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو
- halogen أو cyano أو nitro) أو aryl C₁-C₅ غير متجانس (حيث أن مجموعة aryl غير ١٠
- المتجانس يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃) أو haloalkyl C₁-C₃ أو
- alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو C₁-C₃
- alkylsulfonyl أو halogen أو cyano أو بواسطة nitro) أو C₁-C₅ haloalkenyl أو C₃-C₈
- cycloalkyl أو phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃
- haloalkyl أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو ١٥
- aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃
- haloalkyl أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو amino أو
- بواسطة nitro أو aryl amino غير متجانس أو مجموعة aryl amino غير متجانس بها استبدال
- بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو
- halogen أو cyano أو nitro أو diheteroaryl amino أو مجموعة diheteroaryl amino __ بها ٢٠

- استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino phenyl أو مجموعة amino phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino أو di amino phenyl أو مجموعة diphenylamino بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino cycloalkyl C₃-C₇ أو amino C₁-C₁₀ أو cycloalkoxy C₃-C₇ أو di(C₃-C₇cycloalkyl)amino أو haloalkoxy di(C₂-C₈alkyl)amino أو alkylamino C₁-C₅ أو haloalkoxy تكون R^f و R^g كل منهما على حدة alkyl C₁-C₁₀ أو alkenyl C₂-C₁₀ أو alkynyl C₂-C₁₀ أو alkoxy C₁-C₁₀ أو haloalkyl C₁-C₁₀ أو alkyl cyano C₁-C₁₀ أو alkyl nitro C₁-C₁₀ أو aminoalkyl C₁-C₁₀ أو alkylamino C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو di(C₂-C₈alkyl)aminoC₁-C₅ أو C₅alkyl alkyl أو cycloalkyl C₃-C₇ أو alkyl C₁-C₅ أو alkoxy C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو C₃-alkylthio C₁-C₅ أو alkenyloxy C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو alkylsulfonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو alkyl C₅ أو alkylideneaminoxy C₂-C₈ أو alkyl C₁-C₅ أو alkylcarbonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو alkylaminocarbonyl C₁-C₅ أو alkoxy carbonyl C₁-C₅ أو aminocarbonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ أو di(C₂-C₈alkyl)aminocarbonylC₁-C₅ أو aminoalkyl C₁-C₅ أو alkyl N-C₂-C₅ أو alkylcarbonyl N-C₁-C₅ أو tri(C₃-C₆alkyl)silylC₁-C₅ أو C₅alkyl أو phenyl C₁-C₅ (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو C₁-

- alkylthio C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₅ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro (أو aryl غير متجانس alkyl C₁-C₅ (حيث أن مجموعة aryl غير المتجانس يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₅ أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو phenyl أو cycloalkyl C₁-C₈ أو haloalkenyl C₁-C₅ (أو cyano أو nitro) ٥
- مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino aryl غير متجانس أو مجموعة amino aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو diheteroarylamino أو ١٠
- مجموعة diheteroarylamino بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino phenyl أو amino ١٥
- مجموعة amino phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو amino أو hydroxyl أو diphenylamino أو مجموعة diphenylamino بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro أو C₃-C₇cycloalkyl amino أو amino cycloalkyl C₇ أو ٢٠
- haloalkoxy C₁-C₁₀ أو alkylamino C₁-C₅ أو di(C₂-C₈alkyl)amino أو benzyloxy أو phenoxy ، حيث أن مجموعة benzyl و phenyl يمكن أن يكون بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃

أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro ،

و تكون R^h عبارة عن alkyl C₁-C₁₀ أو alkenyl C₃-C₁₀ أو alkynyl C₃-C₁₀ أو haloalkyl C₁-C₁₀

أو alkyl cyano C₁-C₁₀ أو alkyl nitro C₁-C₁₀ أو aminoalkyl C₂-C₁₀ أو alkylamino C₁-C₅

أو alkyl C₁-C₅ أو di(C₂-C₈alkyl)aminocarbonylC₁-C₅alkyl أو cycloalkyl C₃-C₇ أو C₁-C₅ ٥

أو alkyl C₁-C₅ alkoxy C₁-C₅ أو C₁alkyl-C₅ alkenyloxy C₃-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkenyloxy C₃-C₅

أو alkyl C₁-C₅ alkylthio C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfinyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅

أو alkyl C₁-C₅ alkylsulfonyl C₁-C₅ أو alkyl C₁-C₅ alkylideneaminoxy C₂-C₅ أو alkyl C₁-C₅

أو C₅alkylaminocarbonylC₁- أو C₁-C₅alkyl alkoxy carbonyl C₁-C₅ و alkyl C₁-C₅ alkylcarbonyl

أو C₅alkyl أو alkyl C₁-C₅ alkylaminocarbonyl C₁-C₅ أو di(C₂-C₈alkyl)aminocarbonylC₁- ١٠

أو C₅alkyl أو alkyl C₁-C₅ amino alkylcarbonyl C₁-C₅ أو -N alkylcarbonyl C₁-C₅ -N

أو alkyl C₁-C₅ C₁-C₅alkylamino أو tri(C₃-C₆alkyl)silylC₁-C₅alkyl أو phenyl C₁-C₅ alkyl C₁-C₅

(حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃)

أو haloalkyl أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو C₁-C₃

أو alkylsulfinyl أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro) أو aryl غير ١٥

متجانس alkyl C₁-C₅ (حيث أن مجموعة aryl غير المتجانس يمكن أن يكون بها استبدال اختياري

بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو C₁-

أو alkylthio C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو

(nitro) أو alkyl C₁-C₅ phenoxy (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال

اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو alkoxy C₁-C₃ أو C₁-C₃ ٢٠

haloalkoxy أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو alkylsulfonyl C₁-C₃ أو aryl مجموعة aryl (أو cyano أو nitro) أو غير متجانس alkyl C₁-C₅ oxy (حيث أن مجموعة aryl غير المتجانس يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة alkyl C₁-C₃ أو haloalkyl C₁-C₃ أو haloalkoxy C₁-C₃ أو alkylthio C₁-C₃ أو alkylsulfinyl C₁-C₃ أو C₁-C₃ alkoxy أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro) أو haloalkenyl C₁-C₅ أو C₃-C₈ cycloalkyl أو phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkyl أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو بواسطة nitro أو aryl غير متجانس أو مجموعة aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₃ أو C₁-C₃ haloalkyl أو haloalkoxy C₁-C₃ أو halogen أو cyano أو nitro .

١٠ في مجموعة مفضلة من المركبات التي لها الصيغة I، تكون R¹ عبارة عن halogen ، C₁-C₄ ، alkyl ، haloalkyl C₁-C₄ ، alkenyl C₂-C₄ أو alkynyl C₂-C₄ .

في مجموعة مفضلة أخرى من المركبات التي لها الصيغة I، تكون R² عبارة عن aryl أو aryl غير متجانس؛ أو aryl أو aryl غير متجانس وكل منهما بها استبدال بواسطة halogen أو C₁-C₄ alkyl أو haloalkyl C₁-C₄ أو alkenyl C₂-C₄ أو haloalkenyl C₂-C₄ أو C₁-C₄ alkynyl أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkoxy C₁-C₄ أو phenoxy أو alkylthio C₁-C₄ أو ١٥ haloalkyl C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو haloalkylthio C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو sulfonfyl أو haloalkyl C₁-C₄ أو sulfonfyl أو cycloalkyl C₃-C₆ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو oxy أو haloalkyl C₁-C₄ sulfonfyl oxy أو alkoxy C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو C₁-C₄ alkylthio أو alkyl C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄

C₁-C₆ alkyl أو amino أو hydroxy أو thiocyanato أو cyano أو nitro أو C₁-C₄ dialkylamino أو amino cycloalkyl C₃-C₆ أو C₁-C₈

morpholino, thiomorpholino, C₁-C₆alkylcarbonylamino, C₁-C₆alkoxycarbonylamino,

C₃-C₆ alkenyloxycarbonylamino, C₃-C₆ alkynyloxycarbonylamino, C₁-C₆

alkylaminocarbonylamino, di(C₁-C₆alkyl)aminocarbonylamino, formyl, C₁-

C₆alkylcarbonyl, C₂-C₆alkenylcarbonyl, C₂-C₆alkynylcarbonyl, carboxy, C₁-

C₆alkoxycarbonyl, C₃-C₆alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆alkynyloxycarbonyl, carboxamido,

C₁-C₆alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₆alkyl)aminocarbonyl, C₁-C₆alkylcarbonyloxy, C₁-

C₆alkylaminocarbonyloxy, di(C₁-C₆alkyl)aminocarbonyloxy or C₁-

C₆alkylthiocarbonylamino;

يفضل أن تكون R² في المركبات التي لها الصيغة I عبارة عن aryl أو aryl غير متجانس؛ أو

aryl أو aryl غير متجانس كل منها بها استبدال بواسطة halogen أو alkyl C₁-C₄ أو

C₂-C₄ haloalkenyl C₂-C₄ أو alkenyl C₂-C₄ أو phenoxy أو haloalkyl C₁-C₄ أو

C₁-C₄ alkylthio C₁-C₄ أو haloalkoxy C₁-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو alkynyl

haloalkyl C₁-C₄ أو haloalkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو alkylsulfinyl

sulfinyl أو haloalkyl C₁-C₄ sulfonyl أو nitro أو cyano .

وعلى نحو أكثر تفضيلاً تكون R² عبارة عن :

phenyl, thienyl, furyl, pyrrolyl, isoxazolyl, oxazolyl, isothiazolyl, thiazolyl, pyrazolyl,

imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, pyridazinyl,

oxadiazolyl and thiadiazolyl, and N-oxides

منها و أملاح منها أو حيث تكون تلك الحلقات ليس بها استبدال أو بها استبدال بواسطة
haloalkenyl C₂-C₄ أو alkenyl C₂-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو halogen
أو alkynyl C₂-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkoxy C₁-C₄ أو alkylthio C₁-C₄ أو C₁-C₄
haloalkyl C₁-C₄ أو haloalkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄ أو alkylsulfinyl
أو sulfinyl haloalkyl C₁-C₄ أو sulfonyl أو nitro أو cyano . ٥

وفي مركبات أكثر تفضيلاً التي لها الصيغة I، تكون R² عبارة عن :

phenyl أو pyridyl أو phenyl أو pyridyl وكل منهما بها استبدال بواسطة halogen أو
nitro أو cyano أو alkyl C₁-C₂ أو haloalkyl C₁-C₂ أو alkoxy C₁-C₂ أو C₁-C₂
haloalkoxy .

١٠ وفي مجموعة مفضلة بوجه خاص من المركبات التي لها الصيغة I تكون R² عبارة عن مجموعة
phenyl بها استبدال عند الموضع para وذلك بواسطة halogen (وبالتحديد chlorine) و يمكن
أن يكون بها استبدال بشكل اختياري أيضاً بواسطة halogen أو nitro أو alkyl C₁-C₂ أو C₁-
haloalkyl C₂ أو alkoxy C₁-C₂ أو haloalkoxy C₁-C₂ .

على نحو مفضل تكون R³ عبارة عن hydrogen (عندما تكون r هي صفر) أو halogen أو
١٥ alkyl C₁-C₆ وخصوصاً hydrogen .

من المفضل أن تكون R³، إذا كانت r هي ١، عبارة عن halogen أو alkyl C₁-C₃ .

تفضل تلك المركبات التي لها الصيغة I حيث R⁴ و R⁵ و R^e و R⁷ ، كل منهم على حدة هي
hydrogen أو alkyl C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو alkoxy C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو
alkylthio C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkylsulfonyl C₁-C₄

alkyl C₁-C₄ ؛ cycloalkyl C₅-C₇ أو cycloalkyl C₅-C₇ بها استبدال بواسطة C₁ أو C₂ alkyl أو -C₁ أو haloalkyl C₂ والتي يمكن فيها استبدال مجموعة methylene بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ cycloalkyl C₁-C₅ أو C₁-C₂ alkyl أو C₁ أو C₅ alkyl أو cycloalkyl C₅-C₇ بها استبدال بواسطة C₁-C₂ alkyl أو C₁ أو C₂ haloalkyl والتي يمكن فيها استبدال مجموعة methylene بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl .

ويشكل مفضل أكثر تكون R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷، كل منها على حدة عبارة عن hydrogen أو C₁-C₂ alkyl أو haloalkyl C₁-C₂ أو alkoxy C₁-C₂ أو alkyl C₁-C₂ .

والمعني المفضل لـ Y أن تكون C ، O ، S .

١٠ يفضل على نحو خاص أن تكون Y عبارة عن O .

يفضل أن تكون G هي C(X^a)-R^a أو C(X^b)-X^c-R^b ويكون معني X^a و R^a أو X^b أو X^c و R^b كما تم وصفهم من قبل. وعلى نحو أكثر تفضيلاً يتم اختيار المجموعة G المؤخرة للمفعول من المجموعات C(X^a)-R^a ، C(X^b)-X^c-R^b، حيث X^a و X^b و X^c عبارة عن oxygen و R^a عبارة عن C₁-C₃ alkyl أو alkenyl C₂-C₆ أو alkynyl C₂-C₆ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو alkoxy C₁-C₄ أو C₁-C₄ alkyl أو R^b عبارة عن alkyl C₁-C₆ أو alkenyl C₃-C₆ أو alkynyl C₃-C₆ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو alkyl C₁-C₄ alkoxy C₁-C₄ .

تتضمن المجموعة G الأكثر أهمية على hydrogen و cation فلز قلوي alkali metal أو cation فلز أرضي قلوي في صورة cation مقبول زراعياً، بينما يتم تفضيل hydrogen على نحو خاص.

في مجموعة مفضلة من المركبات التي لها الصيغة (I) تكون R^1 عبارة عن $alkyl C_1-C_4$ و R^2 عبارة عن phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة halogen أو $alkyl C_1-C_4$ و R^3 عبارة عن hydrogen ، R^4 و R^5 و R^6 و R^7 ، كل منهم على حدة تكون $alkyl C_1-C_2$ و Y عبارة عن O و G عبارة عن hydrogen .

٥ يتعلق الاختراع أيضاً بالأملح التي تستطيع أن تشكلها مركبات الصيغة (I) مع amines أو فلز قلوي alkali metal أو قواعد فلزية أرضية alkaline earth metal bases أو قواعد أمونيوم رباعي quaternary ammonium bases .

من بين alkali metal and alkaline earth metal hydroxides مواد مكونة للملح يجب ذكر hydroxides of lithium, sodium, potassium, magnesium and calcium ولكن على وجه أخص hydroxides of sodium and potassium . تشمل مركبات الصيغة (I) طبقاً للاختراع على الهيدرات التي يمكن تكوينها أثناء عملية تكوين الملح.

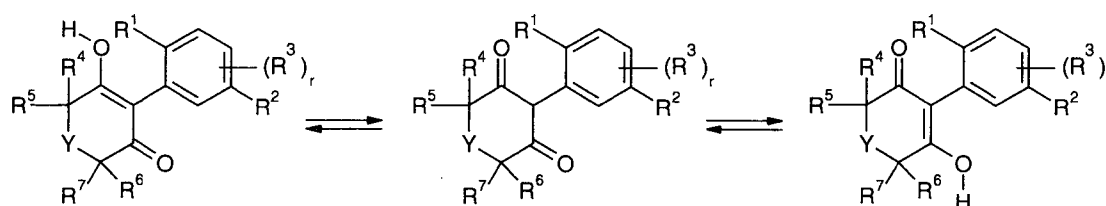
تشتمل أمثلة amines المناسبة لتكوين ملح الأمونيوم على ammonia و $C_1-C_{18}alkyl amines$ الأولية والثانوية والثلاثية و $alkyl hydroxy C_1-C_4 amines$ و $alkyl amines C_2-C_4alkoxy$ ، على سبيل المثال :

١٥ methylamine, ethylamine, n-propylamine, isopropylamine, the four butylamine isomers, n-amylamine, isoamylamine, hexylamine, heptylamine, octylamine, nonylamine, decylamine, pentadecylamine, hexadecylamine, heptadecylamine, octadecylamine, methylethylamine, methylisopropylamine, methylhexylamine, methylnonylamine, methylpentadecylamine, methyloctadecylamine, ethylbutylamine, ethylheptylamine, ethyloctylamine, hexylheptylamine, hexyloctylamine, dimethylamine, diethylamine, di-

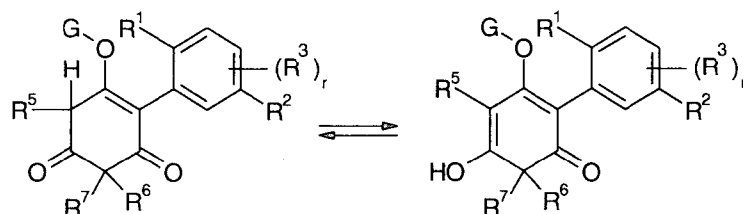
n-propylamine, diisopropylamine, di-n-butylamine, di-n-amylamine, diisoamylamine, dihexylamine, diheptylamine, dioctylamine, ethanolamine, n-propanolamine, isopropanolamine, N,N-diethanolamine, N-ethylpropanolamine, N-butylethanolamine, allylamine, n-but-2-enylamine, n-pent-2-enylamine, 2,3-dimethylbut-2-enylamine, dibut-2-enylamine, n-hex-2-enylamine, propylenediamine, trimethylamine, triethylamine, tri-n-propylamine, triisopropylamine, tri-n-butylamine, triisobutylamine, tri-sec-butylamine, tri-n-amylamine, methoxyethylamine and ethoxyethylamine; heterocyclic amines, for example pyridine, quinoline, isoquinoline, morpholine, piperidine, pyrrolidine,

تكون قواعد الأمونيوم الرباعي المناسبة لتكوين الملح منظرية، على سبيل المثال، للصيغة $[N(R_g R_b R_c R_d)]OH$ حيث تكون R_a و R_b و R_c و R_d كل منهم على حدة عبارة عن C_1-C_4 alkyl .
بالإضافة إلى ذلك يمكن الحصول على قواعد الأمونيوم الرباعي المناسبة مع anion ات الأخرى المناسبة، وذلك على سبيل المثال عن طريق تفاعلات التبادل anion ي.

وبالاعتماد على طبيعة مجموعات الاستبدال الخاصة بـ G و R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و R^8 ، يمكن أن تتواجد مركبات الصيغة I في أشكال أيزومرية مختلفة. عندما تكون G هي hydrogen على سبيل المثال فإن مركبات الصيغة I يمكن أن يكون لها أشكال صنوية مختلفة.



وعلاوة على ذلك، عندما تكون Y هي C=O و R⁴ هي hydrogen، فيمكن تواجد مركبات أخرى من الصيغة I في أشكال صنوية مختلفة.

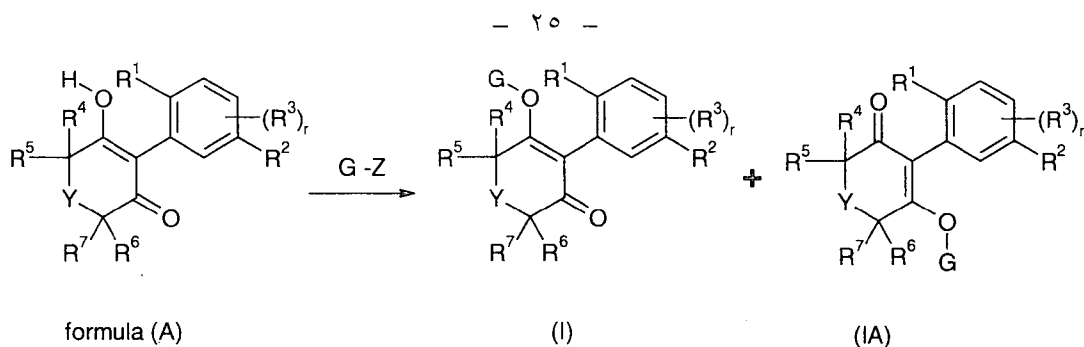


وأيضاً، عندما تشتمل مجموعات الاستبدال على رابط مزدوجة فيمكن تواجد أيزومرات cis- and trans . يشتمل هذا الاختراع على كل تلك الأيزومرات والمركبات الصنوية والخلائط منها بجميع النسب الخاصة بها. وهذه الأيزومرات أيضاً، تقع في نطاق المركبات المراد حمايتها ذات الصيغة I.

يمكن تحضير مركب له الصيغة (I)، حيث G عبارة عن alkyl C₁-C₈ أو haloalkyl C₂-C₈ أو alkyl C₁-C₈ phenyl (حيث أن مجموعة phenyl يمكن أن يكون بها استبدال اختياري بواسطة C₁-C₃ alkyl أو C₁-C₃ haloalkyl أو C₁-C₃ haloalkoxy أو C₁-C₃ alkylthio أو C₁-C₃ alkylsulfinyl أو C₁-C₃ alkylsulfonyl أو C₁-C₃ haloalkenyl أو C₃-C₈ alkenyl أو C₃-C₈ alkynyl أو C(X^a)-R^a أو C(X^b)-R^b أو C(X^c)-N(R^c)-R^d أو -SO₂-R^e أو P(X^f)(R^f)-R^g أو CH₂-X^f-R^h حيث X^a و X^b و X^c و X^d أو X^e و X^f و R^a و R^b و R^c و R^d و R^e و R^f و R^g و R^h كما تم وصفهما من قبل عن طريق معالجة مركب له الصيغة (A)، حيث يكون مركب من الصيغة (I) حيث G عبارة عن H مع مادة تفاعل من Z-G، حيث Z-G عبارة عن عامل ألكلة مثل alkyl halide (يشتمل

تعريف alkyl halides على C_1-C_5 alkyl halides البسيطة مثل methyl iodide و ethyl iodide ، والتي يكون بها استبدال ب alkyl halides مثل chloromethyl alkyl ethers أو $Cl-CH_2-X^f-R^h$ حيث X^f عبارة عن oxygen و chloromethyl alkyl sulfides أو $Cl-CH_2-X^f-R^h$ حيث X^f عبارة عن كبريت (sulfur) أو

- ٥ C_1-C_8 alkyl sulfonate, or a di(C_1-C_8 alkyl) sulfat أو مع C_3-C_8 alkenyl halide مع C_3- C_8 alkynyl halide أو مع عامل أسيلة مثل carboxylic acid أو $HO-C(X^a)R^a$ حيث X^a هي oxygen أو acid chloride أو $C_1-C(X^a)R^a$ حيث X^a هي oxygen ، أو acid anhydride أو $[R^aC(X^a)]_2O$ حيث X^a هي oxygen أو isocyanate أو $R^C N=C=O$ أو carbamoyl chloride أو $Cl-C(X^d)-N(R^C)-R^d$ (حيث X^d عبارة عن oxygen وبشرط أن لا تكون أيأ من R^C أو R^d عبارة عن hydrogen) ، أو $Cl-(X^d)-N(R^C)-R^d$ thiocarbamoyl chloride (حيث X^d عبارة عن كبريت sulfur بشرط أن لا تكون أيأ من R^C أو R^d عبارة عن hydrogen) أو $Cl-C(X^b)-XC-R^b$ chlorothioformate (حيث X^b عبارة عن X^C و X^b هما oxygen) أو $Cl-C(X^b)-XC-R^b$ chlorodithioformate (حيث X^C و X^b هما كبريت sulfur) أو $Cl-C(X^b)-XC-R^b$ chlorodithioformate (حيث X^C و X^b هما كبريت sulfur) أو isothiocyanate أو $R^C N=C=S$ أو بواسطة المعالجة التتابعية باستخدام carbon disulfide أو عامل ألكلة أو باستخدام عامل إدخال مجموعة phosphorylating مثل phosphoryl chloride ، $Cl-P(X^B)(R^f)-R^9$ أو عن طريق إدخال سلفونات مثل sulfonyl chloride ، $Cl-SO_2-R^e$ ، يفضل أن يكون ذلك في وجود قاعدة مكافئة واحدة على الأقل. حيث أن مجموعات الاستبدال R^4 و R^5 لا تكونان مكافئتين لمجموعات الاستبدال R^6 و R^7 ، ويمكن أن تنتج هذه التفاعلات، بالإضافة إلى مركب الصيغة (I)، مركب ثان له الصيغة (IA). يشتمل هذا الاختراع على كل من مركب الصيغة (I) مركب الصيغة (IA) وأيضاً لخلائط من تلك المركبات بأي نسبة.
- ٢٠



لقد عرفت عملية إدخال O-alkylation الخاصة بمركبات 1,3-diones الحلقية والطرق المناسبة لذلك قد تم وصفها، على سبيل المثال، عن طريق T. Wheeler, US4436666 . وقد تم تسجيل إجراءات بديله عن طريق :

M. Pizzorno and S. Albonico, Chem. Ind. (London), (1972), 425-426; H. Born et al., J. Chem. Soc, (1953), 1779-1782; M. G. Constantino et al., Synth. Commun., (1992), 22 (19), 2859-2864; Y. Tian et al., Synth. Commun., (1997), 27 (9), 1577-1582; S. Chandra Roy et al., Chem. Letters, (2006), 35 (1), 16-17; P. K. Zubaidha et al., Tetrahedron Lett., (2004), 45, 7187-7188.

يمكن إجراء عملية إدخال O-acylation الخاصة بمركبات 1,3-diones الحلقية باستخدام إجراءات مشابهة لتل الإجراءات تم وصفها، على سبيل المثال، عن طريق :

US4436666 و US4659372 و T. Wheeler, US4422870 و R. Haines, US4175135 .

نمطياً، يمكن معالجة دايونات الصيغة (A) عن طريق عامل إدخال مجموعة أسيل ويفضل في وجود قاعدة مكافئة ومناسبة واحدة على الأقل، وبشكل اختياري في وجود مذيب مناسب. يمكن أن تكون

القاعدة غير عضوية مثل alkali metal carbonate or hydroxide, or a metal hydride أو قاعدة ١٥

عضوية مثل tertiary amine or metal alkoxide. تشمل أمثلة القواعد غير الفلزية على sodium

carbonate, sodium or potassium hydroxide, sodium hydride والقواعد العضوية المناسبة التي

تشتمل على trialkylamines أو مثل trimethylamine أو triethylamine أو مركبات pyridine أو قواعد amines أخرى مثل :

1,4-diazobicyclo[2.2.2]-octane and 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene . تتضمن القواعد المفضلة على triethylamine و pyridine . يتم اختيار المذيبات المناسبة التي تتواءم مع مواد التفاعل والتي تكون مشتملة على ethers مثل tetrahydrofuran و 1,2-dimethoxyethane و المذيبات التي تمت معالجتها بـ halogen مثل dichloromethane و chloroform . يمكن استخدام قواعد خاصة بشكل ناجح كل منهما مذيب وقاعدة مثل pyridine و triethylamine . وفيما يخص الحالات التي يكون فيها عامل إدخال مجموعة acylation هو carboxylic acid ، فإن عملية الأسيلة يفضل أن تتم في وجود عامل إقران مناسب مثل :

2-chloro-1-methylpyridinium iodide, N,N'-dicyclohexylcarbodiimide, 1-(3-

dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide and N,N'-carbodiimidazole

وبشكل اختياري في وجود قاعدة مثل triethylamine أو pyridine في مذيب مناسب مثل tetrahydrofuran أو dichloromethane أو acetonitrile . وقد تم وصف الإجراءات المناسبة، على سبيل المثال، بواسطة :

W. Zhang and G. Pugh, Tetrahedron Lett., (1999), 40 (43), 7595-7598; T. Isobe and T.

Ishikawa, J. Org. Chem., (1999), 64 (19), 6984-6988 and K. Nicolaou, T. Montagnon, G.

Vassilikogiannakis, C. Mathison, J. Am. Chem. Soc, (2005), 127(24), 8872-8888

يمكن إجراء إدخال مجموعة Phosphorylation الخاصة 1,3-diones الحلقية باستخدام phosphoryl halide أو thiophosphoryl halide وقاعدة وذلك عن طريق إجراءات مشابهة لتلك الإجراءات

الموصوفة عن طريق L. Hodakowski, US4409153 . ٢٠

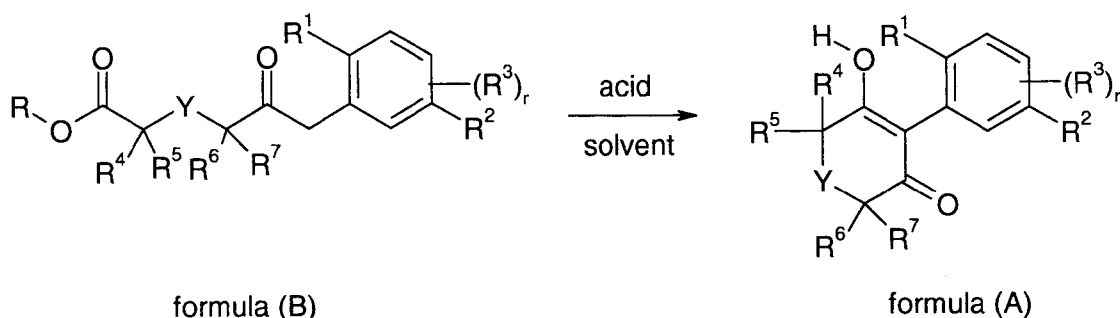
يمكن إدخال مجموعة sulfonyl الخاصة بمركب الصيغة (A) عن طريق استخدام alkyl أو aryl sulfonyl halide ، ويفضل في وجود مكافئ واحد على الأقل للقاعدة، ويمكن تحقيق ذلك على سبيل المثال عن طريق إجراء :

. C. Kowalski and K. Fields, J. Org. Chem., (1981), 46,197-201

٥ يمكن تحضير المركبات لها الصيغة (A)، حيث Y عبارة عن $S(O)_m$ و m عبارة عن ١ أو ٢ من مركبات الصيغة (A)، حيث Y هي S عن طريق الأكسدة، وذلك طبقاً للإجراء المشابه لإجراء E.

. Fennel and A. Paul, J. Am. Chem. Soc, (1955), 77, 4241-4244

١٠ يمكن تحضير مركب له الصيغة (A)، حيث Y عبارة عن صفر أو S أو $C=O$ وذلك عن طريق تحويل مركب له الصيغة (B) إلى مركب حلقي، ويفضل في وجود حمض أو قاعدة وبشكل اختياري في وجود مذيب مناسب وذلك باستخدام طرق مشابهة لتلك الطرق التي تم وصفها بواسطة T. Wheeler, US4209532 . تم على وجه خاص تصميم مركبات لها الصيغة (B) لكي تكون مركبات وسيطة في تخليق مركبات الصيغة I. يمكن جعل المركبات لها الصيغة (B)، حيث R عبارة عن hydrogen أو C_1-C_4 alkyl أو (بشكل خاص methyl و ethyl و butyl -t) حلقة تحت ظروف حمضية وبشكل مفضل في وجود حمض قوي مثل sulfuric acid أو polyphosphoric acid أو مادة تفاعل Eaton's وبشكل اختياري في وجود مذيب مناسب مثل acetic acid أو toluene أو dichloromethane .



يمكن جعل مركب له الصيغة (B) حلقي ، حيث R عبارة عن alkyl (بشكل مفضل methyl أو ethyl) تحت ظروف حمضية أو قاعدية ويفضل تحت ظروف قاعدية في وجود مكافئ واحد على الأقل مثل :

potassium tert-butoxide, lithium diisopropylamide, sodium bis(trimethylsilyl)amide or sodium hydride ,

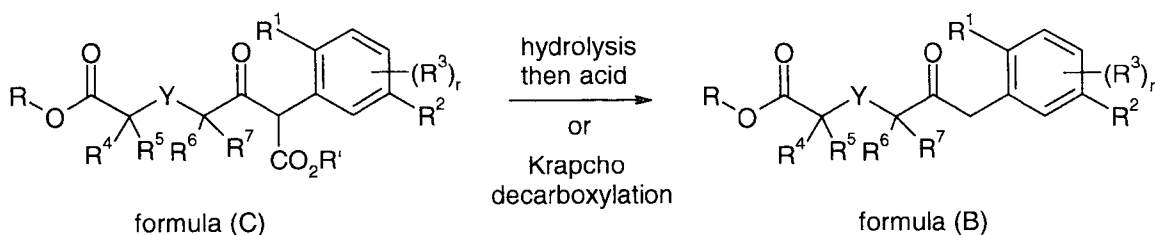
وفي مذيب مثل tetrahydrofuran ، toluene ، dimethylsulfoxide أو

. N,N-dimethylformamide

يمكن أسترة مركب له الصيغة (B)، حيث R عبارة عن H الذي يمكن تحويله لإستر esterified لمركب له الصيغة (B)، حيث R عبارة عن alkyl ، تحت ظروف معروفة (على سبيل المثال عن طريق المعالجة بكحول، R-OH في وجود محفز حمضي).

يمكن تحضير مركب له الصيغة (B)، حيث R عبارة عن H عن طريق التحلل المائي لمركب له الصيغة (C)، حيث R عبارة عن H أو alkyl و R' عبارة عن alkyl (بشكل مفضل methyl أو ethyl) يلي ذلك بتحويل مخلوط التفاعل إلى الحالة الحمضية لكي يتم إزالة مجموعة carboxyl ، باستخدام عمليات مشابهة لتلك التي تم وصفها، على سبيل المثال، بواسطة :

T. Wheeler, US4209532 وبشكل بديل مركب له الصيغة (B)، حيث R عبارة عن alkyl (بشكل مفضل methyl) من مركب له الصيغة (C)، حيث R عبارة عن alkyl (بشكل مفضل methyl) وذلك من خلال إجراء Krapcho الخاص بإزالة مجموعة carboxyl تحت ظروف معروفة تستخدم مواد تفاعل معروفة (انظر على سبيل المثال :

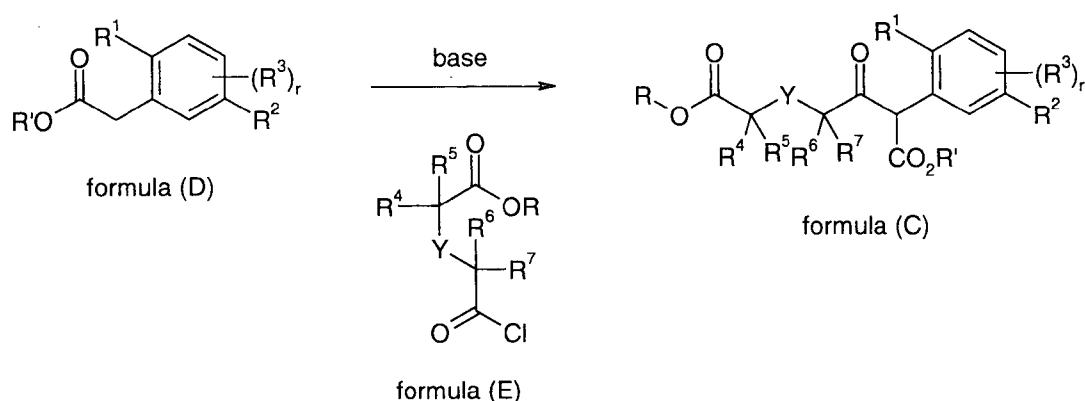


يمكن تحضير مركب له الصيغة (C)، حيث R عبارة عن alkyl عن طريق معالجة مركب له الصيغة (D) carboxylic acid chloride مناسب له الصيغة (E)، حيث R عبارة عن alkyl تحت ظروف قاعدية. تشتمل القواعد المناسبة على :

potassium tert-butoxide, sodium bis(trimethyl-silyl)amide and lithium diisopropylamide

ويفضل أن يتم إجراء في مذيب مناسب (مثل tetrahydrofuran أو toluene) عند درجة تتراوح

بين - ٨٠°م و ٣٠°م :



وبشكل اختياري يمكن تحضير مركب له الصيغة (C)، حيث R عبارة عن H، عن طريق معالجة

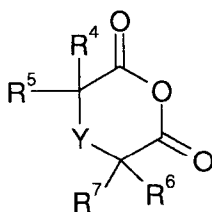
مركب له الصيغة (D) باستخدام قاعدة مناسبة مثل :

tert-butoxide, sodium bis(trimethylsilyl)amide and lithium diisopropylamide في مذيب

مناسب (مثل tetrahydrofuran أو toluene) عند درجة حرارة مناسبة تتراوح بين - ٨٠°م و

و ٣٠°م) و جعل anion الناتج يتفاعل مع anhydride مناسب له الصيغة (F):

- ٣٠ -



formula (F)

تعتبر مركبات الصيغة (E) والصيغة (F) معروفة (انظر على سبيل المثال :

T. Terasawa and T. Okada, J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169 and G. Bennett,

(W. Houlihan, R. Mason, and R. Engstrom, J. Med. Chem., (1976), 19 (5), 709-14

أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق مشابهة من مواد بدء متاحة تجارياً. ٥

يمكن تحضير مركب الصيغة (H) باستخدام إجراءات مشابهة لتلك التي تم ذكرها بإيجاز أعلاه،

وتكون البداية phenylacetic acid قد تمت معالجته بـ halogen من الصيغة (G) (حيث يكون

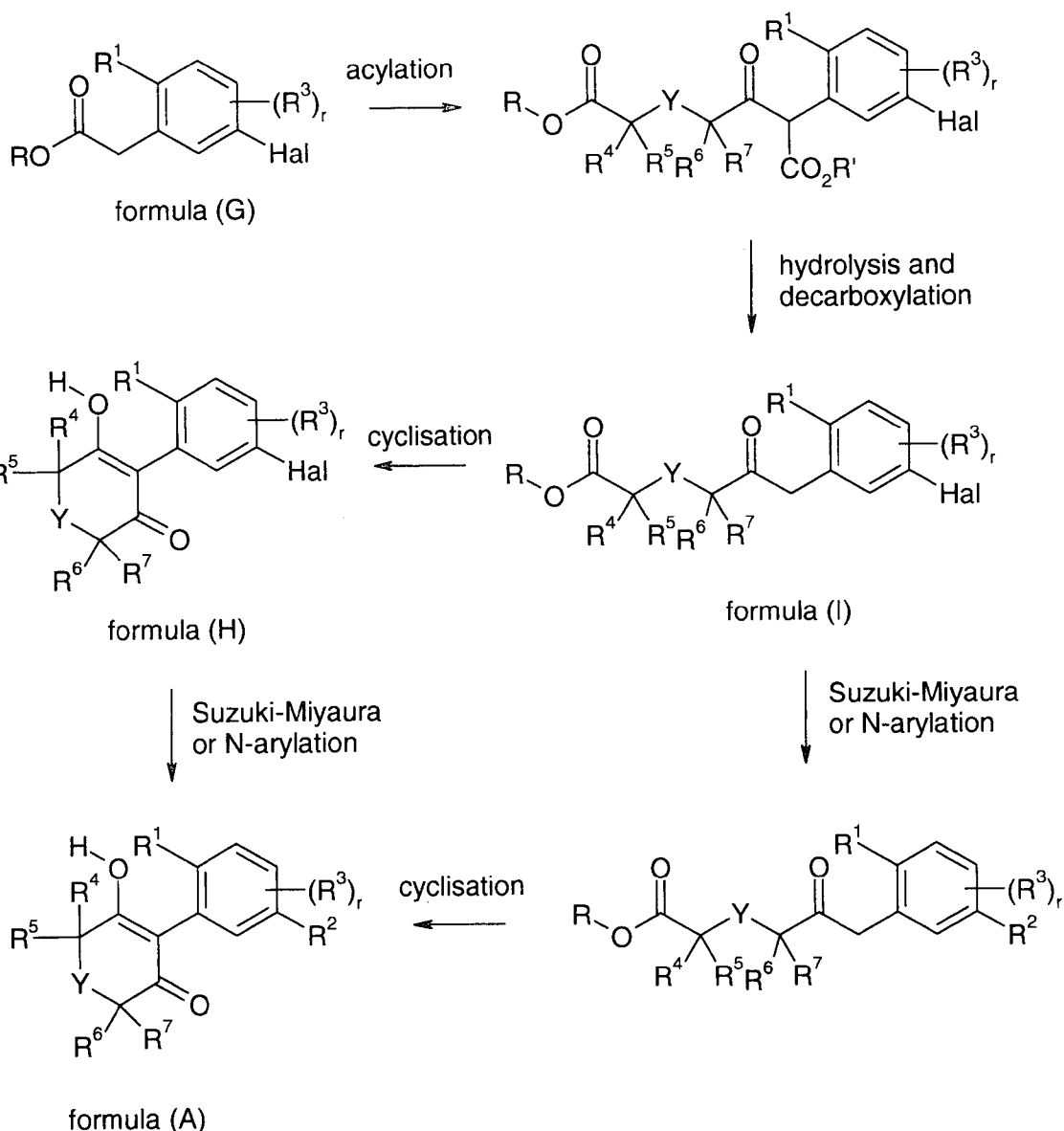
halogen عبارة عن chlorine أو bromine أو iodine). وهذا المركب بدوره يمكن تحويله إلى

مركب له الصيغة (A) حيث R^2 هي aryl أو aryl غير متجانس وذلك عن طريق التفاعل مع

عامل إقران مثل aryl أو boronic acid لـ aryl متجانس أو $R^2-B(OH)_2$ أو ملح مناسب أو إستر ١٠

منها تحت ظروف palladium حفزي، ويفضل ظروف Suzuki-Miyaura.

يتم تصميم مركبات الصيغة (H) بالتحديد كمركب وسيط في تخليق مركبات الصيغة (I).



تكون الظروف المناسبة لإجراء إقران Suzuki-Miyaura المتبادل aryl halide من الصيغة (H) مع aryl أو boronic acid لـ aryl غير متجانس من الصيغة $R^2-B(OH)_2$ أو ملح أو إستر مناسب منها معروف في المراجع (انظر على سبيل المثال:

K. Billingsley and S. Buchwald, *J. Am. Chem. Soc.*, (2007), 129, 3358-3366; H. Stefani, R.

Cella and A. Vieira, *Tetrahedron*, (2007), 63, 3623-3658; N. Kudo, M. Perseghini and G. Fu,

Angew. Chem. Int. Ed., (2006), 45, 1282-1284; A. Roglans, A. Pla-Quintana and M. Moreno-

Mafias, Chem. Rev., (2006), 106,4622-4643; J-H Li, Q-M Zhu and Y-X Xie, Tetrahedron

(2006), 10888-10895; S. Nolan et al., J. Org. Chem., (2006), 71,685-692; M. Lysen and K. Kohler, Synthesis, (2006), 4, 692-698; K. Anderson and S. Buchwald, Angew. Chem. Int. Ed., (2005), 44,6173-6177; Y. Wang and D. Sauer, Org. Lett., (2004), 6 (16), 2793-2796; I. Kondolff, H. Doucet and M. Santelli, Tetrahedron, (2004), 60, 3813-3818; F. Bellina, A. Carpita and R. Rossi, Synthesis (2004), 15,2419-2440; H. Stefani, G. Molander, C-S Yun, M. Ribagorda and B. Biolatto, J. Org. Chem., (2003), 68, 5534-5539; A. Suzuki, Journal of Organometallic Chemistry, (2002), 653, 83; G. Molander and C-S Yun, Tetrahedron, (2002), 58,1465-1470; G. Zou, Y. K. Reddy and J. Falck, Tetrahedron Lett., (2001), 42, 4213-7215; S. Darses, G. Michaud and J-P. Genêt, Eur. J. Org. Chem., (1999), 1877-1883; M. Beavers et al., WO2005/012243; J. Org. Chem. (1994), 59, 6095-6097; A. Collier and G. Wagner, Synthetic Communications, (2006), 36; 3713-3721

وبشكل اختياري، يمكن تحضير مركب من الصيغة (A) باستخدام طريقة Suzuki-Miyaura للربط المتبادل لمركبات الصيغة (I)، حيث أن Hal هي chlorine أو bromine أو iodine أو halogen كاذب مثل C₁-C₄ haloalkylsulfonate ، وبالتحديد triflate مع aryl أو boronic acid لـ aryl غير متجانس من الصيغة R²-B(OH)₂ أو ملح مناسب منه أو إستر منه، ويؤدي ذلك تكوين حلقة تحت الظروف التي تم وصفها سابقاً لمركب الصيغة (B) .

في طريقة أخرى يمكن تحضير مركب له الصيغة (A)، حيث R² عبارة عن azine N-oxide مثل: pyridine N-oxide, a pyrimidine N-oxide, pyridazine N-oxide or pyrazine N-oxide من مركب له الصيغة (H) وذلك عن طريق التفاعل مع مركب azine N-oxide مناسب تحت ظروف تم وصفها بواسطة :

L. Campeau, S. Rousseaux and K. Fagnou, J. Am. Chem. Soc, (2005), 127, 18020 and
.by J-P. Leclercand K. Fagnou, Angew. Chem. Int. Ed., (2006), 45, 7781-7786

يمكن أن تتم معالجة N-oxide الناتج باستخدام مواد تفاعل معروفة تحت ظروف معروفة (على
سبيل المثال الاختزال باستخدام hydrogen أو ammonium formate في وجود محفز مناسب)
٥ حتي يتم الحصول على مركبات الصيغة (I).

يمكن أن يتم الحصول على مركبات الصيغة (A)، حيث أن R^2 هي حلقة عطرية غير متجانسة
مرتبطة بحلقة phenyl من خلال ذرة nitrogen ، وذلك باستخدام طريقة Ullmann (يُعرف هذا
التفاعل في المراجع على أنه N - المعالجة ب aryl) من مركب من الصيغة (H) أو مركب من
الصيغة (I) وذلك عن طريق N-H التي تشتمل على مركب عطري غير متجانس و R^2 -H و في
وجود محفز مناسب ووجود مجموعة ترابطية مناسبة وقاعدة مناسبة وذلك في مذيب مناسب كما تم
١٠ وصف ذلك، على سبيل المثال، بواسطة :

M. Taillefer, N. Xia and A. Ouali, Angew. Chem. Int. Ed., (2007), 46 (6), 934-936; H.

Zhang, Q. Cai, D. Ma, J. Org. Chem., (2005), 70, 5164-5173; J. Antilla, J. Baskin, T.

Barder and S. Buchwald, J. Org. Chem., (2004), 69, 5578-5587 and A. Thomas and S.

Ley, Angew. Chem. Int. Ed., 2003, 42, 5400-5449

١٥

والمراجع الموجودة بها.

وفي طريقة أخرى أيضاً يمكن تحضير مركب له الصيغة (A)، حيث Y هي O أو S أو $C=O$
عن طريق تفاعل مركب من الصيغة (J) مع aryllead tricarboxylate في وجود مادة رابطة
مناسبة وفي وجود مذيب مناسب. وقد تم وصف التفاعلات المتشابهة في المراجع (على سبيل
٢٠ المثال، انظر :

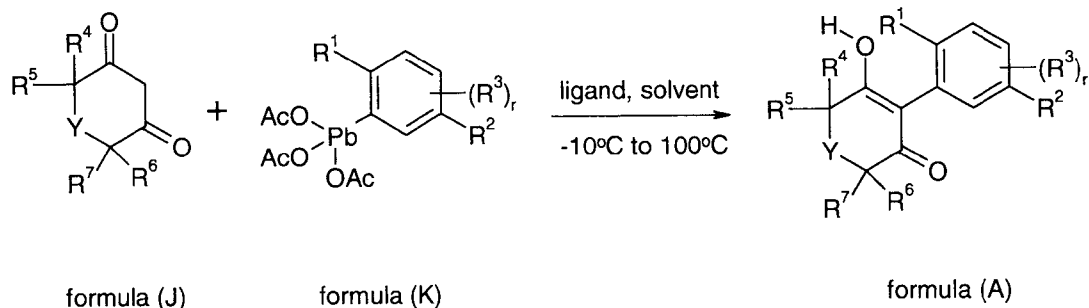
J. Pinhey, B. Rowe, Aust. J. Chem., (1979), 32,1561-6; J. Morgan, J. Pinhey, J. Chem.

. Soc. Perkin Trans. 1, (1990), 3, 715-20

يفضل أن تكون aryllead tricarbonylate هي aryllead triacetate من الصيغة (K). يفضل أن تكون المجموعة الترابطية عبارة عن nitrogen يحتوي على حلقة غير متجانسة مثل :

N,N-dimethylaminopyridine, 1,10-phenanthroline pyridine, bipyridine, or imidazole.

ويفضل أن يتم استخدام من واحد إلى عشرة من مكافئات المجموعة الترابطية فيما يتعلق بالمركب الذي له الصيغة (J). وعلى نحو أكثر تفضيلاً تكون المجموعة الترابطية عبارة عن N، N - داي pyridine methyl amino . يفضل أن يكون المذيب هو chloroform أو toluene ، وبشكل أكثر تفضيلاً يكون chloroform أو مخلوط من chloroform و toluene . يفضل أن يتم إجراء التفاعل عند درجة حرارة من -١٠°م إلى ١٠٠°م وبشكل أكثر تفضيلاً من ٤٠-٩٠°م.



تعتبر مركبات الصيغة (J)، حيث Y عبارة عن O ، مركبات معروفة أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق مشابهة لتلك التي تم وصفها في المراجع (انظر على سبيل المثال :

M. Morgan and E. Heyningen, J. Am. Chem Soc, (1957), 79, 422-424; I. Korobitsyna

and K. Pivnitskii, Russian Journal of General Chemistry, (1960), 30,4016-4023; T.

Terasawa, and T. Okada, J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169; R. Anderson et al.

US5089046; R. Altenbach, K. Agrios, I. Drizin and W. Carroll, Synth. Commun.,

- (2004), 34 (4) 557-565; R. Beaudegnies et al., WO2005/123667; W. Li, G. Wayne, J. Lallaman, S. Chang, and S. Wittenberger, J. Org. Chem. (2006), 71, 1725-1727; R. Altenbach, M. Brune, S. Buckner, M. Coghlan, A. Daza, A. Fabiyi, M. Gopalakrishnan, R. Henry, A. Khilevich, M. Kort, I. Milicic, V. Scott, J. Smith, K. Whiteaker, and W. Carroll, J. Med. Chem, (2006), 49(23), 6869-6887; Carroll et al., WO 2001/083484 A1; ٥
J. K. Crandall, W. W. Conover, J. Org. Chem. (1978), 43(18), 3533-5; I. K. Korobitsyna, O. P. Studzinskii, Chemistry of Heterocyclic Compounds (1966), (6), 848-854

تعتبر مركبات الصيغة (J)، حيث Y عبارة عن S، مركبات معروفة أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق مشابهة لتلك التي تم وصفها في المراجع (انظر على سبيل المثال:

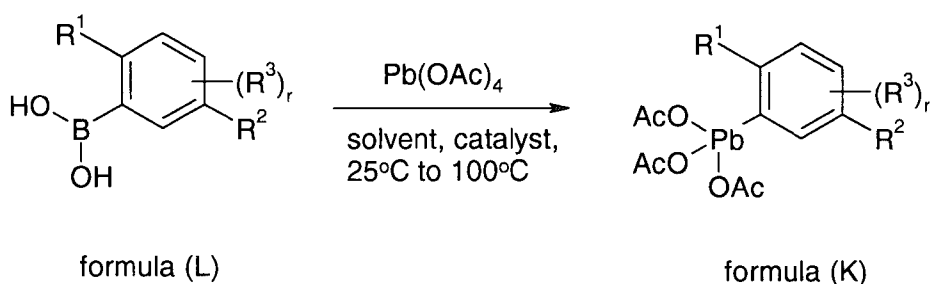
- E. Fehnel and A. Paul, J. Am. Chem Soc., (1955), 77, 4241-4244; E. Er and P. ١٠
Margaretha, Helvetica Chimica Acta (1992), 75(7), 2265-69; H. Gayer et al., DE 3318648 A1

تعتبر مركبات الصيغة (J)، حيث Y عبارة عن C = صفر، مركبات معروفة أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق مشابهة لتلك التي تم وصفها في المراجع (انظر على سبيل المثال :

- R. Gotz and N. Gbtz, WO2001/060776 R. Gotz et al. WO 2000/075095; M. Benbakkar et ١٥
al., Synth. Commun. (1989) 19(18) 3241-3247; A. Jain and T. Seshadri, Proc. Indian Acad. Sci. Sect. A, (1955), 42, 279); N. Ahmad et al., J. Org. Chem., (2007), 72(13), 4803-4815); F. Effenberger et al., Chem. Ber, (1986), 119, 3394-3404

والمراجع المذكورة فيها). يمكن تحضير مركب من الصيغة (K) من مركب من الصيغة (L) وذلك عن طريق المعالجة بتراي أسيتات رصاص في مذيب مناسب (على سبيل المثال chloroform) عند درجة حرارة من ٢٥ م إلى ١٠٠ م (يفضل من ٢٥ م إلى ٥٠ م)، وبشكل اختياري في وجود محفز مثل mercury diacetate ، وذلك طبقاً للإجراءات التي تم وصفها في المراجع (على سبيل المثال، انظر : ٥

K. Shimi, G. Boyer, J-P. Finet and J-P. Galy, Letters in Organic Chemistry, (2005), 2,407-409; J. Morgan and J. Pinhey, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1; (1990), 3, 715-720

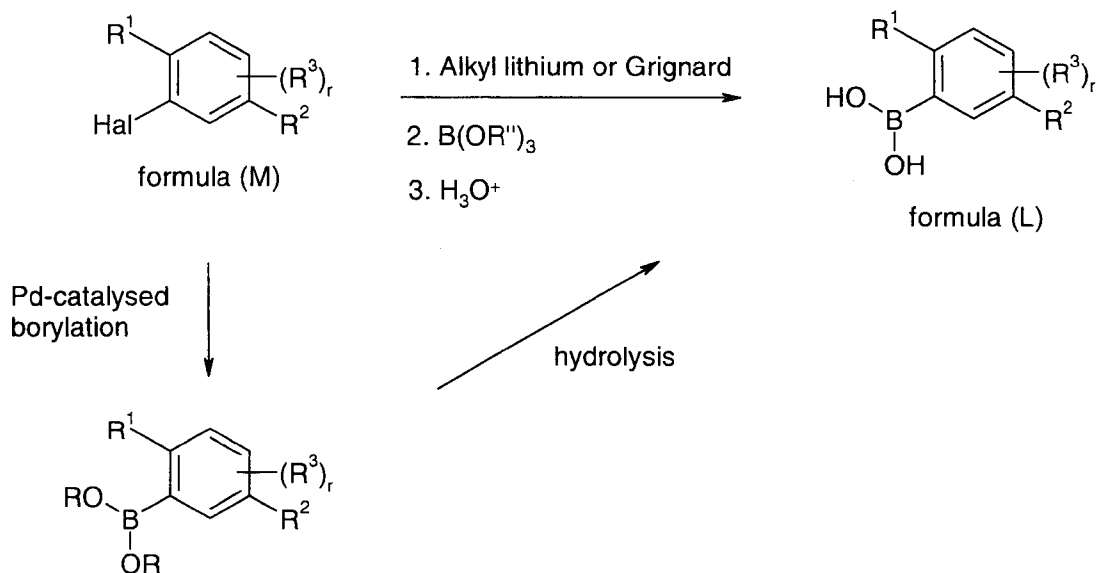


يمكن تحضير aryl boronic acid من الصيغة (L) من aryl halide من الصيغة (M)، حيث أن halogen يكون عبارة عن bromine أو iodine وذلك باستخدام طرق معروفة (انظر، على سبيل المثال: ١٠

W. Thompson and J. Gaudino, J. Org. Chem, (1984), 49, 5237-5243 and R. Hawkins et al., J. Am. Chem. Soc, (1960), 82, 3053-3059

وبالتالي يمكن معالجة aryl halide من الصيغة (M) باستخدام alkyl lithium أو

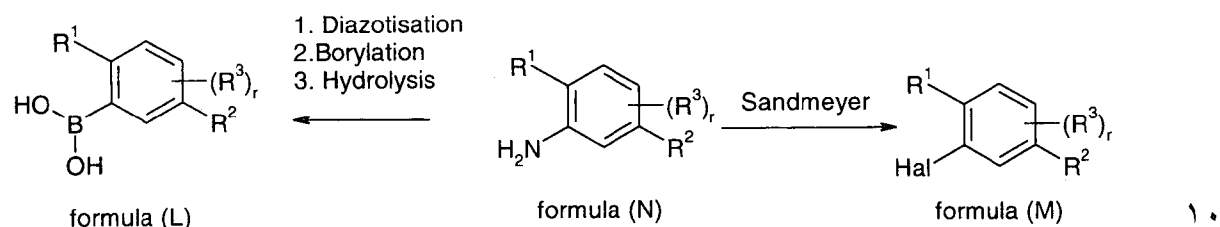
alkyl magnesium halide عند درجة منخفضة، ويتم السماح لمادة التفاعل الناتجة من aryl magnesium أو aryl lithium بالتفاعل مع trialkyl borate $B(OR'')_3$ وبشكل مفضل trimethylborate حتي يتم الحصول على aryl dialkylboronate والذي يمكن أن يتم تحلله مائياً لكي يعطي boronic acid المطلوب الذي له الصيغة (L) تحت ظروف حمضية. وبشكل بديل يمكن الحصول على التحول الكلي الخاص بالمركب (M) إلى المركب (L) من خلال تفاعل إدخال مجموعة borylation على palladium الحفزي تحت ظروف معروفة وباستخدام مواد تفاعل معروفة (على سبيل المثال انظر, 60, (1995), J. Org. Chem. Miyaura, N. Murata, M. Ishiyama, 7508-7501; and K. L. Billingsley, T. E. Barder, S. L. Buchwald, Angew. Chem. Int. Ed. 5359-5363, 46, (2007)) وبلي ذلك التحلل المائي ل boronate ester الوسيط.



تعتبر aryl halides ذات الصيغة (M) مركبات معروفة أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق معروفة من مركبات معروفة. على سبيل المثال يمكن تحضير aryl halide من الصيغة (M) من aniline في الصيغة (N) باستخدام طرق معروفة، على سبيل المثال تفاعل Sandmeyer وذلك من خلال ملح diazonium المناظر على سبيل المثال، انظر :

J. March, Advanced Organic Chemistry, 3rd Edition, John Wiley and Sons, pages 647-648 and references therein. For additional examples see also W. Denney et al., J. Med. Chem., (1991), 34, 217-222; P. Knochel et al., Synthesis, (2007), No. 1, 81-84.

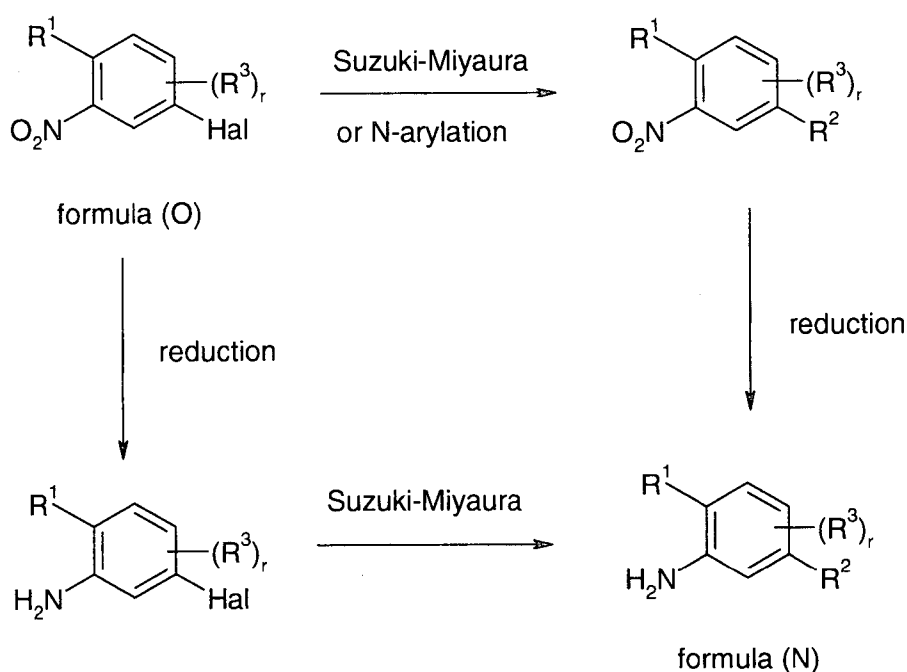
وبالإضافة إلى ذلك، يمكن تحول مركب له الصيغة (N) بشكل مباشر إلى مركب له الصيغة (L) وذلك من خلا عملية إضافة البوريل المحفزة بالـ palladium الخاص بملح المركب الوسيط aryl diazonium تحت ظروف معروفة باستخدام مواد تفاعل معروفة على سبيل المثال انظر D. M. Willis, R. M. Strongin, Tetrahedron Lett. (2000), 41, 8683-8686 وبلي ذلك التحليل المائي للمركب الوسيط boronate ester .



تعتبر مركبات aniline ذات الصيغة (N) معروفة، أو يمكن تحضيرها من مركبات معروفة وباستخدام طرق معروفة. يمكن، على سبيل المثال، تحضير aniline من الصيغة (N) من nitrobenzene من الصيغة (O) (حيث أن halogen هو chlorine أو bromine أو iodine أو halogen الكاذب مثل C₁-C₄ haloalkylsulfonate ، وبخاصة triflate) وذلك عن طريق التفاعل مع R²-B(OH)₂ aryl- or heteroaryl- boronic acid أو ملح أو إستر مناسب منه تحت ظروف Suzuki-Miyaura، أو باستخدام N-H التي تحتوي على حلقة عطرية غير متجانسة، R²-H تحت ظروف إدخال aryl عند الموضع N ، وبلي ذلك اختزال مجموعة nitro باستخدام طرق

قياسية. وبشكل بديل يمكن أن يتم أولاً اختزال مركب له الصيغة (O) إلى aniline ويتم بعد ذلك إجراء الربط المتبادل للـ aniline تحت ظروف Suzuki-Miyaura انظر، على سبيل المثال :

see, for example A. Maj, L. Delaude, A. Demonceau and A. Noels, Tetrahedron, (2007), 63, 2657-2663; F. Bellina, A. Carpita and R. Rossi, Synthesis (2004), 15, 2419-2440 and A. Suzuki, Journal of Organometallic Chemistry, (2002), 653, 83-90. ٥



تعتبر مركبات nitrobenzene الخاصة بالصيغة (O) معروفة أو يمكن تحضيرها من مركبات معروفة وباستخدام طرق معروفة.

في طريقة أخرى، يمكن أن يتم تحضير مركب له الصيغة (A) من مركب له الصيغة (P) وذلك عن طريق التفاعل مع aryl boronic acid له الصيغة (L) في وجود محفز palladium مناسب وقاعدة وبشكل مفضل في مذيب مناسب. تكون محفزات palladium المناسبة عموماً معقدات :

generally palladium(II) or palladium(0) complexes, for example palladium(II) dihalides, palladium(II) acetate, palladium(II) sulfate, bis(triphenylphosphine)palladium(II) dichloride, bis(tricyclopentylphosphine)palladium(II) dichloride, bis(tricyclohexylphosphine)palladium(II) dichloride, bis(dibenzylideneacetone)palladium(0) or tetrakis(triphenylphosphine)-palladium(0). ٥

يمكن أيضاً تحضير محفز palladium " في الموضع " من مركبات :

palladium(II) or palladium(0) وذلك عن طريق التعقيد مع المركبات الترابطية المرغوبة وذلك عن طريق، على سبيل المثال، إقتران ملح palladium(II) حتي يتم عمل معقد له مع ، على سبيل المثال :

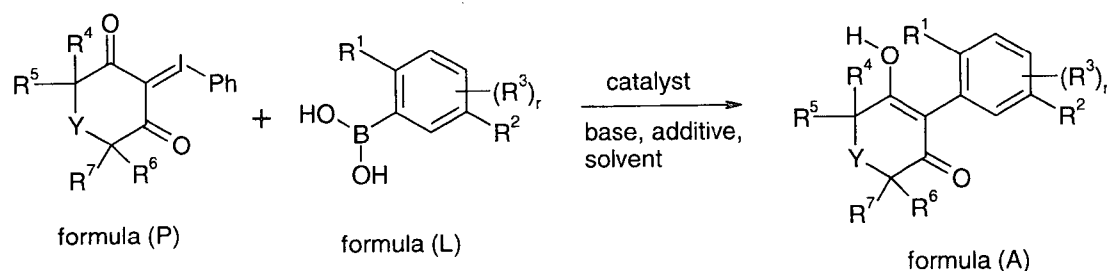
١٠ palladium(II) dichloride (PdCl_2) or palladium(II) acetate ($\text{Pd}(\text{OAc})_2$) وأيضاً مع المركب الترابطي المطلوب، على سبيل المثال :

triphenylphosphine (PPh_3), tricyclopentylphosphine or tricyclohexylphosphine والمذيب الذي تم اختياره، ومع مركب من الصيغة (P) أو مركب له الصيغة (L) وقاعدة. وأيضاً من المركبات المناسبة المركبات الترابطية ثنائية السن على سبيل المثال :

١٥ 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene or 1,2-bis(diphenylphosphino)ethane وبتسخين وسط التفاعل يتم تكوين معقد palladium(II) complex or palladium(0) المطلوب لتفاعل الإقتران C-C "في الموضع" ويتم بعد ذلك بدء تفاعل إقتران C-C.

يتم استخدام محفزات palladium في كمية من حوالي ٠.٠٠٠١ إلى ٥٠٪ مول ويفضل في كمية من ٠.١٪ إلى ١٥٪ مول، وذلك بالاعتماد على مركب الصيغة (P). يفضل أكثر أن يكون مصدر palladium هو palladium acetate ، وتكون القاعدة هي lithium hydroxide ويكون المذيب عبارة عن خليط من 1,2-dimethoxyethane وماء في نسبة من ٤ : ١ إلى ٤ : ١. يمكن أيضاً إجراء التفاعل في وجود مواد إضافة أخرى مثل أملاح tetralkylammonium ، أو على سبيل المثال

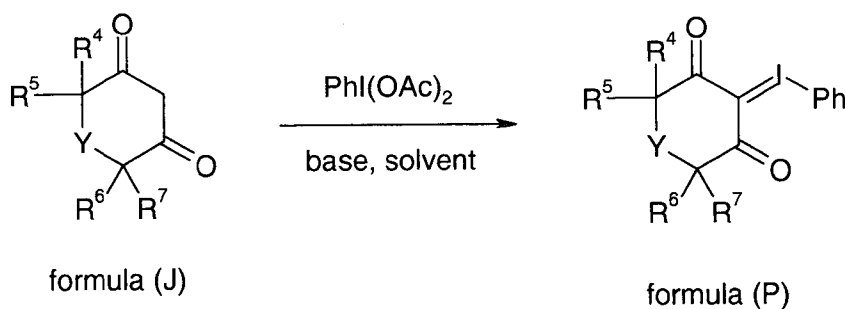
. tetrabutylammonium bromide



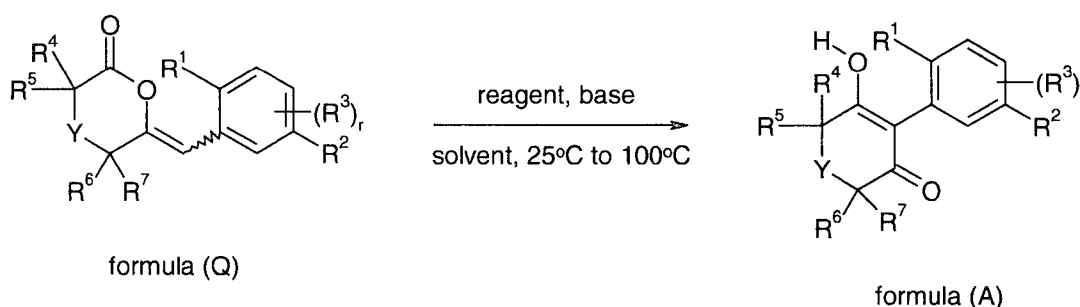
يمكن تحضير مركب له الصيغة (P) من مركب له الصيغة (J) وذلك عن طريق المعالجة باستخدام (diacetoxy)iodobenzene وذلك طبقاً لإجراءات :

of K. Schank and C. Lick, Synthesis, (1983), 392-395, or of Z Yang et al., Org. Lett., ١٠

(2002), 4 (19), 3333-3336:



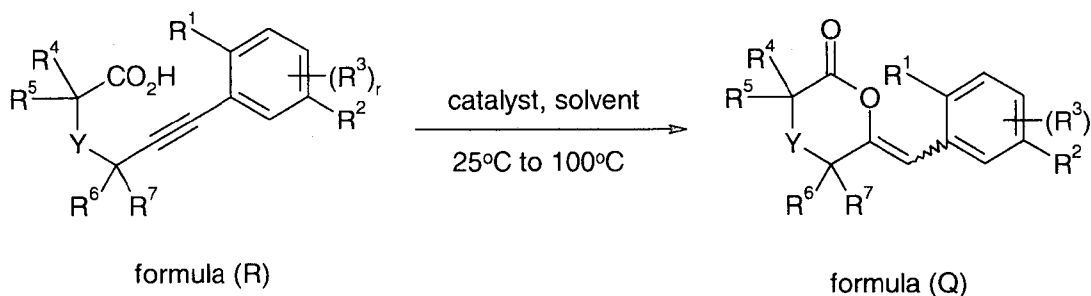
في طريقة أخرى، يمكن تحضير مركب من الصيغة (A) من خلال إعادة تنظيم مركب من الصيغة (Q)، في وجود مادة تفاعل تعمل على تعزيز إعادة التنظيم مثل alkoxide فلز (يفضل أن يكون في كمية مساوية لـ أو أكبر من ١٠٠٪ فيما يتعلق بمركب الصيغة (Q) أو cyanide anion على سبيل المثال ٠.٠٠٠١-٢٥٪ من potassium cyanide أو ٠.٠٠٠١-٢٥٪ من sodium cyanide) أو cyanohydrin (يفضل من ٠.٠٠٠١-٢٥٪ acetone cyanohydrin فيما يتعلق بمركب له الصيغة (Q)). يمكن بشكل اختياري إجراء هذا التفاعل في مذيب مناسب (على سبيل المثال acetonitrile) عند درجة حرارة مناسبة (تكون بشكل نمطي ٢٥ م - ١٠٠ م) مع قاعدة مناسبة (مثل triethylamine).



١٠ يمكن تحضير مركب له الصيغة (Q) من مركب له الصيغة (R) عن طريق المعالجة بمحفز الذي يقوم بتعزيز التخمير (مثل palladium(II) dichloride أو gold(I) chloride أو silver carbonate)، يفضل من ٠.٠٠٠١٪ - ٥٠٪ من silver carbonate فيما يتعلق بمركب من الصيغة (R)، في وجود مذيب مناسب (على سبيل المثال acetonitrile) في درجة حرارة مناسبة (تكون بشكل نمطي من ٢٥ م إلى ١٥٠ م)، وبشكل اختياري تحت ظروف من إشعاع الموجات الدقيقة. وقد عرفت ١٥ أنواع من التخميرات مشابهة في المراجع (أنظر، على سبيل المثال:

P. Huang and W. Zhou, Tetrahedron Asymmetry (1991), 2 (9), 875-878; and H. Harkat,

J-M. Weibel, P. Pale, Tetrahedron Letters (2006), 47(35), 6273-6276



يمكن تحضير مركب له الصيغة (R) عن طريق التحليل المائي لمركب له الصيغة (S) حيث

أن R' عبارة alkyl (وبشكل مفضل methyl أو ethyl)، ويمكن تحضير مركب له الصيغة (S) ٥

من مركب مركب له الصيغة (T) وذلك باستخدام طريقة إقران Sonogashira مع مركب له الصيغة

(M) في وجود محفز palladium مناسب على سبيل المثال :

bis(triphenylphosphine) palladium(II) dichloride, tetrakis(triphenylphosphine)

palladium(0) or palladium acetate

١٠ في وجود مركب ترابطي مناسب) في كمية تكون بشكل نمطي ٠.٠٠٠١-٢٥٪ من مركب له

الصيغة (T)، وبشكل مفضل في وجود محفز مشترك من النحاس (على سبيل المثال copper(I)

iodide في كمية تكون بشكل نمطي ٠.٠٠٠١ - ٥٠٪ من مركب له الصيغة (T)، وقاعدة مناسبة

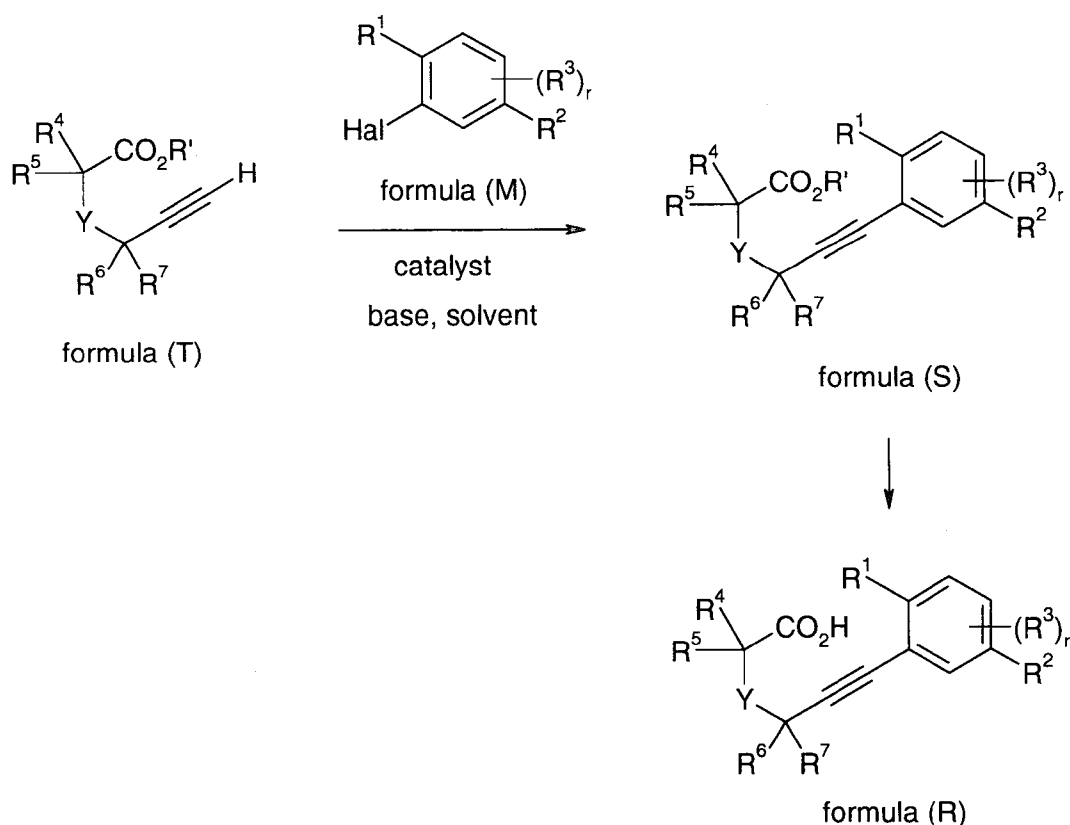
(مثل diethylamine أو triethylamine أو piperidine أو pyrrolidine) والتي يمكن ان تستخدم

أيضا كمذيب، أو بشكل اختياري في مذيب بديل مثل :

1,4-dioxane, N,N-dimethylacetamide or N,N-dimethylformamide وبشكل اختياري تحت ظروف إشعاع من الموجات الدقيقة. وقد عُرِفَت أنواع من إقران Sonogashira وذلك موجود في المراجع (انظر، على سبيل المثال:

J. Vara Prasad, F. Boyer, L. Chupak, M. Dermeyer, Q. Ding, K. Gavardinas, S. Hagen, M. Huband, W. Jiao, T. Kaneko, S. N. Maiti, M. Melnick, K. Romero, M. Patterson, X. Wu, Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters (2006), 16(20), 5392-5397, N. Leadbeater and B. Tominack, Tetrahedron Lett., (2003), 8653-8656, Z. Gan and R. Roy, Canadian Journal of Chemistry (2002), 80(8), 908-916 and K. Sonogashira, J. Organomet. Chem., (2002), 653, 46-49

١٠ والمراجع الموجودة بها .

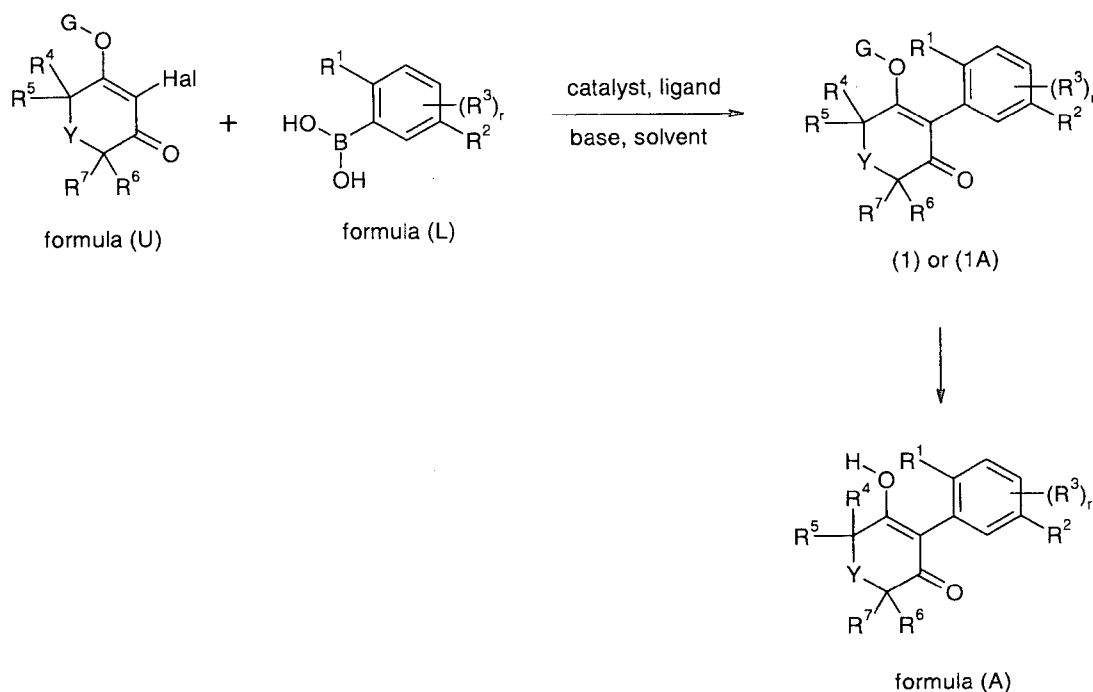


تعتبر مركبات الصيغة (T) مركبات معروفة أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق مشابهة لتلك التي تم وصفها في المراجع (انظر، على سبيل المثال :

I. Drizin et al, WO2001/066544; M. Yamamoto, Journal of Chemical Research, Synopses (1991), (7), 165; P. Machin, US 4774253; M. Morgan and E. Heyningen, J. Am. Chem Soc, (1957), 79, 422-424; N. Petiniot, A. J. Anciaux, A. F. Noels, A. J. Hubert, P. Teyssie, Tetrahedron letters, 1978,14, 1239-42, and A. F. Noels, A. Demonceau, N. Petiniot, A. J. Hubert, P. Teyssie, Tetrahedron (1982), 38(17), 2733-9

وفي طريقة أخرى، يمكن تحضير مركب له الصيغة (A) من مركب له الصيغة (1) أو (1A) (حيث G عبارة عن alkyl C_{1-4}) وذلك عن طريق التحليل المائي، وبفضل وجود محفز حمضي مثل hydrochloric acid وبشكل اختياري في وجود مذيب مناسب مثل tetrahydrofuran. يمكن تحضير مركب له الصيغة (1) أو (1A) (حيث G عبارة عن alkyl C_{1-4}) عن طريق تفاعل مركب من الصيغة (U) (حيث يفضل أن تكون G عبارة عن alkyl C_{1-4} و Hal عبارة عن halogen ويفضل أن تكون iodine ، bromine) مع boronic acid aryl له الصيغة (L) في وجود محفز palladium مناسب (على سبيل المثال ٠.٠٠١-٥٠% palladium(II) acetate وذلك فيما يتعلق بمركب (U) (وعادة (على سبيل المثال ١-١٠ من مكافئات potassium phosphate وذلك فيما يتعلق بمركب (U)) ويفضل في وجود مركب ترابطي مناسب (على سبيل المثال ٠.٠٠١-٥٠% (2-dicyclohexylphosphino)-2',6'-dimethoxybiphenyl) وذلك فيما يتعلق بالمركب (U)) وفي مذيب مناسب (على سبيل المثال toluene)، ويفضل عند درجة حرارة بين ٢٥ م ٢٠٠ م . وقد تمت معرفة إقران مشابه في المراجع (انظر، على سبيل المثال :

Y. Song, B. Kim and J.-N. Heo, Tetrahedron Letters (2005), 46 (36), 5987-5990



يمكن تحضير مركب له الصيغة (U) عن طريق إدخال halogen لمركب له الصيغة (J) وبلي ذلك أكلة الناتج الذي له الصيغة (V) مع :

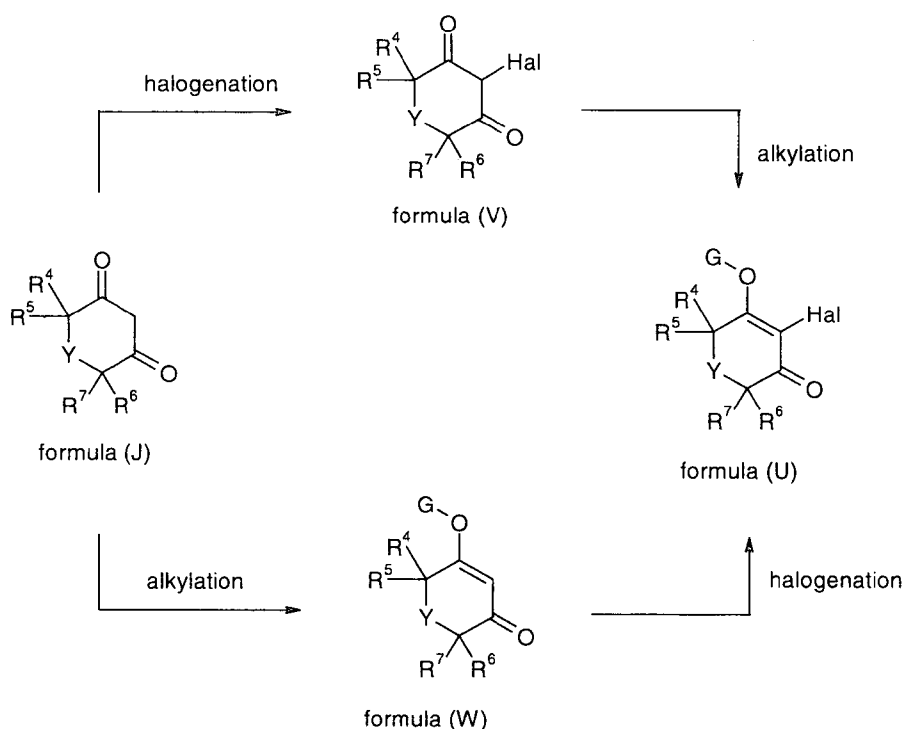
٥ C₁₋₄ alkyl halide or tri-C₁₋₄-alkylorthoformate تحت ظروف معروفة، على سبيل المثال من خلال اجراءات :

R. Shepherd and A. White (J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153-2155) and Y.-L Lin et al. (Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685-690).

وبشكل بديل، يمكن تحضير مركب له الصيغة (U) عن طريق أكلة مركب له الصيغة (J) باستخدام عامل أكلة مثل tri-C₁₋₄-alkylorthoformate وتتم عملية إدخال halogenating للإينون ١٠

الناتج الذي له الصيغة (W) تحت ظروف معروفة (انظر على سبيل المثال Y. Song, B. Kim and

(J.-N. Heo, Tetrahedron Letters (2005), 46(36), 5987-5990).



في طريقة أخرى، يمكن تحضير مركب له الصيغة (A) عن طريق تفاعل مركب له الصيغة (J)

مع مركب له الصيغة (M) في وجود محفز palladium مناسب (على سبيل المثال ٠.٠٠١-٥٠٪

palladium(II) acetate وذلك فيما يتعلق بالمركب (J)) وقاعدة (على سبيل المثال من ١ إلى ١٠

من مكافئات potassium phosphate فيما يتعلق بالمركب (J)) وبشكل مفضل في وجود مركب

ترابطي مناسب (على سبيل المثال ٠.٠٠١-٥٠٪ من :

(2-dicyclohexylphosphino)-2',4',6'-triisopropylbiphenyl فيما يتعلق بمركب له الصيغة

(J))، وفي مذيب مناسب (على سبيل المثال dioxane)، ويفضل في درجة حرارة تكون بين ٢٥ م

و ٢٠٠ م وبشكل اختياري يتم التسخين بالموجات الدقيقة. تمت معرفة إقران مشابه في المراجع

انظر، على سبيل المثال :

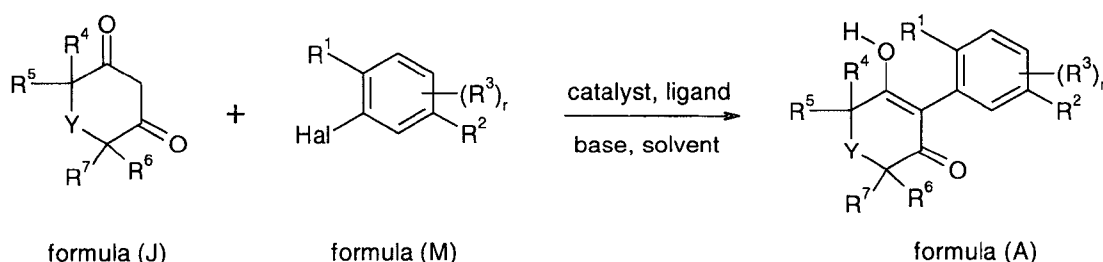
J. Fox, X. Huang, A. Chieffi, S. Buchwald, J. Am. Chem. Soc. (2000), 122,1360-1370;

B. Hong et al, WO 2005/000233)

وبشكل بديل، يمكن تحضير مركب له الصيغة (A) عن طريق تفاعل مركب له الصيغة (J) مع مركب له الصيغة (M) في وجود محفز نحاس مناسب (على سبيل المثال ٠.٠٠٠١ - ٥٠٪ copper(I) iodide وذلك فيما يتعلق بمركب (J)) وقاعدة (على سبيل المثال ١ إلى ١٠ من مكافئات cesium carbonate فيما يتعلق بمركب له الصيغة (J)) ويفضل في وجود مادة ترابيطية مناسبة (على سبيل المثال ٠.٠٠٠١ - ٥٠٪ L-proline فيما يتعلق بالمركب (J))، وفي مذيب مناسب (على سبيل المثال dimethylsulfoxide)، ويفضل أن يكون في درجة حرارة بين ٢٥ م إلى ٢٠٠ م. وقد تمت معرفة أنواع إقران أخرى من المراجع (انظر، على سبيل المثال:

Y. Jiang, N. Wu, H. Wu, M. He, Synlett, (2005), 18, 2731-2734, X. Xie, G. Cai, D. Ma, ١٠

Organic Letters (2005), 7(21), 4693-4695.



في طريقة أخرى، يمكن تحضير مركب له الصيغة (A)، من مركب له الصيغة (X) عن طريق الإقران المتبادل مع aryl أو aryl غير متجانس - halide ، R²-Hal ، حيث تكون Hal بشكل

١٥ مفضل هي chlorine أو bromine أو iodine أو halide الكاذب مثل :

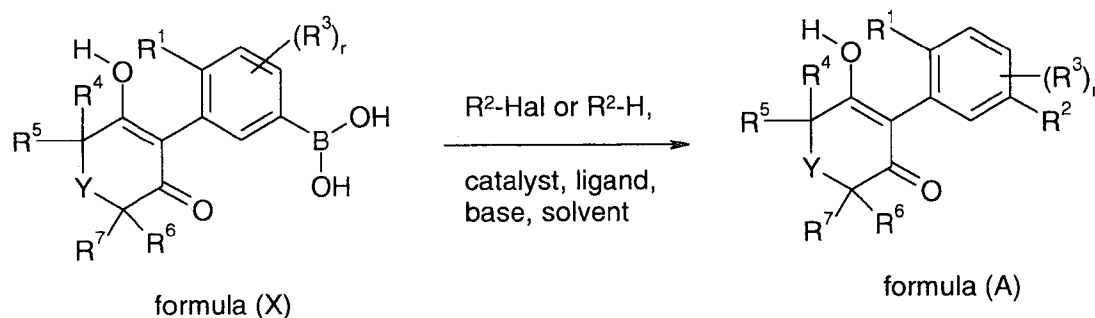
C_1 - C_4 haloalkylsulfonate ، وبشكل خاص الtriflate تحت ظروف Suzuki-Miyaura التي تم وصفها أعلاه، وعن طريق N-H المحتوية على مركب عطري غير متجانس، R^2 -H، تحت ظروف نحاس حفزي كما تم وصف ذلك عن طريق :

P. Lam et al., Tetrahedron Lett., (1998), 39 (19), 2941-2944, and P. Lam, G. Vincent, C.

G. Clark, S. Deudon, P. K. Jadhav, Tetrahedron Lett., (2001), 42, 3415-3418)

٥

تم بشكل خاص تصميم مركب له الصيغة X كمركب وسيط في تخليق مركبات الصيغة (I).



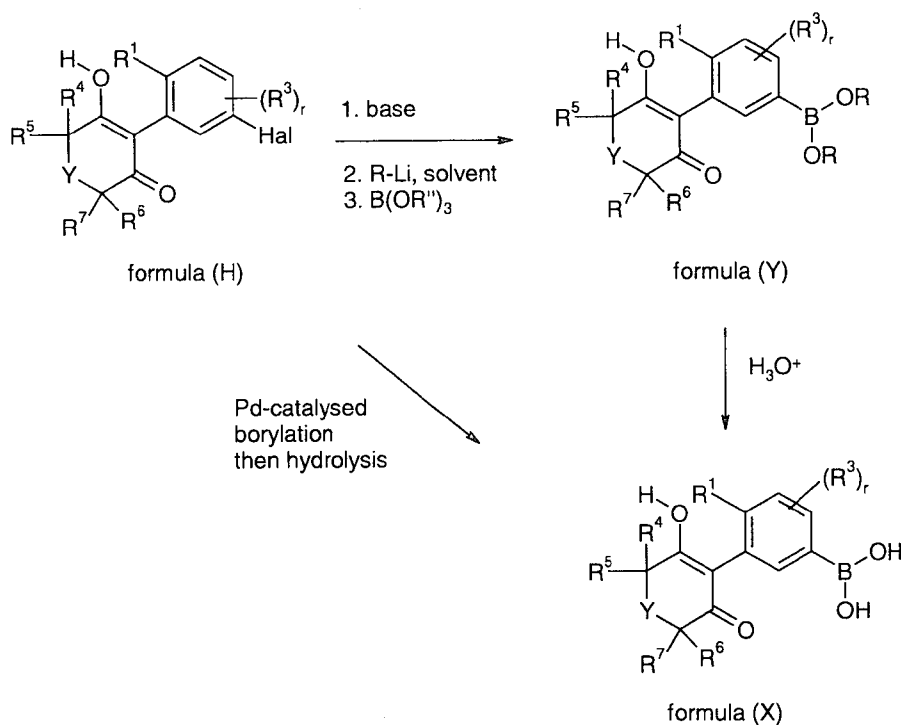
يمكن تحضير مركب له الصيغة (X) من مركب له الصيغة (H) (حيث يكون Hal بشكل مفضل عبارة عن iodine أو bromine) وذلك عن طريق المعالجة بقاعدة مناسبة (مثل sodium hydride or potassium hydride)، في مذيب مناسب (مثل tetrahydrofuran أو diethyl ether) وبلي ذلك تفاعل لتبادل فلز-halogen (وعلى نحو مفضل عن طريق المعالجة بمادة تفاعل alkyl lithium، مثل n-butyllithium أو sec-butyllithium أو tert-butyllithium أو مادة تفاعل magnesium عضوي مثل isopropyl magnesium chloride) ومعالجة تالية باستخدام trialkylborate، $B(OR'')_3$ (ويفضل trimethylborate) لكي يتم الحصول على arylboronate له الصيغة (Y).

١٠

يمكن تعريض مركب له الصيغة (Y) إلى التحليل المائي تحت ظروف حمضية لكي يتم الحصول على boronic acid له الصيغة (X). وبشكل اختياري، يمكن تحضير مركب له الصيغة (X) من

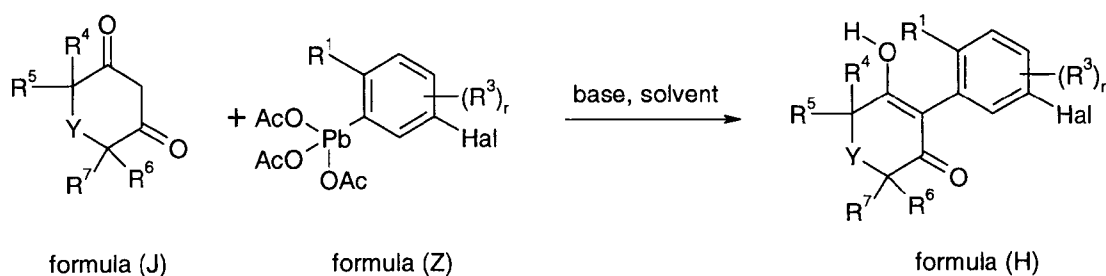
١٥

مركب له الصيغة (H) (حيث يفضل أن يكون Hal عبارة عن iodine أو bromine أو chlorine أو halide كاذب مثل C₁-C₄ haloalkylsulfonate ، وبشكل خاص triflate) تحت ظروف إدخال palladium-catalysed borylation المشابهة لتلك الظروف التي تمت الإشارة إليها في تحضير المركب الذي له الصيغة (L).



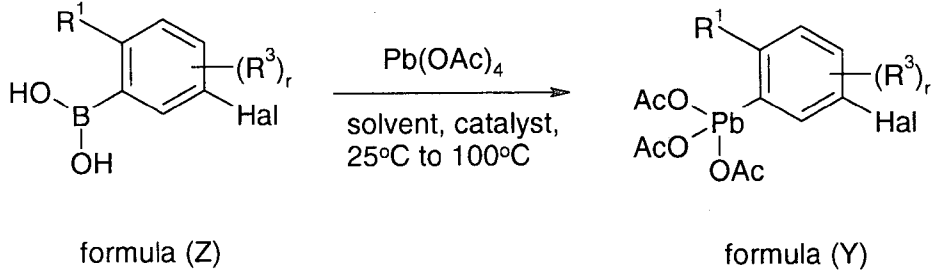
٥

يمكن تحضير مركب له الصيغة (H) كما تم وصف ذلك أعلاه. وعلى نحو بديل،، يمكن تحضير مركب له الصيغة (H) من مركب له الصيغة (J) عن طريق التفاعل مع مركب له الصيغة (Z)، تحت ظروف مشابهة لتلك الظروف المستخدمة في تحضير مركب له الصيغة (A) من مركب له الصيغة (K).



١٠

يمكن تحضير مركب له الصيغة (Z) من مركب له الصيغة (Y) وذلك باستخدام طرق مشابهة لتلك التي تم وصفها أعلاه فيما يخص تحضير مركب له الصيغة (K) من مركب له الصيغة (L).



تعتبر المركبات التي لها الصيغة (Z) مركبات معروفة (انظر، على سبيل المثال، R. Bhatt et al., US2004/0204386)، أو يمكن تحضيرها باستخدام طرق معروفة من مركبات معروفة، كما تم وصف ذلك، فعلى سبيل المثال فيما يتعلق بتحضير مركبات الصيغة (L).

يمكن استخدام مركبات الصيغة (I)، طبقاً للاختراع، كمبيدات للأعشاب في شكلها غير المعدل، كما تم الحصول عليها من عملية التخليق، ولكن يتم صياغتها بشكل خاص في تركيبات مبيدة للأعشاب وفي مجموعة مختلفة من الطرق تستخدم صيغ المواد المساعدة مثل المواد الحاملة والمذيبات والطبقات التحية التي لها سطح نشط. يمكن أن تكون الصيغ في أشكال فيزيائية مختلفة، على سبيل المثال في صورة مساحيق ترابية أو جلات أو مساحيق قابلة للترطيب أو حبيبات تنتشت في الماء أو أقراص تنتشت في الماء أو أقراص مضغوطة وفوراة أو في تراكيزات استحلابية أو في تراكيزات استحلابية دقيقة أو في شكل مستحلبات زيت في ماء أو في شكل مواد قابلة للتدفق في الزيت أو مشتتات مائية أو مشتتات زيتية أو مستحلبات معلقة أو معلقات كبسولية أو حبيبات قابلة للاستحلاب أو مواد سائلة قابلة للذوبان أو تراكيزات مائية قابلة للذوبان (مع ماء أو مذيب عضوي قابل للامتزاج مع الماء والذي يستخدم كمادة حاملة) أو في شكل أغشية بوليمرية مشبعة أو في صور أخرى معروفة من، على سبيل المثال:

Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products,
5th Edition, 1999.

يمكن استخدام تلك الصيغ إما بشكل مباشر أو تخفيفها قبل الاستخدام. يمكن تحضير الصيغ التي تم تخفيفها، على سبيل المثال، عن طريق الماء أو مواد التخصيب السائلة أو مواد التغذية الدقيقة أو المركبات العضوية البيولوجية أو الزيوت أو المذيبات. ٥

يمكن تحضير الصيغ، على سبيل المثال، عن طريق خلط مكون فعال مع مواد مساعدة في الصياغة حتى يتم الحصول على تركيبات في صورة مواد صلبة مقسمة بشكل دقيق أو حبيبات أو محاليل أو مشتتات أو مستحلبات. يمكن أيضاً صياغة المكونات النشطة باستخدام مواد مساعدة أخرى، على سبيل المثال، المواد الصلبة المقسمة بشكل دقيق، أو الزيوت الفلزية أو زيوت الخضروات أو زيوت الخضروات المعدلة أو المذيبات العضوية الطبقات التحتية ذات السطح النشط أو أي توليفات منها. يمكن تضمين المكونات الفعالة أيضاً في كبسولات دقيقة جداً مكونة من بوليمر. تشتمل الكبسولات الدقيقة على المكونات الفعالة في مادة حاملة مسامية. وهذا يُمكن من إطلاق المكونات النشطة في الوسط المحيط في كميات مُتحكم فيها (على سبيل المثال الإطلاق البطيء). عادةً ما يكون للحبيبات الدقيقة قطر من ٠.١ إلى ٥٠٠ ميكرون. وتشتمل تلك المواد على المكونات النشطة في كمية من حوالي ٢٥٪ إلى ٩٥٪ بالوزن من وزن الكبسولة. يمكن أن تتواجد المكونات النشطة في صورة مادة صلبة أحادية مدمجة، في شكل جسيمات دقيقة في مادة صلبة أو مشتت سائل أو في شكل محلول مناسب. تشتمل الأغشية الكبسولية على، على سبيل المثال، الصمغ الطبيعي أو المخلوق أو cellulose أو البوليمرات المشتركة copolymers من styrene-butadiene أو من polyacrylonitrile أو polyacrylate أو polyester أو polyamides أو

polyureas أو polyurethane أو بوليمرات تم تعديلها بشكل كيميائي ونشا زاننثات أو بوليمرات أخرى معروفة للشخص الماهر هذه النقطة من ذلك المجال. وبشكل بديل، من الممكن أن يتم صياغة الكبسولات الدقيقة جداً، حيث يكون المكون الفعال متواجداً في صورة جسيمات مشتتة في خليط مادة صلبة من مادة قاعدية، ولكن في هذه الحالة فإن الكبسولات الدقيقة لا تكون في كبسولات. ٥

عُرفت المواد المساعدة المناسبة للصياغة والمستخدمة لتحضير مركبات الاختراع في حد ذاتها. ويمكن استخدامها في شكل مواد حاملة سائلة: مثل الماء و

toluene, xylene, petroleum ether, vegetable oils, acetone, methyl ethyl ketone, cyclohexanone, acid anhydrides, acetonitrile, acetophenone, amyl acetate, 2-butanone, butylenes carbonate, chlorobenzene, cyclohexane, cyclohexanol, alkyl esters of acetic acid, diacetone alcohol, 1,2-dichloropropane, diethanolamine, p-diethylbenzene, diethylene glycol, diethylene glycol abietate, diethylene glycol butyl ether, diethylene glycol ethyl ether, diethylene glycol methyl ether, N,N-dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, 1,4-dioxane, dipropylene glycol, dipropylene glycol methyl ether, dipropylene glycol dibenzoate, diproxitol, alkylpyrrolidone, ethyl acetate, 2-ethyl hexanol, ethylene carbonate, 1,1,1-trichloroethane, 2-heptanone, alpha-pinene, d-limonene, ethyl lactate, ethylene glycol, ethylene glycol butyl ether, ethylene glycol methyl ether, gamma-butyrolactone, glycerol, glycerol acetate, glycerol diacetate, glycerol triacetate, hexadecane, hexylene glycol, isoamyl acetate, isobornyl acetate, isooctane, isophorone, ١٥

isopropylbenzene, isopropyl myristate, lactic acid, laurylamine, mesityl oxide,
methoxypropanol, methyl isoamyl ketone, methyl isobutyl ketone, methyl laurate, methyl
octanoate, methyl oleate, methylene chloride, m-xylene, n-hexane, n-octylamine,
octadecanoic acid, octylamine acetate, oleic acid, oleylamine, o-xylene, phenol,
polyethylene glycol (PEG 400), propionic acid, propyl lactate, propylene carbonate,
propylene glycol, propylene glycol methyl ether, p-xylene, toluene, triethyl phosphate,
triethylene glycol, xylenesulfonic acid, paraffin, mineral oil, trichloroethylene,
perchloroethylene, ethyl acetate, amyl acetate, butyl acetate, propylene glycol methyl
ether, diethylene glycol methyl ether, methanol, ethanol, isopropanol

١٠ و alcohols ذات الوزن الجزيئي العالي مثل :

amyl alcohol, tetrahydrofurfuryl alcohol, hexanol, octanol, ethylene glycol, propylene
glycol, glycerol, N-methyl-2-pyrrolidone.

وما شابه ذلك. يعتبر الماء عموماً هو المادة الحاملة التي يتم اختيارها لكي يتم تخفيف التركيزات.
تشتمل المواد الحاملة الصلبة المناسبة، على سبيل المثال، على :

١٥ talc, titanium dioxide, pyrophyllite clay, silica, attapulgite clay, kieselguhr, limestone,
calcium carbonate, bentonite, calcium montmorillonite,

و قشور بذرة القطن والقمح ودقيق فول الصويا والنسفة والخشب المطحون وقشور خشب الجوز
الأرضي والخشب والمواد المشابهة، كما تم وصف ذلك، على سبيل المثال، في :

. CFR 180.1001. (c) & (d)

يمكن بشكل مميز أيضاً استخدام عدد أكبر من المواد ذات السطح النشط في الصيغ السائلة أو الصلبة، وبشكل خاص في تلك التركيبات التي يمكن تخفيفها باستخدام مادة حاملة قبل أن يتم الاستخدام. يمكن أن تكون المواد ذات السطح النشط أنيونية أو كاتيونية أو غير أيونية أو بوليمرية ويمكن استخدامهم كعوامل استحلاب أو ترطيب أو تعليق أو في أغراض أخرى. تشتمل المواد ذات السطح النشط، على سبيل المثال، على أملاح من alkyl sulfates مثل :

calcium dodecyl- مثل diethanolammonium lauryl sulfate; salts of alkylarylsulfonates
tridecyl alcohol مثل alkylphenol-alkylene oxide بالإضافة
ethoxylate أو المواد الصابونية مثل sodium stearate أو أملاح alkyl naphthalenesulfonates ،
مثل sodium dibutyl naphthalenesulfonate; dialkyl esters من أملاح sulfosuccinate مثل
sorbitol oleate; quaternary مثل sodium di(2-ethylhexyl)sulfosuccinate; sorbitol esters
amines مثل lauryl trimethylammonium chloride, polyethylene glycol esters من الأحماض
fatty acids ، مثل polyethylene glycol stearate أو البوليمرات المشتركة الكتلية block
copolymers من ethylene oxide and propylene oxide وأملاح mono- and di-alkyl
phosphate esters والأيضاً المواد الأخرى التي تم وصفها على سبيل المثال في :

"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood,
New Jersey, 1981.

تشتمل المواد المساعدة التي يمكن استخدامها أيضاً في الصياغات المبيدة للحشرات على مثبطات البللورة والمواد المعدلة للزوجة وعوامل التعليق والصبغات ومضادات الأكسدة والعوامل المحدثة للرغوة و مواد الامتصاص الخفيفة ومساعدات الخلط ومضادات الرغوة وعوامل تكوين معقد و مواد الوصول للحالة المتعادلة او المواد المعدلة للرقم الهيدروجيني pH والمحاليل المنظمة ومثبطات التآكل و مواد إعطاء الرائحة وعوامل الترطيب ومحسنات الامتصاص والمواد المغذية الدقيقة والملدنات والمزلاقات و مواد التزليق والمشتتات وعوامل تصلب القوام ومضادات التجمد والمبيدات الحيوية للميكروبات وأيضاً المخصبات الصلبة والسائلة.

يمكن أن تشتمل الصياغة أيضاً على مواد إضافة فعالة، على سبيل المثال، مبيدات الأعشاب الإضافية وعوامل حفظ لمبيدات الأعشاب ومنظمات نمو النبات وقاتلات البكتيريا أو الحشرات. ٥
بالإضافة إلى ذلك، يمكن أن تشتمل التركيبات طبقاً للاختراع على مادة إضافة تتضمن زيت مأخوذ ١٠ من الخضروات أو من أصل حيواني أو زيت فلزي أو alkyl esters من تلك الزيوت أو مخلوطات من تلك الزيوت ومشتقات تلك الزيوت. تكون بشكل عام كمية مادة الإضافة الزيتية المستخدمة في التركيبة طبقاً للاختراع من ٠.٠٠١٪ إلى ١٠٪، بالاعتماد على مخلوط الرش. على سبيل المثال، يمكن إضافة مادة الإضافة الزيتية إلى خزان الرش في التركيز المطلوب بعد أن يكون قد تم ١٥ تحضير مخلوط الرش. تشتمل مواد الإضافة الزيتية المفضلة على الزيوت الفلزية أو الزيوت المأخوذة من الخضر، على سبيل المثال، زيت بذرة اللفت أو زيت الزيتون أو زيت عباد الشمس أو زيت الخضروات المستحلبة مثل :

AMIGO® (Rhone-Poulenc Canada Inc.) أو alkyl esters من زيوت الخضروات، على سبيل المثال، مشتقات methyl أو زيت من أصل حيواني مثل زيت السمك أو زيت الشحم البقري.

تشتمل مادة الإضافة المفضلة، على سبيل المثال، على مكونات فعالة والتي تكون بشكل أساسي ٨٠٪ بالوزن من alkyl esters الموجودة في زيوت السمك و ١٥٪ بالوزن من methyl esters زيت بذور اللفت وأيضاً تكون ٥٪ بالوزن من عوامل الاستحلاب ومعدلات الرقم الهيدروجيني pH . تشتمل مواد الإضافة الزيتية المفضلة بوجه خاص على alkyl esters والأحماض الدهنية fatty acids C₈-C₂₂ وبخاصة مواد الإضافة التي تعتبر مهمة مثل مواد إضافة methyl للأحماض الدهنية C₁₂-C₁₈ ، على سبيل المثال methyl esters من lauric acid, palmitic acid and oleic acid. تعرف هذه esters بأنها methyl laurate (CAS-111-82-0) و

methyl palmitate (CAS-112-39-0) and methyl oleate (CAS-112-62-9).

يعتبر Emery® 2230 and 2231 (Cognis GmbH) مشتق methyl ester مفضل لحمض دهني.

١٠ وقد عرفت هذه المشتقات ومشتقات زيوت أخرى من :

Compendium of Herbicide Adjuvants, 5th Edition, Southern Illinois University, 2000

يمكن أيضاً تحسين وضع ونشاط مواد الإضافة الزيتية عن طريق دمجها مع مواد ذات سطح نشط مثل المواد الخافضة للتوتر السطحي non-ionic أو anionic أو cationic . على سبيل المثال، تم

ذكر المواد الخافضة للتوتر السطحي anionic و non-ionic و cationic المناسبة في قائمة في

١٥ الصفحات أرقام ٧ و ٨ في الطلب الدولي رقم ٩٧/٣٤٤٨٥. تكون المواد ذات السطح النشط

المفضلة هي المواد الخافضة للسطح anionic من نوع dodecyl-benzylsulfonate ، وبشكل

خاص أملاح calcium منها، و أيضاً المواد الخافضة للتوتر السطحي non-ionic من نوع fatty

alcohol ethoxylate . يفضل على نحو خاص alcohols الدهنية C₁₂-C₂₂ والتي لها درجة من

الارتباط بمجموعة ethoxylation من ٥ إلى ٤٠. تشتمل أمثلة المواد الخافضة للتوتر السطحي المتاحة تجارياً على أنواع Genapol (Clariant AG). يفضل أيضاً المواد الخافضة للتوتر السطحي من silicone ، وبشكل خاص polyalkyl-oxide-modified heptamethyltrisiloxanes المعدل وهو المتاح تجارياً ، على سبيل المثال، باسم Silwet L-77®، وأيضاً المواد الخافضة للتوتر السطحي المعالجة بفوق fluorine . يكون تركيز المواد ذات السطح النشط فيما يخص مادة الإضافة الكلية بشكل عام من ١ إلى ٣٠٪ بالوزن. تشتمل أمثلة مواد الإضافة الزيتية على مخلوطات من الزيوت أو الزيوت الفلزية أو مشتقات منها مع مواد خافضة للتوتر السطحي والتي تكون Edenor ME وSU® (Syngenta AG, CH) و Turbocharge® (BP Oil UK Limited, GB) و Actipron® .

يمكن أن تستخدم المواد ذات السطح النشط المذكورة أيضاً في صيغ بمفردها، أي بدون مواد الإضافة الزيتية. ١٠

وبالإضافة إلى ذلك، يمكن أن تسهم إضافة المذيب العضوي إلى مادة الإضافة الزيتية/مخلوط المادة الخافضة للتوتر السطحي في التحسين الإضافي للفاعلية. تكون المذيبات المناسبة عبارة عن، على سبيل المثال، Solvesso® (ESSO) و Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). يمكن أن يكون تركيز هذه المذيبات من ١٠٪ إلى ٨٠٪ بالوزن من الوزن الكلي. وتم وصف مواد الإضافة الزيتية هذه، والتي يمكن أن تكون في مخلوط مع مذيبات، على سبيل المثال، في البراءة الأمريكية رقم ٤٨٣٤٩٠٨-أ .. تُعرف مادة الإضافة المتاحة تجارياً التي تم الكشف عنها في هذه الوثيقة تحت اسم MERGE® (BASF Corporation). يفضل من مواد الإضافة الزيتية طبقاً للاختراع الحالي أيضاً مادة (SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada. .

وبالإضافة إلى المواد الزيتية التي تم ذكرها أعلاه، وذلك لكي يتم تحسين فاعلية التركيبة الخاصة بالاختراع فمن الممكن صياغة مركبات alkylpyrrolidones (على سبيل المثال Agrimax®) ويمكن إضافتها إلى مخلوط الرش. يمكن أيضاً استخدام صيغ مواد اللكتيك المخلفة مثل ، على سبيل المثال، polyacrylamide, polyvinyl compounds or poly-1-p-menthene (على سبيل المثال Bond®, Courier® or Emerald®). يمكن أيضاً خلط المحاليل التي تحتوي على propionic acid ، على سبيل المثال Eurogkem Pen-e-trate® ، في مخلوط الرش كعوامل محسنة للفاعلية.

تشتمل التركيبات المبيدة للأعشاب عموماً على من ٠.٠٠١٪ إلى ٩٩٪ بالوزن، وبشكل خاص من ٠.١ إلى ٩٥٪ بالوزن، من مركب الصيغة (I) ومن ١ إلى ٩٩.٩٪ بالوزن من صيغة المادة المساعدة، والتي يُفضل أن تشتمل على من صفر وحتى ٢٥٪ بالوزن من المادة ذات السطح النشط. بينما يفضل أن تتم صياغة المنتجات التجارية بشكل مركز لأن المستخدم النهائي سوف يستخدم صيغ التخفيف.

يمكن أن يختلف معدل الوضع الخاص بمركبات الصيغة (I) في نطاق حدود عريضة ويعتمد ذلك على طبيعة التربة والطريقة المستخدمة في الوضع (قبل-أو بعد الإنبات أو تغطية البذور أو الوضع في الشق المخصص للبذور أو الوضع أثناء الحرث، إلخ) أو نوع المحصول المخصص أو الأعشاب أو الحشائش التي يتم التحكم فيها، وأيضاً يعتمد على ظروف المناخ والعوامل الأخرى التي يتم التحكم فيها من خلال طريقة الوضع، وأيضاً وقت الوضع والمحصول المستهدف. يتم بشكل عام وضع مركبات الصيغة (I) الخاصة بالاختراع في معدل من ٤٠٠٠ جم/هكتار، وبشكل خاص من ٥ إلى ١٠٠٠ جم/هكتار.

تكون للصيغ المفضلة التركيبات التالية:

(% = نسبة مئوية بالوزن)

التركيزات الاستحلابية

المكون الفعال: من ١ إلى ٩٥ ، ويفضل من ٦٠ إلى ٩٠ %.

٥ عامل ذو سطح نشط: من ١ إلى ٣٠ % ، ويفضل من ٥ إلى ٢٠ %

المادة الحاملة السائلة: ١ إلى ٨٠ %، من المفضل ١ إلى ٣٥ %

الأنثريه:

المكون الفعال: ٠.١ إلى ١٠ %، من المفضل ٠.١ إلى ٥ %

المادة الحاملة الصلبة: ٩٩.٩ إلى ٩٠ %، من المفضل ٩٩.٩ إلى ٩٩ %

١٠ تركيزات المعلاقات:

المكون الفعال: ٥ إلى ٧٥ %، من المفضل ١٠ إلى ٥٠ %

ماء : ٩٤ إلى ٢٤ %، من المفضل ٨٨ إلى ٣٠ %

العوامل السطحية الفعالة: ١ إلى ٤٠ %، من المفضل ٢ إلى ٣٠ %

المساحيق القابلة للترطيب:

١٥ المكون الفعال: ٠.٥ إلى ٩٠ %، من المفضل ١ إلى ٨٠ %

العوامل السطحية الفعالة: ٠.٥ إلى ٢٠ ٪، من المفضل ١ إلى ١٥ ٪

المادة الحاملة الصلبة: ٥ إلى ٩٥ ٪، من المفضل ١٥ إلى ٩٠ ٪

الحبيبات:

المكون الفعال: ٠.١ إلى ٣٠ ٪، من المفضل ٠.١ إلى ١٥ ٪

٥ المادة الحاملة الصلبة: ٩٩.٥ إلى ٧٠ ٪، من المفضل ٩٧ إلى ٨٥ ٪

توضح الأمثلة التالية الاختراع بشكل أكبر، لكنها لا تقيده.

(د)	(ج)	(ب)	(أ)	F1 التركيزات القابلة للاستحلاب
٪٩٠	٪٥٠	٪١٠	٪	المكون الفعال
٪٨	٪٦	٪٨	٪٦	calcium dodecylbenzene-sulfonate
٪٤	٪٤	-	٪٤	polyglycol ether زيت الخروع (٣٦ مول من ethylene oxide)
٪٢	-	٪٤	-	polyglycol ether octylphenol (٧-٨ مول ethylene oxide)
٪٢٠	٪١٠	-	-	NMP
٪١٦	٪٥٥	٪٧٨	٪٨٥	خليط هيدروكربونات عطرية C ₁₂ -C ₉

يمكن تحضير المستحلبات بأي تركيز من هذه التركيزات من خلال التخفيف بالماء

المحاليل F2	(أ)	(ب)	(ج)	(د)
المكون الفعال	%٥	%١٠	%٢٥	%٥٠
1-methoxy-3-(3-methoxy-propoxy)-propane	-	%٢٠	%٢٠	-
polyethylene glycol الوزن الجزيئي ٤٠٠	%٢٠	%١٠	-	-
NMP	-	-	%٣٠	%١٠
خليط هيدروكربونات عطرية C ₁₂ -C ₉	%٧٥	%٦٠	-	-

تعتبر المحاليل مناسبة للاستخدام في صورة نقاط دقيقة

المساحيق القابلة للترطيب F3	(أ)	(ب)	(ج)	(د)
المكون الفعال	%٥	%٢٥	%٥٠	%٨٠
sodium lignosulfonate	%٤	-	%٣	-
sodium lauryl sulfate	%٢	%٣	-	%٤
sodium diisobutylphenylene-sulfonate	-	%٦	%٥	%٦
octylphenol polyglycol ether (٧ - ٨ مول ethylene oxide)	-	%١	%٢	-

silicic acid عالي التشتت	%١	%٣	%٥	%١٠
kaolin	٨٨ %	%٦٢	%٣٥	-

يتم خلط المكون الفعال جيداً بالمواد المساعدة ويتم طحن الخليط بالكامل في مطحنة مناسبة، مما أدى إلى الحصول على مساحيق قابلة للتطبيب يمكن تخفيفها بالماء للحصول على معلقات بأي تركيز مرغوب فيه

الحبيبات المغلفة F4	(أ)	(ب)	(ج)
المكون الفعال	%٠.١	%٥	%١٥
silicic acid عالي التشتت	%٠.٩	%٢	%٣
مادة حاملة غير عضوية (قطر ٠.١ - ١ مم) على سبيل المثال CaCO ₃ أو SiO ₂	%٩٩	%٩٣	%٨٣

٥ تتم إذابة المكون الفعال في methylene chloride ، ويتم رش المحلول على المادة الحاملة ويتم بعد ذلك تبخير المذيب في وسط مفرغ.

الحبيبات المغلفة F5	(أ)	(ب)	(ج)
المكون الفعال	%٠.١	%٥	%١٥

٣%	٢%	١.٠%	MW 200 polyethylene glycol
٢%	١%	٠.٩%	silicic acid عالي التشتت
٨٠%	٩٢%	٩٨.٠%	مادة حاملة غير عضوية (قطر ٠.١ - ١ مم) على سبيل المثال SiO ₂ أو CaCO ₃

يتم وضع المكون الفعال المطحون إلى جسيمات دقيقة بانتظام، في خلائط ، على المادة الحاملة المرطبة باستخدام polyethylene glycol . يتم الحصول على الحبيبات المغلفة التي ليست في صورة غبار بهذه الطريقة.

الحبيبات F6 المتحصل عليها باليثق	(أ)	(ب)	(ج)	(د)
المكون الفعال	٠.١%	٣%	٥%	١٥%
sodium lignosulfonate	١.٥%	٢%	٣%	٤%
carboxymethylcellulose	١.٤%	٢%	٢%	٢%
kaolin	٩٧%	٩٣%	٩٠%	٧٩%

٥ يتم خلط المكون الفعال وطحنه مع المواد المساعدة ويتم ترطيب الخليط بالماء. يتم بثق الخليط الناتج ثم يتم تجفيفه في تيار من الهواء.

الأثرية F7	(أ)	(ب)	(ج)
المكون الفعال	%٠.١	%١	%٥
التلك	%٣٩.٩	%٤٩	%٣٥
kaolin	%٦٠.٠	%٥٠	%٦٠

يتم الحصول على الأثرية الجاهزة للاستخدام بخلط المكون الفعال مع المواد الحاملة وطحن الخليط في مطحنة مناسبة.

تركيزات المعلقات F8	(أ)	(ب)	(ج)	(د)
المكون الفعال	%٣	%١٠	%٢٥	%٥٠
ethylene glycol	%٥	%٥	%٥	%٥
nonylphenol polyglycol ether (١٥ مول من ethylene oxide)	-	%١	%٢	-
sodium lignosulfonate	%٣	%٣	%٤	%٥
carboxymethylcellulose	%١	%١	%١	%١
formaldehyde محلول مائي ٣٧%	%٠.٢	%٠.٢	%٠.٢	%٠.٢
silicone مستحلب في الزيت	%٠.٨	%٠.٨	%٠.٨	%٠.٨
ماء	%٨٧	%٧٩	%٦٢	%٣٨

يتم خلط المكون الفعال المطحون إلى جسيمات دقيقة خلطاً جيداً مع المواد المساعدة، مما يؤدي إلى الحصول على تركيز معلق يمكن منه تحضير معلقات لها أي تركيز من خلال التخفيف بالماء.

يتعلق الاختراع أيضاً بطريقة للمكافحة الانتقائية للحشائش والأعشاب في محاصيل النباتات المفيدة، حيث تشتمل على معالجة النباتات المفيدة أو المنطقة المزروعة أو موضع منها بمركب له الصيغة ٥
I.

تضم محاصيل النباتات المفيدة التي يمكن استخدام التركيبات وفقاً للاختراع الحالي معها الغلال، القطن، فول الصويا، بنجر السكر، قصب السكر، نباتات المزرعة، rape، الذرة والأرز، وكذلك المكافحة غير الانتقائية للأعشاب. وتعتبر التركيبات وفقاً للاختراع مفيدة بشكل خاص للمكافحة الانتقائية للحشائش والأعشاب في الغلال، الذرة والأرز، وخصوصاً الأرز. وينبغي فهم اصطلاح ١٠ "المحاصيل" على أنه يضم أيضاً المحاصيل التي صارت تتحمل مبيدات الأعشاب أو فئات مبيدات الأعشاب (على سبيل المثال ALS، GS، EPSPS، PPO، ACCase ومثبطات HPPD) كنتيجة للطرق التقليدية في الزراعة أو الهندسة الوراثية. يتمثل أحد الأمثلة على المحاصيل التي صارت تتحمل، على سبيل المثال، مركبات imidazolinones، مثل imazamox، بالطرق التقليدية في ١٥ الزراعة في Clearfield® summer rape (Canola). كما تضم الأمثلة على المحاصيل التي صارت مقاومة لمبيدات الأعشاب من خلال طرق الهندسة الوراثية على سبيل المثال أنواع الذرة المقاومة للجليفوسات والجلوفوسينات المتوفرة تجارياً بالاسمين التجاريين RoundupReady® و LibertyLink®. وقد تكون الأعشاب التي ستتم مكافحتها أعشاباً وحيدة الفلقة وأعشاباً من ذوات الفلقتين، مثل، على سبيل المثال :

،Lolium ،Sinapis ،Setaria ،Avena ،Digitaria ،Agrostis ،Nasturtium ،Stellaria
،Alopecurus ،Bromus ،Sagittaria ،Monochoria ،Scirpus ،Echinochloa ،Solanum
،Amaranthus ،Xanthium ،Sida ،Abutilon ،Cyperus ،Rottboellia ،Sorghum
،Veronica و Viola ،Galium ،Chrysanthemum ،Ipomoea ،Chenopodium

- ٥ وينبغي أيضاً فهم المحاصيل على أنها تلك المحاصيل التي صارت مقاومة للحشرات الضارة من خلال طرق الهندسة الوراثية، على سبيل المثال الذرة Bt (مقاومة لحفر الذرة الأوروبي)، قطن Bt (مقاوم لدودة لوز القطن) وكذلك بطاطس Bt (المقاومة لخنفساء Colorado). الأمثلة على ذرة Bt هي أنواع ذرة Bt-176 المهجنة من NK® (Syngenta Seeds). Bt toxin عبارة عن بروتين يتم تكوينه بشكل طبيعي بواسطة بكتيريا التربة *Bacillus thuringiensis soil bacteria*. ويتم إعطاء أمثلة على الـ Bt toxin على الذيفانات والنباتات عبر الجينية القادرة على تخليق مثل هذه الذيفانات في براءتي الاختراع الأوروبيتين رقمي ٥٤١٨٧٨-أ، و ٣٧٤٧٥٣-أ، طلبات براءات الاختراع الدولية أرقام ٠٧٢٧٨ / ٩٣ و ٩٥/٣٤٦٥٦، و ٠٣/٠٥٢٠٧٣، وبراءة الاختراع الأوروبية رقم ٤٢٧٥٢٩ - أ. الأمثلة على النباتات عبر الجينية المحتوية على جين واحد أو أكثر يشفر مقاومة لمبيدات الآفات ويعبر عن toxin واحد أو أكثر KnockOut® (الذرة)، Yield Gard® (الذرة)، NuCOTIN33B® (القطن)، Bollgard® (القطن)، NewLeaf® (البطاطس)، NatureGard® و Protexcta®. ومن الممكن أن تكون نباتات المحاصيل ومادة بذورها مقاومة لمبيدات الأعشاب وتكون مقاومة في الوقت نفسه أيضاً لتغذية الحشرات (الأحداث عبر الجينية "المكدسة"). يمكن أن يكون للبذور، على سبيل المثال، القدرة على التعبير عن بروتين Cry3 الفعال من ناحية مكافحة الحشرات وفي نفس الوقت يحتمل glyphosate-tolerant. وينبغي فهم كلمة "المحاصيل" على أنها تضم أيضاً المحاصيل التي يتم الحصول عليها كنتيجة للطرق التقليدية في الزراعة أو الهندسة الوراثية التي
- ١٥
- ٢٠

تحتوى على ما يسمى بمخرجات الصفات (على سبيل المثال الطعم المحسن، الاستقرار في التخزين، المحتوى المغذي).

وينبغي فهم المناطق المزروعة على أنها تضم الأراضي التي تتم فيها زراعة نباتات المحاصيل بالفعل بالإضافة إلى الأراضي المراد زراعة محاصيل النباتات هذه بها.

٥ ومن الممكن أيضاً استخدام المركبات التي لها الصيغة I وفقاً للاختراع الحالي في توليفة مع مبيدات أعشاب أخرى. وتعتبر الخلائط التالية من المركب الذي له الصيغة I مهمة بشكل خاص. وبشكل مفضل، في هذه الخلائط، يكون المركب الذي له الصيغة I عبارة عن واحد من المركبات المذكورة في الجداول ١ إلى ٢٩٤ أدناه:

المركب الذي له الصيغ :

١٠ I + acetochlor, I + acifluorfen, I + acifluorfen-sodium, I + aclonifen, I + acrolein, I + alachlor, I + alloxydim, I + allyl alcohol, I + ametryn, I + amicarbazone, I + amidosulfuron, I + aminopyralid, I + amitrole, I + ammonium sulfamate, I + anilofos, I + asulam, I + atrazine, formula I + aviglycine, formula I + azafenidin, I + azimsulfuron, I + BCPC, I + beflubutamid, I + benazolin, formula I + bencarbazone, I + benfluralin, I + benfuresate, I + bensulfuron, I + bensulfuron-methyl, I + bensulide, ١٥ I + bentazone, I + benzfendizone, I + benzobicyclon, I + benzofenap, I + bifenox, I + bilanafos, I + bispyribac, I + bispyribac-sodium, I + borax, I + bromacil, I + bromobutide, formula I + bromophenoxim, I + bromoxynil, I + butachlor, I +

butafenacil, I + butamifos, I + butralin, I + butroxydim, I + butylate, I + cacodylic
acid, I + calcium chlorate, I + cafenstrole, I + carbetamide, I + carfentrazone, I +
carfentrazone-ethyl, I + CDEA, I + CEPC, I + chlorflurenol, I + chlorflurenol-methyl,
I + chloridazon, I + chlorimuron, I + chlorimuron-ethyl, I + chloroacetic acid, I +
chlorotoluron, I + chlorpropham, I + chlorsulfuron, I + chlorthal, I + chlorthal-
dimethyl, I + cinidon-ethyl, I + cinmethylin, I + cinosulfuron, I + cisanilide, I +
clethodim, I + clodinafop, I + clodinafop-propargyl, I + clomazone, I + clomeprop, I +
clopyralid, I + cloransulam, I + cloransulam-methyl, I + CMA, I + 4-CPB, I + CPMF,
I + 4-CPP, I + CPPC, I + cresol, I + cumyluron, I + cyanamide, I + cyanazine, I +
cycloate, I + cyclosulfamuron, I + cycloxydim, I + cyhalofop, I + cyhalofop-butyl, I +
2,4-D, I + 3,4-DA, I + daimuron, I + dalapon, I + dazomet, I + 2,4-DB, I + 3,4-DB, I
+ 2,4-DEB, I + desmedipham, formula I + desmetryn, I + dicamba, I + dichlobenil, I +
ortho-dichlorobenzene, I + para-dichlorobenzene, I + dichlorprop, I + dichlorprop-P, I
+ diclofop, I + diclofop-methyl, I + diclosulam, I + difenzoquat, I + difenzoquat
metilsulfate, I + diflufenican, I + diflufenzopyr, I + dimefuron, I + dimepiperate, I +
dimethachlor, I + dimethametryn, I + dimethenamid, I + dimethenamid-P, I +
dimethipin, I + dimethylarsinic acid, I + dinitramine, I + dinoterb, I + diphenamid,
formula I + dipropetryn, I + diquat, I + diquat dibromide, I + dithiopyr, I + diuron, I +
DNOC, I + 3,4-DP, I + DSMA, I + EBEP, I + endothal, I + EPTC, I + esprocarb, I +
ethalfluralin, I + ethametsulfuron, I + ethametsulfuron-methyl, formula I + ethephon, I
+ ethofumesate, I + ethoxyfen, I + ethoxysulfuron, I + etobenzanid, I + fenoxaprop-P,

I + fenoxaprop-P-ethyl, I + fentrazamide, I + ferrous sulfate, I + flamprop-M, I + flazasulfuron, I + florasulam, I + fluazifop, I + fluazifop-butyl, I + fluazifop-P, I + fluazifop-P-butyl, formula I + fluazolate, I + flucarbazone, I + flucarbazone-sodium, I + flucetosulfuron, I + fluchloralin, I + flufenacet, I + flufenpyr, I + flufenpyr-ethyl, formula I + flumetralin, I + flumetsulam, I + flumiclorac, I + flumiclorac-pentyl, I + flumioxazin, formula I + flumipropin, I + fluometuron, I + fluoroglycofen, I + fluoroglycofen-ethyl, formula I + fluoxaprop, formula I + flupoxam, formula I + flupropacil, I + flupropanate, I + flupyrsulfuron, I + flupyrsulfuron-methyl-sodium, I + flurenol, I + fluridone, I + flurochloridone, I + fluroxypyr, I + flurtamone, I + fluthiacet, I + fluthiacet-methyl, I + fomesafen, I + foramsulfuron, I + fosamine, I + glufosinate, I + glufosinate-ammonium, I + glyphosate, I + halosulfuron, I + halosulfuron-methyl, I + haloxyfop, I + haloxyfop-P, I + HC-252, I + hexazinone, I + imazamethabenz, I + imazamethabenz-methyl, I + imazamox, I + imazapic, I + imazapyr, I + imazaquin, I + imazethapyr, I + imazosulfuron, I + indanofan, I + iodomethane, I + iodosulfuron, I + iodosulfuron-methyl-sodium, I + ioxynil, I + isoproturon, I + isouron, I + isoxaben, I + isoxachlortole, I + isoxaflutole, formula I + isoxapyrifop, I + karbutilate, I + lactofen, I + lenacil, I + linuron, I + MAA, I + MAMA, I + MCPA, I + MCPA-thioethyl, I + MCPB, I + mecoprop, I + mecoprop-P, I + mefenacet, I + mefluidide, I + mesosulfuron, I + mesosulfuron-methyl, I + mesotrione, I + metam, I + metamifop, I + metamidron, I + metazachlor, I + methabenzthiazuron, formula I + methazole, I + methylarsonic acid, I + methyldymron,

I + methyl isothiocyanate, I + metobenzuron, formula I + metobromuron, I +
metolachlor, I + S-metolachlor, I + metosulam, I + metoxuron, I + metribuzin, I +
metsulfuron, I + metsulfuron-methyl, I + MK-616, I + molinate, I + monolinuron, I +
MSMA, I + naproanilide, I + napropamide, I + naptalam, formula I + NDA-402989, I
+ neburon, I + nicosulfuron, formula I + nipyraclufen, formula I + n-methyl glyphosate, ٥
I + nonanoic acid, I + norflurazon, I + oleic acid (fatty acids), I + orbencarb, I +
orthosulfamuron, I + oryzalin, I + oxadiargyl, I + oxadiazon, I + oxasulfuron, I +
oxaziclomefone, I + oxyfluorfen, I + paraquat, I + paraquat dichloride, I + pebulate, I
+ pendimethalin, I + penoxsulam, I + pentachlorophenol, I + pentanochlor, I +
pentoxazone, I + pethoxamid, I + petroleum oils, I + phenmedipham, I + ١٠
phenmedipham-ethyl, I + picloram, I + picolinafen, I + pinoxaden, I + piperophos, I +
potassium arsenite, I + potassium azide, I + pretilachlor, I + primisulfuron, I +
primisulfuron-methyl, I + prodiamine, I + profluazol, I + profoxydim, formula I +
prohexadione-calcium, I + prometon, I + prometryn, I + propachlor, I + propanil, I +
propaquizafop, I + propazine, I + propham, I + propisochlor, I + propoxycarbazone, I ١٥
+ propoxycarbazone-sodium, I + propyzamide, I + prosulfocarb, I + prosulfuron, I +
pyraclonil, I + pyraflufen, I + pyraflufen-ethyl, formula I + pyrasulfotole, I +
pyrazolynate, I + pyrazosulfuron, I + pyrazosulfuron-ethyl, I + pyrazoxyfen, I +
pyribenzoxim, I + pyributicarb, I + pyridafol, I + pyridate, I + pyriftalid, I +
pyriminobac, I + pyriminobac-methyl, I + pyrimisulfan, I + pyriothiobac, I + ٢٠
pyriothiobac-sodium, formula I + pyroxasulfone (KIH-485), formula I + pyroxulam, I +

quinclorac, I + quinmerac, I + quinclamine, I + quizalofop, I + quizalofop-P, I + rimsulfuron, I + sethoxydim, I + siduron, I + simazine, I + simetryn, I + SMA, I + sodium arsenite, I + sodium azide, I + sodium chlorate, I + sulcotrione, I + sulfentrazone, I + sulfometuron, I + sulfometuron-methyl, I + sulfosate, I + sulfosulfuron, I + sulfuric acid, I + tar oils, I + 2,3,6-TBA, I + TCA, I + TCA-sodium, formula I + tebutam, I + tebuthiuron, formula I + tefuryltrione, I + tembotrione, I + tepraloxym, I + terbacil, I + terbutryn, I + terbutrylazine, I + terbutryl, I + thenylchlor, I + thiazafluron, I + thiazopyr, I + thifensulfuron, I + thiencarbazone, I + thifensulfuron-methyl, I + thiobencarb, I + tiocarbazil, I + topramezone, I + tralkoxydim, I + tri-allate, I + triasulfuron, I + triaziflam, I + tribenuron, I + tribenuron-methyl, I + tricamba, I + triclopyr, I + trietazine, I + trifloxysulfuron, I + trifloxysulfuron-sodium, I + trifluralin, I + triflusulfuron, I + triflusulfuron-methyl, I + trihydroxytriazine, I + trinexapac-ethyl, I + tritosulfuron, I + [3-[2-chloro-4-fluoro-5-(1-methyl-6-trifluoromethyl-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-3-yl)phenoxy]-2-pyridyloxy]acetic acid ethyl ester (CAS RN 353292-31-6), I + 4-hydroxy-3-[[2-[(2-methoxyethoxy)methyl]-6-(trifluoromethyl)-3-pyridinyl]carbonyl]-bicyclo[3.2.1]oct-3-en-2-one (CAS RN 352010-68-5), I + 2-chloro-5-[3,6-dihydro-3-methyl-2,6-dioxo-4-(trifluoromethyl)-1(2H)-pyrimidinyl]-4-fluoro-N-[[methyl(1-methylethyl)amino]sulfonyl]benzamide (CAS RN 372137-35-4), and I + 4-hydroxy-3-[[2-(3-methoxypropyl)-6-(difluoromethyl)-3-pyridinyl]carbonyl]bicyclo[3.2.1]oct-3-en-2-one.

وقد تكون المكونات التي تم خلطها مع المركب الذي له الصيغة I أيضاً في صورة إسترات أو أملاح، على النحو الموضح على سبيل المثال في 2000 (BCPC) 12th Edition The Pesticide Manual.

ومن الممكن أيضاً استخدام المركبات التي لها الصيغة (I) وفقاً للاختراع في توليفة مع مواد حماية. ومن المفضل، في هذه الخلطات، أن يكون المركب الذي له الصيغة (I) واحداً من المركبات المذكورة في الجداول ١ إلى ٢٩٤ الموضحة أدناه. تضم الخلطات التي بها مواد حماية، بشكل خاص، ما يلي:

المركب الذي له الصيغة :

(I) + cloquintocet-mexyl, (I) + cloquintocet acid and salts thereof, (I) + fenchlorazole-ethyl, (I) + fenchlorazole acid and salts thereof, (I) + mefenpyr-diethyl, (I) + mefenpyr diacid, (I) + isoxadifen-ethyl, (I) + isoxadifen acid, (I) + furilazole, (I) + furilazole R isomer, (I) + benoxacor, (I) + dichlormid, (I) + AD-67, (I) + oxabetrinil, (I) + cyometrinil, (I) + cyometrinil Z-isomer, (I) + fenclorim, (I) + cyprosulfamide, (I) + naphthalic anhydride, (I) + flurazole, (I) + N-(2-methoxybenzoyl)-4-[(methylaminocarbonyl)amino]benzenesulfonamide, (I) + CL 304,415, (I) + dicyclonon, (I) + fluxofenim, (I) + DKA-24, (I) + R-29148 and (I) + PPG-1292. A safening effect can also be observed for the mixtures compound of the formula (I) + dymron, compound of the formula (I) + MCPA, compound of the formula (I) + mecoprop and compound of the formula (I) + mecoprop-P.

ويتم توضيح مواد الحماية ومبيدات الاعشاب الموضحة أعلاه، على سبيل المثال ، في the Pesticide Manual, Twelfth Edition, British Crop Protection Council, 2000. يتم توضيح R-29148، على

سبيل المثال، بواسطة -1497 pp. 130 Vol. (2002), Plant Physiology, P.B. Goldsbrough et al.,

1505 والمراجع المذكورة به، ويُعرف PPG-1292 من طلب براءة الاختراع الدولي رقم ٠٩/٢١١٧٦١ كما يُعرف N-(2-methoxybenzoyl)-4-[(methylaminocarbonyl)amino]benzenesulfonamide من براءة الاختراع الأوروبية رقم ٣٦٥٤٨٤.

تحتوي التركيبات المفضلة وفقاً للاختراع الحالي بالإضافة إلى المركب الذي له الصيغة I، مييد أعشاب ٥ آخر كمكون خلط وعامل حماية.

توضح الأمثلة التالية الاختراع بشكل أكبر لكنها لا تحدد مجاله.

وسيدرك من يتمتعون بالمهارة في المجال أن مركبات معينة يتم توضيحها أدناه تكون عبارة عن مركبات p-كيتيونول، وعلى هذا النحو فقد توجد في صورة مركب صنوي أحادي أو كخليط من المركبات الصنوية من كيتيونول و داي كيتون، على النحو الموضح، على سبيل المثال، بواسطة J. March, Advanced Organic Chemistry, third edition, John Wiley and Sons ١٠ يتم رسم كل

من المركبات الموضحة أدناه، وفي الجدول T1 و P1، كمركب صنوي أحادي عشوائي من الإينول، ولكن ينبغي أن يكون مفهوماً أن هذا الوصف يغطي صورة الداي كيتون وأية مركبات إينول ممكنة قد تظهر من خلال التحويل إلى الحالة الصنوية. علاوة على ذلك، يتم رسم بعض المركبات الموضحة أدناه، وفي جدول أ، جدول ب، جدول ج و جدول د، على هيئة متشاكلات من أجل

التبسيط، لكن ما لم يتم النص على أنها متشاكلات أحادية، ينبغي فهم هذه الهياكل على أنها تمثل خليطاً من المتشاكلات. بالإضافة إلى ذلك، من الممكن أن توجد بعض المركبات في صورة مزدوجات تجاسم، وينبغي أن يفهم أن هذه المركبات من الممكن أن توجد كخليط من مزدوجات التجاسم أو كأى مزدوج تجاسم أحادي ممكن. وضمن الجزء التجريبي المفصل، يتم اختيار المركب الصنوي من الداي كيتون لأغراض التسمية، حتى وإن كان المركب الصنوي السائد في صورة

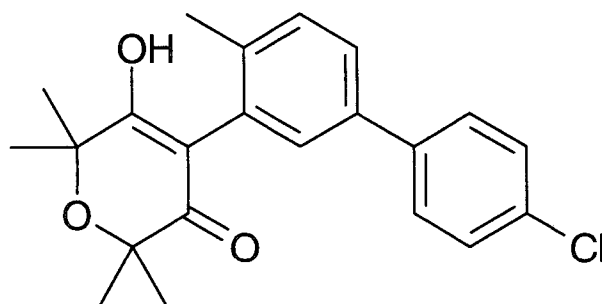
٢٠ الإينول.

الوصف التفصيلي

أمثلة التحضير:

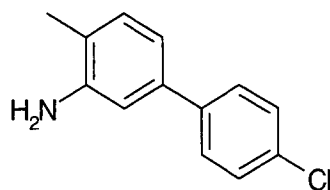
مثال رقم ١:

Preparation of 4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



٥

خطوة ١: تحضير 3-amino-4'-chloro-4-methylbiphenyl :



تمت إضافة tetrakis(triphenylphosphine)palladium (0) (٣.٧ جم، ٠.٠٠٠٣ مول)

١٠ و 4-chlorophenylboronic acid (٢٠.٢ جم، ٠.١٣ مول) إلى محلول من :

5-bromo-2-methylaniline (٢٠ جم، ٠.١ مول) في 1,2-dimethoxyethane (٢٠٠ مل). بعد

تقليب خليط التفاعل لمدة ١٥ دقيقة عند درجة حرارة ٢٠°م، تمت إضافة محلول من ٢٠٪

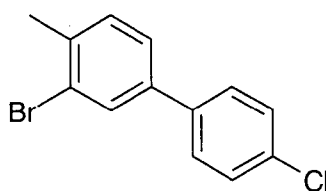
sodium carbonate مائية (٣٠٠ مل) إلى الخليط، ويتم تسخين الخليط الناتج عند درجة حرارة

الارتجاع لمدة ٢٤ ساعة. يتم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، ويتم تخفيفه بالماء (٦٠٠ مل) واستخلاصه باستخدام ethyl acetate . يتم تجفيف المواد المستخلصة العضوية المجمعة باستخدام sodium sulfate غير مائية، ويتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ . تتم تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel ، مع التصفية المتتالية باستخدام ٧% ethyl acetate في hexane للحصول على :

3-amino-4'-chloro-4-methylbiphenyl (٢١.٠ جم).

خطوة ٢: تحضير :

3-bromo-4'-chloro-4-methylbiphenyl



١٠ تمت إضافة hydrobromic acid (٤٨% بالوزن في الماء ، ١٢٠ مل) بالتقطيط إلى معلق من :

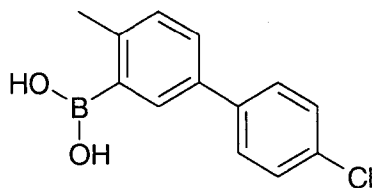
3-amino-4'-chloro-4-methylbiphenyl (٢١ جم، ٠.٠٩ مول) في ماء (٨٠ مل)، وتم تقليب الخليط حتى تمت إذابة المادة الصلبة. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة -٥°م وتمت إضافة محلول من sodium nitrite (١٠.١٢ جم، ٠.١٤ مول) في ماء (٥٠ مل) بالتقطيط، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند صفر-٥°م. يتم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعة واحدة، ثم تمت إضافته إلى محلول سابق التبريد من cuprous

١٥ bromide (١٧.٩ جم، ٠.١٢ مول) في hydrobromic acid (٤٨% بالوزن في الماء ، ١٢٠ مل) عند

صفر°م . يتم تقليب خليط التفاعل ويتم السماح له بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة طوال الليل. يتم استخلاص الخليط باستخدام ethyl acetate ، ويتم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، ويتم ترشيحها ويتم تركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تتم تنقية المادة المتبقية على

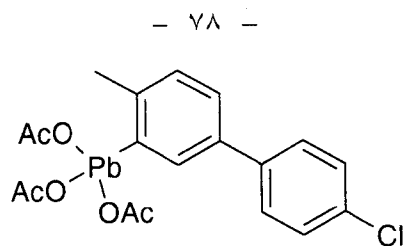
نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel ، مع التصفية التتابعية باستخدام ٢% ethyl acetate في hexane للحصول على (١٥٠ جم).

خطوة ٣: تحضير 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-ylboronic acid



٥ تمت إذابة 3-Bromo-4'-chloro-4-methylbiphenyl (٥٠٠ جم، ٠٠٠٢ مول) في tetrahydrofuran غير مائي (١٢٥ مل)، وتم تبريد الخليط إلى درجة حرارة -٧٨° م . تمت إضافة n-Butyllithium (محلول بتركيز ١.٣٣ مولار في hexane ، ١٧.٣ مل) بالتدقيق على مدى ٣٠ دقيقة، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند -٧٨° م تقريباً. تم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعة ونصف عند درجة حرارة -٧٨° م، ثم تمت إضافة trimethylborate (٢.٥٨ جم، ٠٠٠٢٤ مول) بالتدقيق وتم تقليب خليط التفاعل لمدة ثلاث ساعات ونصف، مع السماح له بالتبريد إلى ١٠ صفر ° م. ثم تمت إضافة محلول من hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ ع (٥٠ مل) بالتدقيق، وبمجرد اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط لمدة ساعتين. تم تركيز الخليط في وسط مفرغ لإزالة معظم tetrahydrofuran ، ثم تم تخفيفه بالماء (٨٠~ مل) وتم استخلاصه بـ diethyl ether . تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، ويتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها ١٥ وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تمت تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بكروماتوجراف العمود الومضي باستخدام silica gel ، مع التصفية التتابعية باستخدام ٧% ethyl acetate في hexane للحصول على 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-ylboronic acid (٢٠٥ جم).

خطوة ٤: تحضير 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yllead triacetate



خطوة ٤أ:

تمت إضافة chloroform غير مائي (٦ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (٢.٤٤ جم، ٥.٥٠ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.١٦ جم، ٠.٥٠ ملي مول)، تم غسله بالكامل nitrogen . تم تسخين هذا الخليط إلى درجة حرارة ٤٠°م وتمت إضافة 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-ylboronic acid (٢٣.١ جم، ٥.٠٠ ملي مول) دفعة واحدة، وتم تسخين المعلق عند درجة الحرارة هذه لمدة ٥ ساعات.

بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم تركيز الخليط إلى حجم صغير، ثم تم سحنه بالـ hexane وترشيحه للحصول على :

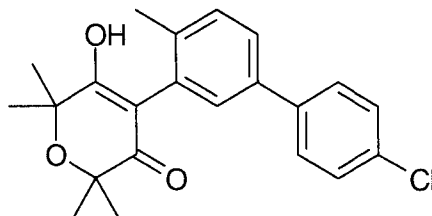
١٥ 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yllead triacetate (٢.٩٣ جم) الخام.

خطوة ٤ ب:

تمت إذابة خام 4'-chloro-4-methyl-biphenyl-3-yllead triacetate (١.٥٠ جم) في chloroform غير مائي (٢٠ مل)، وإليه تمت إضافة potassium carbonate غير مائية مسحوقة (٠.٥٩ جم، ٤.٢٤ ملي مول) متبوعاً بالتقليب السريع لمدة ٥ دقائق. تمت إزالة المواد الصلبة بالترشيح ، وتم تركيز المحلول العضوي للحصول على : 4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yllead triacetate (١.١٢١ جم) النقي في صورة مادة صلبة بلون برتقالي فاتح.

خطوة ٥: تحضير :

4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (٢٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (الموضح في براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٠٨٩٠٤٦ -

٥ (أ) (٠.٢٩٦ جم، ١.٧٤ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (١.٠٠٦ جم، ٨.٧٠ ملي

مول)، متبوعاً بالتقليب عند درجة حرارة الغرفة حتى الذوبان. إلى هذا المحلول تمت إضافة toluene

غير مائي (٥ مل)، متبوعاً ب :

4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yllead triacetate (١.١٢ جم، ١.٩١ مللي مول) دفعة واحدة وتم

تسخين الخليط التفاعل عند درجة حرارة ٨٠ °م لمدة ١-٢ ساعة. تم السماح للخليط بالتبريد إلى

١٠ درجة حرارة الغرفة، ثم تم تخفيفه بـ dichloromethane (١٥٠ مل) و hydrochloric acid مائي

مخفف (٣٠ مل)، متبوعاً بالتقليب لمدة ٥ دقائق وترشيحه من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد

المتبقية غير العضوية (مع مزيد من الغسيل بالمذيبات). تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتجفيفها

باستخدام magnesium sulfate غير مائية وتركيزها في وسط مفرغ. تمت تنقية المنتج الخام بواسطة

كروماتوجراف العمود (١٠٠٪ بنسبة hexane إلى ethyl acetate/ hexane ٥ : ١) ثم سحنها

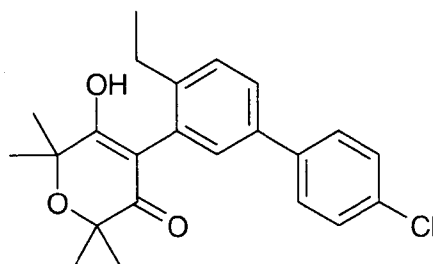
١٥ بالـ hexane للحصول على :

4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٣١٨ جم)

في صورة مسحوق بلون الكريم.

مثال رقم ٢: تحضير :

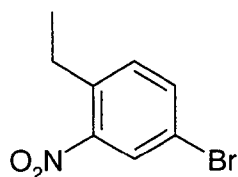
4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



خطوة ١: تحضير 4-ethyl-3-nitroaniline

٥ تمت إضافة ammonium nitrate (٣٩.٦ جم، ٠.٤٩ مول) بالتقطيع إلى محلول مثلج (في حمام من الثلج) من 4-ethylaniline (٢٠ جم، ٠.١٦ مول) في sulfuric acid مركز (١٠٠ مل)، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند ١٠ ° إلى صفر ° بالتبريد الخارجي. تم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعتين، ثم تم صبه على ثلج مجروش، وتم تجميع ناتج الترسيب بالترشيح. تم أخذ المادة الصلبة في الماء، تمت معادلة المحلول بإضافة محلول sodium hydroxide مائي مخفف وتم استخلاصه باستخدام ethyl acetate. تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على 4-ethyl-3-nitroaniline (٢٠ جم).

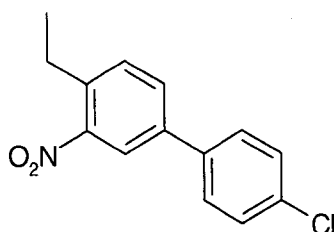
خطوة ٢: تحضير 4-bromo-1-ethyl-2-nitrobenzene



تمت إضافة hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في الماء ، ٢٤٠ مل) بالتدقيق إلى معلق من :
 4-ethyl-3-nitroaniline (٢٠ جم ، ٠.١٢ مول) في ماء (٨٠ مل)، وتم تقليب الخليط حتى ذابت
 المادة الصلبة. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة -٥°م وتمت إضافة محلول من sodium nitrite
 (١٩.٨ جم ، ٠.٢٨ مول) في ماء (١٠٠ مل) بالتدقيق، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند صفر -٥°م .
 بمجرد اكتمال الإضافة، تمت إزالة حمام التبريد وتم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعة عند درجة
 الحرارة الغرفة. تمت إضافة الخليط بالتدقيق إلى محلول سابق التبريد من cuprous bromide
 (٢٢.٤ جم ، ٠.١٦ مول) في hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في الماء) عند صفر °م. تم تقليب
 خليط التفاعل والسماح بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة على مدى ثلاث ساعات. تم استخلاص
 الخليط باستخدام diethyl ether ، وتم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتجفيفها باستخدام
 sodium sulfate غير مائية، وترشيحها وتم تركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ.

تمت تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel ، مع
 التصفية المتتالية باستخدام hexane للحصول على 4-bromo-1-ethyl-2-nitrobenzene (١٨ جم)
 (جم)

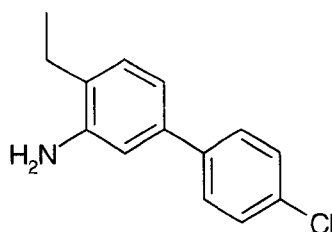
خطوة ٣: تحضير 4'-chloro-4-ethyl-3-nitrobiphenyl



تمت إضافة 4-bromo-1-ethyl-2-nitrobenzene (١٤.٩٨ جم ، ٠.٠٩٦ مول) و

tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0) (٢٠٠ جم، ٠.٠٠١٧٤ مول)، عند درجة حرارة الغرفة، إلى 4-bromo-1-ethyl-2-nitrobenzene (٢٠٠ جم، ٠.٠٠٨٧ مول) في ١٥٠ مل من ١، dimethoxyethane -٢ وتم إمرار فقاعات من غاز nitrogen في الخليط. بعد التقليب لمدة ١٠ دقائق عند ٢٠°م، تمت إضافة محلول من sodium carbonate (٧٣.٨ جم، ٠.٦٩٦ مول) في ماء (٣٥٠ مل) وتم تسخين الخليط عند الارتجاع لمدة ١٦ ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وترشيحه من خلال تراب دياتومي، وغسله باستخدام ٢٠٠ مل من ethyl acetate . تم صب الخليط في قمع فصل وتم فصل الطورين. تم استخلاص الطوري المائي باستخدام ethyl acetate . تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على 4'-chloro-4-ethyl-3-nitrobiphenyl (٢٣.٨٤ جم) في صورة زيت بني يتم استخدامه في الخطوة التالية دون المزيد من التنقية.

خطوة ٤: تحضير : 3-amino-4'-chloro-4-ethylbiphenyl

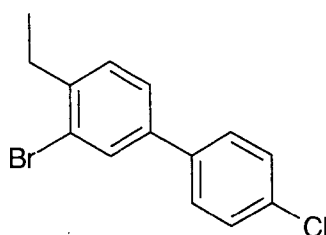


١٥ تم تعليق 4'-Chloro-4-ethyl-3-nitrobiphenyl (٢٢.٦ جم، ٠.٠٠٨٦ مول) في methanol (٢٥٠ مل) وتم تقليب خليط التفاعل عند درجة حرارة الغرفة. تمت إضافة ماء مقطر (١٠٠ مل)، متبوعاً بغبار زنك (٣٩.٠ جم، ٠.٦٠ مول) و ammonium chloride (١٣.٨ جم، ٠.٢٦ مول) وتم تسخين الخليط إلى درجة حرارة الارتجاع لمدة ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وتم

ترشيحه من خلال تراب دياتومي وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ لإزالة معظم methanol .
تمت تجزئة المادة المتبقية بين ethyl acetate (٢٠٠ مل) والماء وتمت إعادة استخلاص الطوري
المائي باستخدام ethyl acetate (٢٠٠ مل). تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وغسلها
بالماء ومحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير
ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على : ٥

3-amino-4'-chloro-4-ethylbiphenyl (١٥٠ جم) في صورة مادة صلبة عديمة اللون. تم استخدام
منتج مباشرة في خطوة دون مزيد من التنقية ٥.

خطوة ٥: تحضير 3-bromo-4'-chloro-4-ethylbiphenyl



١٠ خطوة ٥ أ:

تمت إضافة 3-Amino-4'-chloro-4-ethylbiphenyl (٦٠٠ جم، ٠.٢٦ مول) بالتقطيع إلى خليط
من hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في الماء ، ٣٥٠ مل) وماء (٢٥٠ مل)، وبمجرد اكتمال
الإضافة تم تسخين الخليط إلى ٤٠° م وتقليبه لمدة ٢٠ دقيقة، قبل التبريد إلى درجة حرارة ٥° م في
حمام من الثلج. تمت إضافة محلول من sodium nitrite (٢٠.٦٥ جم، ٠.٣٠ مول) في ماء
١٥ (١٠٠ مل) بالتقطيع على مدى ٤٥ دقيقة، وبمجرد اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط عند درجة حرارة
٥° م لمدة ٤٥ دقيقة أخرى.

خطوة ٥ ب:

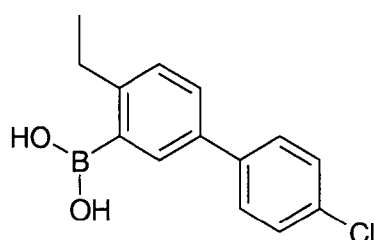
في أثناء ذلك، تم تسخين hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في الماء ، ٤٠٠ مل) وتقليبه عند درجة حرارة ٧٠° م وتمت إضافة copper sulfate pentahydrate (٧٤.٧٥ جم، ٠.٣٠ مول) دفعة واحدة وتم تقليب الخليط إلى ٧٠° م لمدة دقيقتين للحصول على محلول بلون أرجواني غامق، ثم تمت إضافة مسحوق النحاس (٢٦.٤٤ جم، ٠.٤٢ مول) دفعة واحدة، مما نتج عنه معلق قرنفلي اللون. ٥

خطوة ٥ ج

تمت إضافة الخليط المحتوي على ملح diazonium (تم تحضيره في الخطوة ٥ أ) بالتدقيق على مدى ٧٠ دقيقة إلى الخليط الذي تم تقليبه والذي تم تحضيره في خطوة ٥ ب عند درجة حرارة ٧٠° م (بين الإضافات تم الاحتفاظ بالخليط المحتوي على ملح diazonium في حمام من الثلج). بمجرد اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط عند درجة حرارة ٧٠° م لمدة ٣٠ دقيقة أخرى ثم ترك ليبرد إلى درجة حرارة الغرفة، وتم استخلاصه باستخدام ethyl acetate (٣ × ٥٠٠ مل). يتم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وغسلها بالماء ومحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. أدت التنقية بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel إلى الحصول على : ١٥

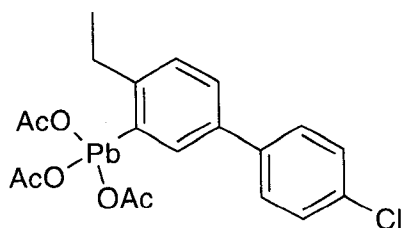
3-bromo-4'-chloro-4-ethylbiphenyl (١٠.٥٢ جم) في صورة زيت أصفر ١٥

خطوة ٦: تحضير 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-ylboronic acid



تمت إذابة 3-Bromo-4'-chloro-4-ethylbiphenyl (١٠ جم، ٠.٠٣ مول) في tetrahydrofuran (٢٥٠ مل)، وتم التبريد إلى درجة حرارة -٧٨°م. تمت إضافة n-Butyllithium (محلول بتركيز ١.٣٣ مولار في hexane ، ٣٤.٦ مل) بالتقطيط على مدى ٣٠ دقيقة، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند حوالي -٧٨°م. تم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعة ونصف، ثم تمت إضافة trimethylborate (٤.٩ جم، ٠.٠٥ مول) بالتقطيط وتم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعتين. تمت إضافة محلول من hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ ع (١٠٠ مل) بالتقطيط، وبمجرد اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط لمدة ساعتين. تم تركيز الخليط لإزالة معظم tetrahydrofuran ، وتم تخفيفه بالماء واستخلاصه باستخدام diethyl ether . تم غسل المواد المستخلصة العضوية بالماء ومحلول ملحي ، وتم تجميعها، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تم تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود الومضي باستخدام silica gel ، مع التصفية التتابعية باستخدام ٧٪ ethyl acetate في hexane للحصول على 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-ylboronic acid (٥.٤ جم).

خطوة ٧: تحضير 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate



خطوة ٧ أ: ١٥

تمت إضافة chloroform غير مائي (٦ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (٢.١٥ جم، ٤.٨٥ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.١٥ ، ٩ ، ٠.٤٧ ملي مول) ، تم غسله بالكامل nitrogen . تم تسخين هذا الخليط إلى درجة حرارة ٤٠°م ، وتمت إضافة :

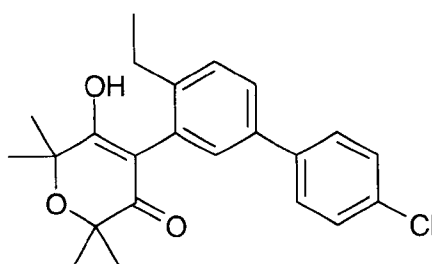
4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-ylboronic acid (١.١٧ جم، ٤.٥٠ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين المعلق عند درجة الحرارة هذه لمدة ٥ ساعات. بعد ذلك تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة الغرفة، وتم تركيزه إلى حجم صغير وسخنه بال hexane وترشيحه للحصول على :

4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (٢.٧٠ جم) الخام.

٥ خطوة ٧ب:

تمت إذابة 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (١.٥٠ جم) الخام في chloroform غير مائي (٢٠ مل)، وإليه تمت إضافة potassium carbonate غير مائية مسحوقة (٠.٥٨ جم، ٤.١٦ ملي مول) ثم تلى ذلك التقليب السريع لمدة ٥ دقائق. تمت إزالة المواد الصلبة بالترشيح، وتم تركيز المحلول العضوي للحصول على 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate النقي (١.١٧٦ جم) في صورة مادة صلبة بلون برتقالي فاتح.

خطوة ٨: تحضير 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (٢٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (الموضح في براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٠٨٩٠٤٦

١٥ - أ) (٠.٣٠٣ جم، ١.٧٨ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (١.٠٩ جم، ٨.٩٠ ملي

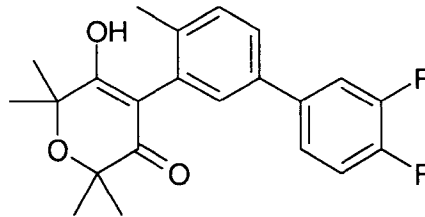
(مول)، متبوعاً بالتقليب عند درجة حرارة الغرفة حتى الذوبان. تمت إضافة toluene غير مائي (٥ مل) إلى هذا المحلول، متبوعاً :

ب 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (١.١٧ جم، ١.٩٦ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين الخليط عند درجة حرارة ٨٠° م لمدة ١-٢ ساعة. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، ثم تم تخفيفه باستخدام dichloromethane (١٥٠ مل) و hydrochloric acid مائي مخفف (٣٠ مل)، متبوعاً بالتقليب لمدة ٥ دقائق وتم الترشيح من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية (مع مزيد من الغسيل بالمذيبات). تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية وتركيزها في وسط مفرغ. تمت تنقية المنتج الخام بواسطة كروماتوجراف العمود (١٠٠٪ بنسبة hexane إلى ethyl acetate/ hexane تبلغ ٥: ١) ثم تم سحنه بالـ hexane للحصول على :

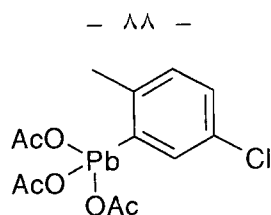
4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٤٦ جم) في صورة مسحوق بلون الكريم.

مثال رقم ٣: تحضير :

4-(3',4'-difluoro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



خطوة ١: تحضير 5-chloro-2-methylphenyllead triacetate

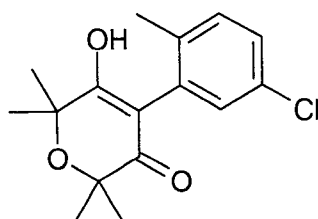


تمت إضافة chloroform غير مائي (٦ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (٢.١٥ جم، ٤.٨٥ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.١٥ جم، ٠.٤٧ ملي مول)، تم غسله بالكامل بال-nitrogen. تم تسخين هذا الخليط إلى درجة حرارة ٤٠° م، وتمت إضافة :

٥ 5-chloro-2-methylphenylboronic acid (٠.٧٦ جم، ٤.٤٦ ملي مول) دفعة واحدة، وتم تسخين المعلق عند درجة الحرارة هذه لمدة ٥ ساعات. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم تركيز الخليط إلى حجم صغير ثم سحنها بال hexane وترشيحه للحصول على :

5-chloro-2-methylphenyllead triacetate (٢.٢٧ جم) الخام.

خطوة ٢: تحضير 4-(5-chloro-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (٤٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (الموضح في براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥,٠٨٩,٠٤٦ -

أ) (٠.٥٠٤ جم، ٢.٩٦ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (١.٤٥ جم، ١١.٨٤ ملي

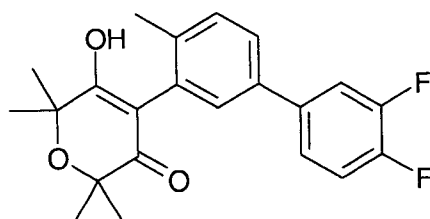
مول). تمت إضافة 5-chloro-2-methylphenyllead triacetate (٢.٢٦ جم، ٤.٤٤ ملي مول)

الخام دفعة واحدة إلى هذا المحلول، ثم تم تسخين الخليط عند درجة حرارة ٤٠° م لمدة ١٧ ساعة (إلى التحليل)، ثم لمدة ٢٣ ساعة أخرى عند درجة حرارة ٤٥-٥٠° م. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة ، ثم تم تخفيفه باستخدام ethyl acetate (١٠٠ مل) وغسله باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف (٣ x ٣٠ مل). تم تجفيف الطور العضوي باستخدام magnesium sulfate غير مائية، ثم تم تركيزه للحصول على مادة صمغية صفراء اللون تمت تنقيتها بواسطة كروماتوجراف العمود (بنسبة acetic acid/ hexane/ethyl acetate تبلغ ٨ : ١٨ : ١) ثم سحنها بالـ hexane للحصول على :

4-(5-chloro-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٥٣ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

١٠ خطوة ٣: تحضير :

4-(3',4'-difluoro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة 4-(5-chloro-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione (٠.٢٠ جم،

٠.٦٨ ملي مول)، 3,4-difluoro-phenylboronic acid (٠.١٠٧ جم، ٠.٦٨ ملي مول)،

potassium phosphate (٠.٧٢٢٩، ٣.٤٠ ملي مول)، palladium(II) acetate (١.٦ مجم،

٠.٠٠٦٨ ملي مول) و sodium S-phos-3'-sulphonate (٧.٠ مجم، ٠.٠١٣٦ ملي مول) إلى

قارورة ميكروويف. بعد ذلك تمت إضافة ماء مقطر منزوع الغازات (٠.٧٥ مل) (مع غسل أية مواد

صلبة على جوانب القارورة)، متبوعاً بالتقليب لمدة ٥ دقائق والغسيل باستخدام argon. تم بعد ذلك

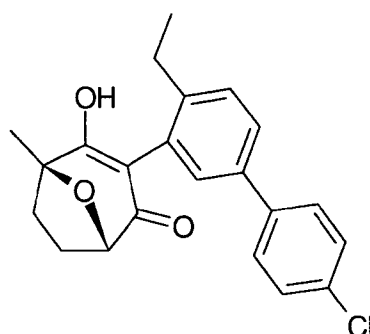
تسخين هذا الخليط عند درجة حرارة ١٦٠°م تحت أشعة الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة، متبوعاً بإضافة المزيد من 3,4-difluorophenylboronic acid (٠.١٠٧ جم، ٠.٦٨ ملي مول) و potassium phosphate (٠.١٤٤ جم، ٠.٦٨ ملي مول)، ثم المزيد من التسخين عند درجة حرارة ١٦٠°م تحت أشعة الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم تخفيف خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate (٣ مل) وإكسابه الخاصية الحمضية إلى رقم هيدروجيني pH يبلغ ٢ باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف.

تم فصل الطور العضوي وتم استخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate (٣ × ٣ مل). بعد ذلك تم تجميع كافة المواد العضوية، وتم ترشيحها من خلال سداة silica وتم تبخيرها للحصول على منج خام تمت إذابته في N,N-dimethylformamide (٢.٥ مل) وتمت تنقيتها بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-(3',4'-difluoro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.١٩٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

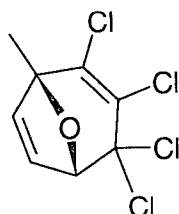
مثال رقم ٤: تحضير :

(1R*,5S*)-3-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-1-methyl-8-oxa-bicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione



خطوة ١: تحضير :

(1R*,5S*)-2,3,4,4-tetrachloro-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-2,6-diene



تمت إضافة Pentachlorocyclopropane (١٠٠ جم، ٠.٤٦٧ مول) إلى معلق من :

٥ potassium hydroxide (٣١.٤ جم، ٠.٥٦ مول) في 1,4-dioxane (٣٦٠٠ مل) وتم تقليب

الخليط عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٣٠ دقيقة ثم تم تسخينه إلى ٦٥° م لمدة ٣٠ دقيقة أخرى. تمت إضافة :

2-methylfuran (٣٨.٣٦ جم، ٠.٤٦٧ مول) إلى خليط التفاعل، وتم رفع درجة الحرارة إلى ٨٥-

٩٠° م وتم تقليب الخليط لمدة ١٦ ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وتم

١٠ ترشيحه من خلال سدادة من التراب الدياتومي وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على :

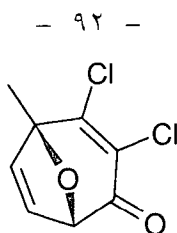
(1R*,5S*)-2,3,4,4-tetrachloro-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-2,6-diene (٨٣ جم)، وتم

استخدامه دون مزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٢: تحضير :

(1R*,5S*)-3,4-dichloro-5-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-3,6-dien-2-one

١٥



تمت إضافة silver nitrate (١٦٦ جم، ٠.٩٨٢ مول) إلى خليط تم تقليبها من :

(٨٣ جم، (1R*,5S*)-2,3,4,4-tetrachloro-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-2,6-diene

٠.٤٩١ مول)، acetone (١٥٠٠ مل) وماء (١٥٠٠ مل) وتم تسخين الخليط عند درجة حرارة ٦٥

°م لمدة ١٦ ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وتمت إضافة محلول مشبع من

sodium bicarbonate المائية لتعديل الرقم الهيدروجيني pH إلى ٧-٨. تم ترشيح الخليط من خلال

سدادة من التراب الدياتومي، وتم تركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ لإزالة معظم الـ acetone. تم

استخلاص الخليط المائي باستخدام ethyl acetate (٣ × ٥٠٠ مل) وتم تجميع المواد المستخلصة

العضوية، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح .

١٠ تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف العمود الومضي باستخدام silica gel للحصول

على :

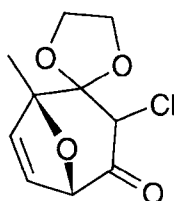
(٢٩.٥ جم) (1R*,5S*)-3,4-dichloro-5-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-3,6-dien-2-one

في صورة زيت أصفر.

خطوة ٣ : تحضير :

3-chloro-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxa-bicyclo[3.2.1]oct-6-ene)

١٥



تمت إضافة sodium (٤.٤١ جم، ٠.٢٠٤ مول) بحذر إلى ethylene glycol (٩٩.٧٥ جم) وتم تقليب الخليط عند درجة حرارة ٣٥-٤٠°م في جو من nitrogen حتى تمت إذابة sodium تماماً. تمت إضافة محلول من :

(٢٨ جم، (1R*,5S*)-3,4-dichloro-5-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octa-3,6-dien-2-one

٥ (٠.١٣٦ مول) في tetrahydrofuran (٢٠٠ مل) بالتقطيط على مدى ٣٠ دقيقة، وبمجرد اكتمال

الإضافة، تم تقليب الخليط لمدة ٩٠ دقيقة عند درجة حرارة الغرفة. تمت معادلة خليط التفاعل

بإضافة ١٠% sodium dihydrogen phosphate المائية، وتم استخلاصه باستخدام ethyl acetate

(٣ × ١٠٠ مل). تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate

غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح. تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف

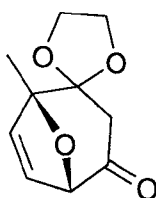
١٠ العمود الوميسي باستخدام silica gel للحصول على :

3-chloro-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene)

(٢٤.٥ جم) في صورة مادة صمغية.

خطوة ٤: تحضير :

(1R*,5S*)-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxa-bicyclo[3.2.1]oct-6-ene)



١٥

تمت إضافة مسحوق zinc (١٣.٨٨ جم، ٠.٢١٢ مول) إلى محلول من :

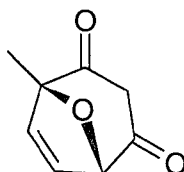
3-chloro-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene)

(٢٤.٥ جم، ٠.٠١٦ مول) في acetic acid (١٢٢.٥ مل) وتم تقليب خليط التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٢٤ ساعة. تم تخفيف الخليط بالماء (٦١٢.٥ مل) وتم استخلاصه باستخدام ethyl acetate (٣ × ١٥٠ مل). تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح للحصول على :

(1R*,5S*)-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene) ٥

(٢٠ جم) في صورة زيت أصفر، يتم استخدامه دون المزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٥: تحضير (1R*,5S*)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene-2,4-dione



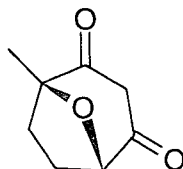
تمت إضافة hydrochloric acid (٥٠ مل)، على ثلاثة أجزاء، إلى خليط من :

(1R*,5S*)-1-methyl-4-oxo-spiro(1,3-dioxolane-2,2'-[8]oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene) ١٠

(٢٠ جم، ٠.١٠٢ مول) في acetone (٥٠٠ مل) وماء (٢٥٠ مل) وتم تقليب خليط التفاعل عند درجة حرارة ٦٥-٧٠ °م لمدة ٤٨ ساعة. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة الغرفة، تمت إزالة معظم acetone بالتبخير تحت ضغط مخفض وتم استخلاص المحلول المائي الناتج باستخدام ethyl acetate (٣ × ١٠٠ مل). يتم تجميع المواد المستخلصة العضوية، ويتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate غير مائية، ويتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح. تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف العمود الومضي باستخدام silica gel للحصول على (١٠٠٠ جم) في صورة

زيت أصفر.

خطوة ٦ : تحضير (1R*,5S*)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione



تمت إضافة ١٠% palladium على الكربون (٢.٤ جم) إلى محلول من :

(1R*,5S*)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]oct-6-ene-2,4-dione (١٢.٠ جم، ٠.٠٧٩ مول) في

ethyl acetate (١٠٠ مل) متبوعاً بالتقليب في جو من hydrogen ١ بار لمدة ٢٤ ساعة. بعد

ذلك يتم ترشيح خليط التفاعل من خلال تراب دياتومي وتركيزه للحصول على منتج خام تتم تنقيته

بكروماتوجراف وميضي (ethyl acetate/ hexane) للحصول على :

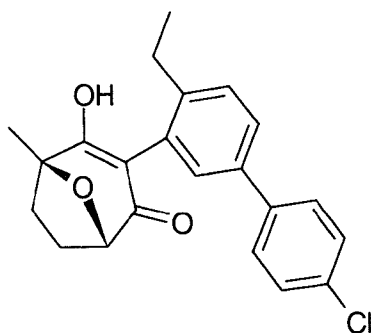
(1R*,5S*)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione (٦.٩٠ جم) في صورة مادة صلبة

بلون أصفر باهت.

١٠ خطوة ٧: تحضير

(1R*,5S*)-3-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-1-methyl-8-oxa-bicyclo[3.2.1]octane-2,4-

dione



تمت إضافة:

(1R*,5S*)-1-methyl-8-oxa-bicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione (٠.١٠ جم، ٠.٦ ملي مول) و N,N-dimethylamino-pyridine (٠.٣٩٥ جم، ٣.٢ ملي مول) إلى خليط من chloroform (٢.٠ مل) و toluene (٠.٥ مل) في جو من nitrogen مع التقليب. إلى خليط التفاعل هذا تمت إضافة chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (٠.٤٢ جم، ٠.٧٠ ملي مول) دفعة واحدة، ثم تم تسخين الخليط عند درجة حرارة ٨٠ °م لمدة ١-٢ ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وإكسابه الخاصية الحمضية باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف ثم تم ترشيحه من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية (بعد ذلك الغسيل dichloromethane). تم استخلاص الأجزاء المائية بـ dichloromethane (٢ × ٥ مل)، وتم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتجفيفها باستخدام sodium sulfate ثم تم تركيزها تحت ضغط منخفض للحصول على المنتج الخام الذي تمت تنقيته بواسطة كروماتوجراف وميضي (ethyl acetate/ hexane) للحصول على

٥

١٠

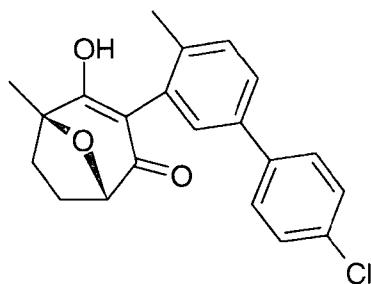
:

(1R*,5S*)-3-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione

(٠.١٥٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

١٥ مثال رقم ٥: تحضير :

(1R*,5S*)-3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1-methyl-8-oxa-bicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione



تمت إضافة :

(1R*,5S*)-1-methyl-8-oxa-bicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione (٠.٢٥ جم، ١.٦٢ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (٠.٩٩ جم، ٨.١١ ملي مول) إلى خليط من chloroform و toluene (٠.٧٥ مل) في جو من nitrogen مع التقليب. بعد ذلك تمت إضافة :

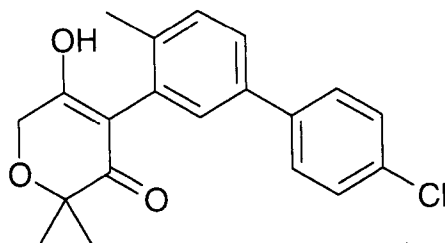
4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yllead triacetate (١.٠٥ جم، ١.٧٨ ملي مول) دفعة واحدة إلى خليط التفاعل، ثم تم تسخين الخليط عند درجة حرارة ٨٠ ° م لمدة ١-٢ ساعة. تم تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وتم إكسابه الخاصية الحمضية باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف ثم تم ترشيحه من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية (بعد ذلك تم الغسيل بـ dichloromethane). تم استخلاص الأجزاء المائية باستخدام dichloromethane (٢ ×

١٠ مل)، ثم تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتم تجفيفها باستخدام sodium sulfate وتركيزها تحت ضغط منخفض للحصول على خام منتج تمت تنقيته بواسطة كروماتوجراف وميضي (ethyl acetate / hexane) للحصول على:

(1R*,5S*)-3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1-methyl-8-oxabicyclo[3.2.1]octane-2,4-dione

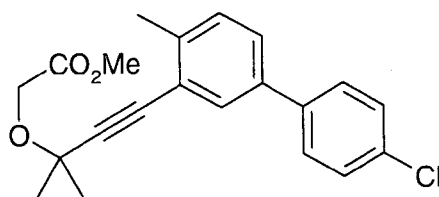
(٠.٢٤٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

مثال رقم ٦: تحضير 4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2-dimethylpyran-3,5-dione



خطوة ١: تحضير :

[3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid methyl ester



تمت إضافة bis(triphenylphosphine)palladium(II) dichloride (٠.٦٣ جم، ٠.٩ ملي مول) و iodine يد نحاس (١) (٠.٣٤ جم، ١.٨ ملي مول) إلى محلول من :

3-bromo-4'-chloro-4-methylbiphenyl (١٢.٦ جم، ٤٤.٧ ملي مول) و

١٠ (1,1-dimethylprop-2-ynyloxy)acetic acid methyl ester (تم تحضيره وفقاً لطلب براءة الاختراع

الدولي رقم ٢٠٠١/٠٦٦٥٤٤ (٨.٤ جم، ٥٣.٨ ملي مول) في triethylamine (٧٠ مل). تم

نزوع الغازات خليط التفاعل وغسله بـ nitrogen (×٣)، ثم تم تقليبه تحت nitrogen عند درجة

حرارة ٨٠°م لمدة ساعة. تم ترشيح الخليط الذي تم تبريده من خلال تراب دياتومي لإزالة المحفز،

وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تم تعريض المادة المتبقية لنفس ظروف التفاعل ٨.٤ جم

١٥ methyl ester 1,1-dimethylprop-2-ynyloxy)acetic acid ٠.٦٣ جم

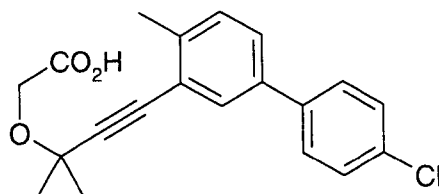
bis(triphenylphosphine)-palladium(II) dichloride ، ٠.٣٤ جم iodine يد نحاس (١) في ٧٠ مل من triethylamine في وجود nitrogen) وتم تقليبها عند درجة حرارة ٨٠°م لمدة ساعة. تم ترشيح الخليط الذي تم تبريده من خلال تراب دياتومي، ثم تم تركيزه في وسط مفرغ وتمت تنقيته بكروماتوجراف وميض (ethyl acetate/ hexane ٣ : ١) للحصول على :

[3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid methyl ester

(٦.٧٠ جم) في صورة زيت.

خطوة ٢: تحضير :

[3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid



تمت إضافة potassium hydroxide (١.١٠٥ جم، ١٩.٧ ملي مول) إلى محلول من :

[3-(4'-chloro-4-methyl-biphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid methyl ester

(٦.٧ جم، ١٨.٨ ملي مول) في dioxane (٢٠ مل) وماء (٢٠ مل). بعد التقلب لمدة أربع ساعات

عند درجة حرارة ٢٠°م، تم استخلاص خليط التفاعل مرتين باستخدام dichloromethane . تم

إكساب الطبقة المائية الخاصة الحمضية عند صفر°م إلى الرقم الهيدروجيني pH ٢-٣ باستخدام

hydrochloric acid مائي بتركيز ١ ع وتم استخلاصها مرتين باستخدام ethyl acetate . تم

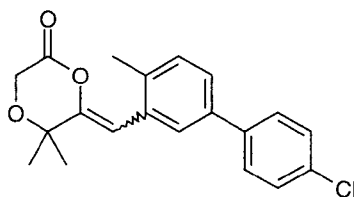
تجفيف المواد المستخلصة العضوية المجمعة باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تم تقليب المادة المتبقية في hexane وترشيحها للحصول على :

٤.٥٠) [3-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid

٥ (جم) في صورة مادة صلبة بيضاء اللون (نقطة انصهارها تبلغ ١٢٥ °م).

خطوة ٣: تحضير :

6-[1-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)methylidene]-5,5-dimethyl-[1,4]dioxan-2-one



تمت إضافة silver carbonate (٠.١٧ جم، ٠.٦١ ملي مول) إلى محلول من :

١٠ [3-(4'-chloro-4-methyl-biphenyl-3-yl)-1,1-dimethylprop-2-ynyloxy]acetic acid (٢.١ جم،

٦.١٣ ملي مول) في acetonitrile غير مائي (١٥ مل) في قارورة ميكروويف. تم تقليب خليط

التفاعل وتسخينه إلى درجة حرارة ١٢٠°م لمدة ٤٠ دقيقة في وجود أشعة الميكروويف للحصول

على معلق بني اللون. تم تبخير الخليط في وسط مفرغ، ثم تم تخفيفه بالماء وتم استخلاصه

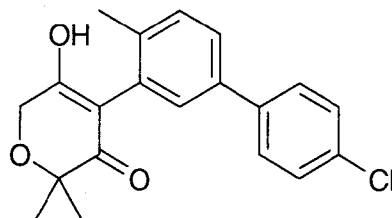
باستخدام ethyl acetate . تم تجفيف المواد المستخلصة العضوية المجمعة باستخدام sodium

١٥ sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على /

6-[1-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)methylidene]-5,5-dimethyl-[1,4]dioxan-2-one

(١.٧٥ جم) في صورة مادة صلبة.

خطوة ٤: تحضير 4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2-dimethylpyran-3,5-dione :



تمت إضافة triethylamine (٠.٦٧ مل، ٤.٨١ مللي مول) و potassium cyanide (٣٠ مجم، ٠.٤٦ ملي مول) إلى معلق من:

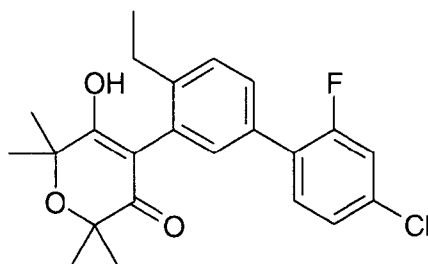
6-[1-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)methylidene]-5,5-dimethyl-[1,4]dioxan-2-one ٥

(١.٥ جم، ٤.٣٨ ملي مول) في acetonitrile غير مائي (٢٢ مل). تم تقليب خليط التفاعل عند الارتجاع لمدة ساعتين. تم تخفيف الخليط الذي تم تبريده باستخدام ethyl acetate ، وتمت إضافة hydrochloric acid مائي بتركيز ٠.٥ ع عند صفر °م. تم فصل المادة العضوية وتم استخلاص الطور المائي مرتين باستخدام ethyl acetate . تم تجفيف المواد المستخلصة العضوية المجمعة باستخدام sodium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تمت تنقية المادة المتبقية بكروماتوجراف وميضي (ethyl acetat/ heptane بنسبة تبلغ ١:١) للحصول على :

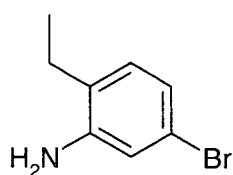
4-(4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl)-2,2-dimethylpyran-3,5-dione (١.٣٥ جم) في صورة رغوة. تم تقليب عينة من المنتج في hexane / diisopropyl ether (بنسبة تبلغ ٤ : ١) وترشيحها للحصول على مادة صلبة بيضاء اللون تبلغ نقطة انصهارها ١٨٦-١٨٨ °م. ١٥

مثال رقم ٧: تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethyl-2'-fluorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



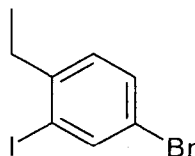
خطوة ١: تحضير 5-bromo-2-ethylaniline



إلى محلول من 2-ethyl-5-bromo nitrobenzene (٩.٧١ جم، ٢٣٠ ملي مول) في ethanol
 ٥ (١٢٥ مل) تمت إضافة tin(II) chloride dihydrate (٣٥.٧٢ جم، ٢٢٥.٧١ ملي مول)، متبوعاً
 بالتسخين عند ٧٠°م لمدة ساعتين. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم صب المحلول في ثلج
 مجروش (١ لتر) ثم تم تخفيفه باستخدام ethyl acetate (٢٠٠ مل). تمت إضافة sodium
 carbonate صلبة بحذر حتى تم الوصول إلى الرقم الهيدروجيني pH ٧، وفي هذه المرحلة
 تم ترشيح الخليط اللزج من خلال تراب دياتومي (تم إجراء المزيد من الغسيل باستخدام ethyl acetate
 ١٠ sodium carbonate/ مائية) وتم فصل الأطوار. بعد المزيد من استخلاص الطور المائي، تم
 تجميع كافة الأطوار العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية ثم تم تركيزها
 في وسط مفرغ. تمت تنقية الزيت الخام بواسطة كروماتوجراف العمود الوميسي باستخدام silica
 gel (ethyl acetate / hexane بنسبة ٨: ٢) للحصول على :

5-bromo-2-ethylaniline (٧.٨٩ جم) في صورة زيت بني.

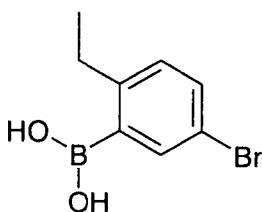
خطوة ٢: تحضير 4-bromo-1-ethyl-2-iodobenzene ١٥



تمت إضافة sulfuric acid مركز (٥.٦٠ مل) إلى خليط تم تقلبيه من 5-bromo-2-ethylaniline (٣.٣٩ جم، ٢٠٠ ملي مول) في ماء مقطر (١١٠ مل)، متبوعاً بالتسخين لفترة وجيزة عند درجة حرارة الارتجاع حتى الذوبان. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، مما نتج عنه راسب دقيق، ثم تم إجراء المزيد من التبريد إلى درجة حرارة صفر °م تقريباً في حمام ثلج/ملح. إلى هذا ٥

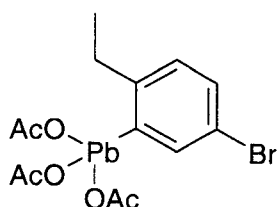
الملاط تمت إضافة محلول مائي من sodium nitrite (١.١٧ جم، ١٦.٩٤ ملي مول) في ماء مقطر (١٠ مل) بالتقطيط على مدى ١٥ دقيقة، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند أقل من ٥٥ °م ، متبوعاً بمزيد من التقليب لمدة ٣٠ دقيقة. بعد ذلك تم ترشيح خليط التفاعل ثم تمت إضافته إلى محلول ثان من potassium iodide مائي (٨.٤٤ جم، ٥٠.٨٣ ملي مول) في ماء مقطر (٤٥ مل) بالتقطيط عند درجة حرارة الغرفة. بعد اكتمال الإضافة تم تسخين المحلول لفترة وجيزة إلى درجة حرارة ٨٠ °م ثم تم السماح بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة مرة أخرى. تم استخلاص خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate (٣ × ٥٠ مل)، وتم غسل الطور العضوي باستخدام hydrochloric acid مائي بتركيز ١ مولار (٣٠ مل) و sodium thiosulfate المائية (٢ × ٣٠ مل). بعد التجفيف باستخدام magnesium sulfate غير مائية والتركيز في وسط مفرغ تم الحصول على 4-bromo-1-ethyl-2-iodobenzene (٤.٩٠ جم) في صورة سائل برتقالي. ١٥

خطوة ٣: تحضير 5-bromo-2-ethylphenylboronic acid



إلى محلول من 4-bromo-1-ethyl-2-iodobenzene (١٠.٠٠ جم، ٣٢.٢٠ ملي مول) في tetrahydrofuran غير مائي (٦٠ مل) عند درجة حرارة -٧٨° م تمت إضافة محلول من isopropylmagnesium chloride (١٦.٩٠ مل، ٣٣.٨ ملي مول، محلول بتركيز ٢ مولار في tetrahydrofuran) بالتقطيط، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند أقل من -٦٠° م. بعد التقليب لمدة ٢٠ دقيقة تم السماح لخليط التفاعل للتسخين ببطء إلى درجة حرارة الغرفة متبوعاً بالتقليب لساعة أخرى. تمت إعادة تبريد المحلول إلى -٧٨° م وتمت إضافة trimethylborate (٧.١٨ مل، ٦٤.٣٢ ملي مول) بالتقطيط، وبعد ذلك تم السماح للخليط بالتبريد مرة أخرى إلى درجة حرارة الغرفة من خلال المزيد من التقليب لمدة ساعتين. تمت إضافة hydrochloric acid مخفف مائي (٣٠ مل)، تم استخلاص المنتج الخام إلى ethyl acetate (١٠٠ مل). تم غسل الطور المائي باستخدام ethyl acetate (٢ × ١٠٠ مل)، وتم تجميع كافة المواد العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية ثم تم تركيزها في وسط مفرغ للحصول على مادة صلبة بلون بني باهت يتم سحقها بالـ hexane للحصول على 5-bromo-2-ethylphenylboronic acid (٦.٤٦ جم) في صورة مسحوق بلون الكريم.

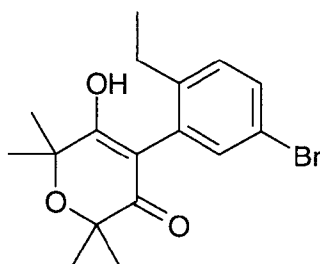
خطوة ٤: تحضير 5-bromo-2-ethylphenyllead triacetate



تمت إضافة chloroform غير مائي (٤٢ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (١٣.٧ جم، ٣١.٠٠ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.٤٧ جم، ١.٥٠ ملي مول)، تم غسله بالكامل nitrogen. تم تسخين هذا الخليط إلى درجة حرارة ٤٠° م، وتمت إضافة :

5-bromo-2-ethylphenylboronic acid (٦.٥٠ جم، ٢٨.٠٠ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين المعلق عند درجة الحرارة هذه لمدة ٥ ساعات. بعد ذلك تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، متبوعاً بمزيد من التبريد إلى درجة حرارة صفر° م ثم إضافة potassium carbonate غير مائية مسحوقة (٣.٢٢ جم) مع التقليب السريع لمدة ٥ دقائق ثم الترشيح. تم تركيز ناتج الترشيح إلى نصف حجمه، متبوعاً بإضافة hexane لحدث الترسيب. تم تركيز هذا الخليط على نحو أكبر، وتم فصل المذيب بالترويق، وتم غسل المادة الصلبة بـ hexane للحصول على 5-bromo-2-ethylphenyllead triacetate (١٠.٦٩ جم) في صورة مادة صلبة بلون رملي.

خطوة ٥: تحضير 4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



١٠ تمت إضافة chloroform غير مائي (١٢٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٣.٥٧ جم، ٢١.٠٠ ملي مول)

و N,N-dimethylaminopyridine (١٣.٥٠ جم، ١١١.٠٠ ملي مول) متبوعاً بالتقليب عند درجة حرارة الغرفة حتى الذوبان. تمت إضافة toluene غير مائي (٣٧ مل) إلى هذا المحلول، متبوعاً بـ 5-bromo-2-ethylphenyllead triacetate (١٠.٦٩ جم، ٢٤.٠٠ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين خليط التفاعل عند ٨٠° م لمدة ساعتين، ثم تم السماح له بالتماسك طوال الليل عند درجة حرارة

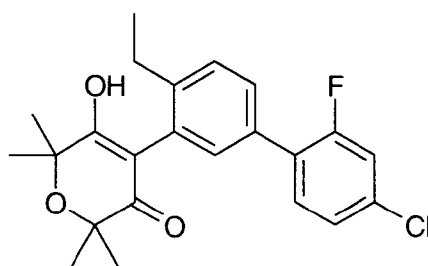
١٥ الغرفة. تم تخفيف الخليط باستخدام dichloromethane (١٨٥ مل) و hydrochloric acid مائي مخفف (١٨٥ مل)، متبوعاً بالتدويم لمدة ٥ دقائق والترشيح لإزالة المواد المتبقية غير العضوية (تم

إجراء المزيد من الغسيل باستخدام dichloromethane). تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتم غسلها باستخدام محلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، ثم تم تركيزها في وسط مفرغ للحصول على زيت خام تتم تنقيته على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود الوميضي (ethyl acetate / hexane بنسبة ٥ : ١) للحصول على المنتج كمادة صلبة صفراء اللون (٤.٤٧ جم). تمت إزالة المواد المتبقية الرصاصية بإذابة هذه المادة الصلبة في chloroform (٥٠ مل) والتقليب باستخدام silica gel مرتبط بالمجموعة الوظيفية 3-mercaptopropyl (٥.٥٠ جم، ١.٢٠ ملي مول / جم تحميل) طوال الليل. بعد الترشيح والتركيز تم الحصول على 4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٤.٣٦ جم) في صورة مسحوق بلون الكريم.

١٠ خطوة ٦: تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethyl-2'-fluorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة dimethoxyethane (٢ مل) منزوع الغازات إلى خليط من :

4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٧٨ جم، ٠.٧٩ ملي

١٥ مول)، cesium fluoride (١.١٩ جم، ٧.٩٠ ملي مول)، 4-chloro-2-fluorophenylboronic acid

(٠.١٩٤ جم، ١.١١ ملي مول) و

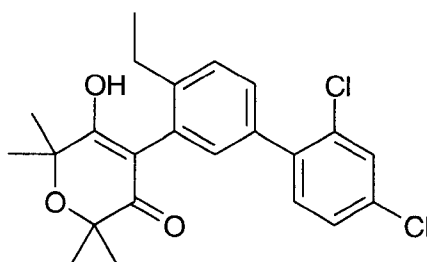
[1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene]dichloro-palladium(II) (٠.١٠٢ جم، ٠.١٢ ملي مول)، وتم تقليب المعلق الناتج في وجود nitrogen لمدة ٤٥ دقيقة ثم تم التسخين عند ٨٠° م لمدة ٢٠ ساعة. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تمت تجزئة خليط التفاعل بين ethyl acetate و hydrochloric acid مائي بتركيز ١ مولار. تم استخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate، ثم تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية وتركيزها في وسط مفرغ. تمت تنقية المادة الناتجة بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel (ethyl acetate / hexane بنسبة ٣ : ١) للحصول على :

4-(4'-chloro-4-ethyl-2'-fluorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione

(٠.٢٤٨ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

١٠ مثال رقم ٨ : تحضير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة dioxane منزوع الغازات (٢.٥ مل) إلى خليط من :

4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٧٨ جم، ٠.٧٩ ملي مول)

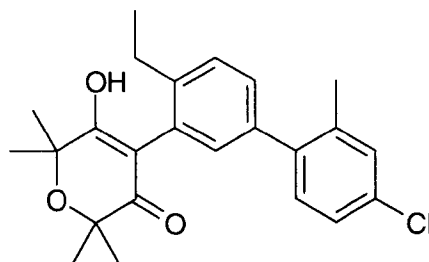
١٥ (مول)، cesium fluoride (١.١٩ جم، ٧.٩٠ ملي مول) وحمض :

2,4-dichlorophenyl boronic acid (٠.٣٠٩، ١.٥٨ ملي مول)، وتم تقليب المعلق الناتج في وجود nitrogen لمدة ٤٥ دقيقة وفي خلال هذا الوقت تكون معلق بلون الحليب. بعد ذلك تمت إضافة [1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene]-dichloropalladium(II) (٠.١٠٢ جم، ٠.١٢ ملي مول) إلى هذا المعلق دفعة واحدة، وتم تسخين الخليط عند درجة حرارة ١٠٠°م تقريباً لمدة ٣ ساعات. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تمت إضافة dichloromethane (١٥٠ مل)، وتم غسل المحلول باستخدام hydrochloric acid بتركيز ١ مولار (١٥٠ مل). تم فصل الطور العضوي، وتم تجفيفه باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحه وتركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على زيت خام تتم تنقيته بواسطة كروماتوجراف العمود (ethyl / hexane acetate بنسبة ٥ : ١) للحصول على المنتج في صورة رغوة. أدى السحن باستخدام hexane إلى الحصول على :

4-(2',4'-dichloro-4-ethyl-biphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٥٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

مثال رقم ٩ : تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethyl-2'-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة palladium(II) acetate (٣.٣ مجم، ٠.٠١٥ ملي مول)، ملح :

tris(3-sulfophenyl)phosphine trisodium (٢٢ مجم، ٠.٠٣٨ ملي مول)، :

4-chloro-2-methylphenyl boronic acid (٠.١٥٢ جم، ٠.٨٩ ملي مول)،

4-(5-bromo-2-ethyl-phenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٠٨ جم، ٠.٥٩ ملي

مول) و potassium phosphate (٠.٦٢٥ جم، ٢.٩٥ ملي مول) إلى قارورة ميكروويف. بعد ذلك

تمت إضافة محلول مختلط منزوع الغازات من acetonitrile / ماء مقطر (١.٥ مل، بنسبة ١ : ١)

٥ (مع غسيل أية مواد صلبة من على جوانب القارورة)، متبوعاً بالتقليب لمدة ٥ دقائق والغسيل

باستخدام argon .

تم بعد ذلك تسخين هذا الخليط عند ١٦٠°م في وجود أشعة الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة. بعد التبريد

إلى درجة حرارة الغرفة تم تخفيف خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate (٣ مل) تم إكسابه

الخاصية الحمضية إلى الرقم الهيدروجيني pH ٢ باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف. تم

١٠ فصل الطور العضوي واستخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate

(٢ x ٣ مل). بعد ذلك تم تجميع كافة المواد العضوية، وتم ترشيحها من خلال سداة silica وتم

تبخيرها للحصول على منتج خام تمت إذابته في N,N-dimethylformamide (٢.٥ مل) وتمت

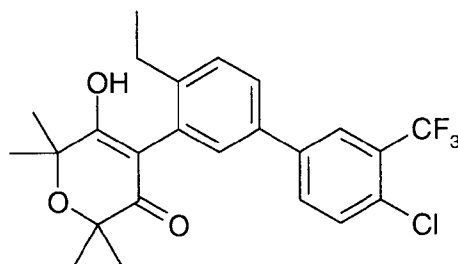
تنقيته بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-(4'-chloro-4-ethyl-2'-methylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

١٥ (٠.١٣٩ جم) في صورة مسحوق أبيض.

مثال رقم ١٠: تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethyl-3'-trifluoromethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



إلى قارورة ميكروويف تمت إضافة palladium(II) acetate (٣.٣ مجم، ٠.٠١٥ ملي مول)، ملح tris(3-sulfophenyl)phosphine trisodium (٢٢ مجم، ٠.٠٣٨ ملي مول)،

4-chloro-3-trifluoromethylphenyl boronic acid (٠.٢٠٠ جم، ٠.٨٩ ملي مول)، :

٥ 4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٠٨ جم، ٠.٥٩ ملي

مول) و potassium phosphate (٠.٦٢٥ جم، ٢.٩٥ ملي مول). بعد ذلك تمت إضافة محلول

مختلط منزوع الغازات من acetonitrile / ماء مقطر (١.٥ مل، بنسبة ١ : ١) (مع غسيل أية مود

صلبة من على جوانب القارورة)، متبوعاً بالتقليب لمدة ٥ دقائق والغسيل باستخدام argon. تم بعد

ذلك تسخين هذا الخليط عند ١٦٠°م في وجود أشعة الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة. بعد التبريد إلى

١٠ درجة حرارة الغرفة تم تخفيف خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate (٣ مل) وتم إكسابه الخاصية

الحمضية إلى الرقم الهيدروجيني pH ٢ باستخدام hydrochloric acid مائي مخفف. تم فصل الطور

العضوي وتم استخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate (٢ × ٣ مل).

بعد ذلك تم تجميع كافة المواد العضوية، وتم ترشيحها من خلال سداة silica وتم تبخيرها

للحصول على منتج خام تمت إذابته في N,N-dimethylformamide (٢.٥ مل) وتمت تنقيته

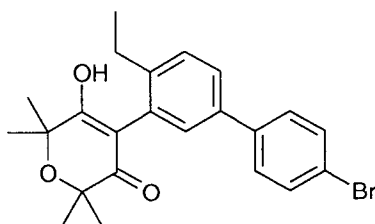
١٥ بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-(4'-chloro-4-ethyl-3'-trifluoromethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.١٤٣ جم) في صورة مسحوق أبيض.

مثال رقم ١١: تحضير :

4-(4'-bromo-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



خطوة ١ أ:

٥ تمت إضافة 4-(4'-Amino-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.٢٦٠ جم، ٠.٧١ ملي مول) بالتقطيط إلى خليط من hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في

الماء ، ١.٧ مل) وماء (١.٢ مل)، وبمجرد اكتمال الإضافة تم تسخين الخليط إلى ٤٠ ° م وتم

تقليبه لمدة ٢٠ دقيقة، قبل تبريده إلى ٥ ° م في حمام من الثلج. تمت إضافة محلول من sodium

nitrite (٠.٠٩٩ جم، ١.٤٠ ملي مول) في ماء (١.٢ مل) بالتقطيط على مدى ٢٠ دقيقة، وبمجرد

١٠ اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط عند درجة حرارة ٥ ° م لمدة ٤٥ دقيقة أخرى.

خطوة ١ ب

في أثناء ذلك، تمت إضافة copper sulfate pentahydrate (٠.٣٨٨ جم، ١.٥٥ ملي مول) إلى

محلول من hydrobromic acid (٤٨٪ بالوزن في الماء ، ٣.٣ مل) عند ٧٠ ° م دفعة واحدة وتم

تقليب الخليط عند درجة حرارة ٧٠ ° م لمدة دقيقتين للحصول على محلول بلون أرجواني قاتم، ثم

١٥ تمت إضافة مسحوق النحاس (٠.١٣٥ جم، ٢.١٥ ملي مول) و(٠.٠٣٠ جم، ٠.٤٧ ملي مول)،

مما نتج عنه معلق قرنفلي اللون.

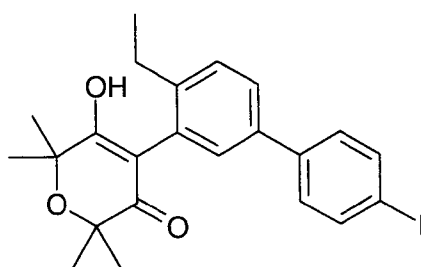
خطوة ١ ج

تمت إضافة الخليط المحتوي على ملح diazonium (تم تحضيره في الخطوة ١ أ) بالتنقيط إلى الخليط الذي تم تقليبه والذي تم تحضيره في خطوة ١ ب عند ٥٥° م ، متبوعاً بالتسخين عند ٧٠° م لمدة ٤٥ دقيقة أخرى. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم استخلاص خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate ، وتم غسله بالماء ومحلول ملحي، ثم تم تجفيفه باستخدام magnesium sulfate غير مائية وتركيزه في وسط مفرغ. أدت التنقية بواسطة كروماتوجراف العمود الومضي (hexane / ethyl acetate بنسبة ٣ : ١) إلى الحصول مادة صلبة خام تم سحنها بالـ diethyl ether / hexane للحصول على :

4-(4'-bromo-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٠٤٥ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

١٠ مثال رقم ١٢ : تحضير :

4-(4'-iodo-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة 4-(4'-amino-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٦٥ جم، ١.٨٠ ملي مول) إلى محلول من para-toluenesulfonic acid monohydrate (١.٠٣ جم، ٥.٤٠ ملي مول) في acetonitrile (١١ مل)، متبوعاً بالتقليب لمدة ١٠ دقائق عند درجة حرارة الغرفة ثم التبريد إلى ١٠° م . بعد ذلك تمت إضافة محلول مختلط ثان من sodium nitrite (٠.٢٥ جم، ٣.٦٠ ملي مول) و potassium iodide (٠.٧٦ جم، ٤.٥٠ ملي مول) في ماء مقطر (١.٣ جم، ٩.٠ ملي مول).

(مل) إلى هذا الخليط، ثم تم تقليب الخليط عند ١٠° م لمدة ٢٠ دقيقة ثم عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعتين. تمت إضافة محلول sodium bicarbonate المائية حتى تم الوصول إلى الرقم الهيدروجيني pH ٩-١٠، متبوعاً بالتخفيف باستخدام ethyl acetate والغسيل باستخدام sodium metabisulfite المائية المشبعة (٢٠ مل). بعد المزيد من استخلاص الطور المائي باستخدام ethyl acetate (٢ ×)، تم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وغسلها بماء مقطر ومحلول ملحي، ثم تم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية وتركيزها في وسط مفرغ. تمت تنقية هذا المنتج الخام بواسطة كروماتوجراف العمود الوميضي باستخدام ethyl acetate / hexane silica gel بنسبة ٣ : ١) للحصول على مادة صمغية برتقالية اللون، تم سحنها بـ hexane للحصول على :

4-(4'-iodo-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٤١٣ جم) في

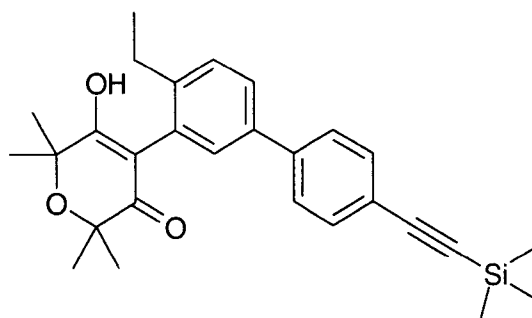
١٠ صورة مادة صلبة بيضاء.

مثال رقم ١٣: تحضير :

4-(4-ethyl-4'-ethynylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

خطوة ١: تحضير :

4-[4-ethyl-4'-(trimethylsilylethynyl)biphenyl-3-yl]-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



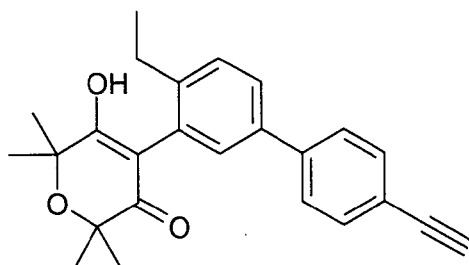
تم تسخين خليط من 4-(4'-iodo-4-ethyl-biphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٠٠ جم، ٠.٤٢ ملي مول)، trimethylsilylacetylene (٠.١٠ مل، ٠.٤٧ ملي مول)، copper(I) iodide (٤ مجم، ٠.٠٢٣ ملي مول)، bis(triphenylphosphine)palladium(II) chloride (٠.٠١٦ جم، ٠.٠٢٣ ملي مول)، triphenylphosphine (٠.٠٢٢ جم، ٠.٠٠٨٤ ملي مول) و diethylamine (٠.٦٥ مل) في N,N-dimethylformamide غير مائي (٠.٢٥ مل) عند ١٢٠° م في وجود أشعة الميكروويف لمدة ٢٥ دقيقة. بعد ذلك تم السماح لهذا الخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة وترشيحه من خلال تراب دياتومي (مع المزيد من الغسيل باستخدام dichloromethane). تمت إزالة المذيب تحت ضغط مخفض وتمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف العمود الوعائي باستخدام ethyl acetate / hexane silica gel بنسبة ٩ : ١ إلى ١٠ : ٣ للحصول على :

4-[4-ethyl-4'-(trimethylsilylethynyl)biphenyl-3-yl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.١٤٣ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء اللون يتم استخدامها دون المزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٢: تحضير :

4-(4-ethyl-4'-ethynylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة potassium carbonate مسحوقة (٠.١٧٧ جم، ١.٢٨ ملي مول) إلى محلول من :
٢٥٢١

4-[4-ethyl-4'-(trimethylsilylethynyl)biphenyl-3-yl]-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione

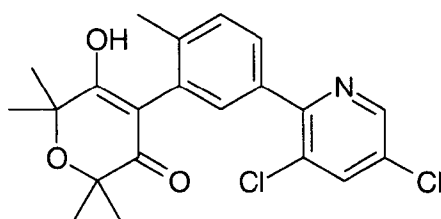
(٠.١٤٣ جم، ٠.٣٢ مللي مول) في methanol (٦.٥ مل)، وتم تقليب الخليط عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعة. بعد ذلك تمت إضافة ماء لإذابة كافة المواد غير العضوية، وتم تركيز الخليط في وسط مفرغ. تمت إضافة hydrochloric acid بتركيز ٢ مولار للوصول إلى الرقم الهيدروجيني pH ٣-٢، ثم تم استخلاص المادة المرغوب فيها باستخدام ethyl acetate (٣ ×). تم تجميع كافة المواد العضوية، وتم غسلها بمحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية ثم تم تركيزها في وسط مفرغ. تتم تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود الوميضي باستخدام silica gel (ethyl acetate / hexane بنسبة ٤ : ١) للحصول على :

4-(4-ethyl-4'-ethynylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٠٧٠ جم) في

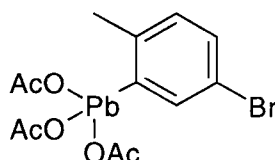
١٠ صورة مادة صلبة صفراء.

مثال رقم ١٤: تحضير :

4-[5-(3,5-dichloropyridin-2-yl)-2-methylphenyl]-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



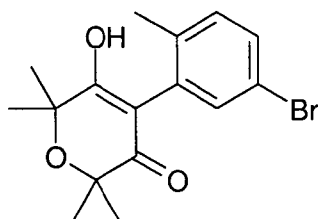
خطوة ١: تحضير 5-bromo-2-methylphenyllead triacetate



تمت إضافة chloroform غير مائي (٣٥ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (١١.٢٥ جم، ٢٥.٤٠ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.٤٠ جم، ١.٢٧ ملي مول)، تم غسله بالكامل nitrogen. تم تسخين هذا الخليط إلى ٤٠°م، وتمت إضافة :

5-bromo-2-methylphenylboronic acid (٤.٩٦ جم، ٢٣.١٠ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين المعلق عند درجة الحرارة هذه لمدة ٥ ساعات. بعد ذلك تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، متبوعاً بمزيد من التبريد إلى صفر°م ثم تمت إضافة potassium carbonate غير مائية مسحوقة (١.٦١ جم) مع التقليب السريع لمدة ٥ دقائق. تم ترشيح الخليط، تم تركيز ناتج الترشيح إلى نصف حجمه، وتمت إضافة hexane لحث الترسيب. تم تركيز هذا الخليط على نحو أكبر، وتمت إزالة المذيب بالترويق، وتم غسل المادة الصلبة بـ hexane للحصول على 5-bromo-2-methylphenyllead triacetate (١٠.١٠ جم) في صورة مادة صلبة بلون رملي.

خطوة ٢: تحضير 4-(5-bromo-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (٢٠٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٦.٠٠ جم، ٣٥.٢٩ ملي مول) و

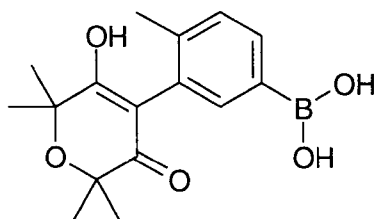
N,N-dimethylaminopyridine (٢١.٦٢ جم، ١٧٧.٢١ ملي مول)، متبوعاً بالتقليب عند درجة حرارة الغرفة حتى الذوبان. إلى هذا المحلول تمت إضافة toluene غير مائي (٥٥ مل)، متبوعاً 5-bromo-2-methylphenyllead triacetate (٢١.٦٠ جم، ٣٨.٩٩ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين

خليط التفاعل عند ٨٠° م لمدة ساعتين. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، ثم تم تخفيفه باستخدام dichloromethane (٣٠٠ مل) و hydrochloric acid مائي (٣٠٠ مل)، تم تدويم الخليط لمدة ٥ دقائق وترشيحه لإزالة المواد المتبقية غير العضوية. تم غسل عجينة ناتج الترشيح باستخدام dichloromethane ، وتم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول ٥ على خام صلب تتم إعادة بلورته من hexane/dichloromethane . بعد ذلك تمت تنقية هذه المادة على نحو اكبر بواسطة كروماتوجراف العمود الوميضي (ethyl acetate / hexane بنسبة ٥: ١). تمت إزالة المواد المتبقية الرصاصية بإذابة المادة الناتجة (٦.٥٠ جم تقريباً) في chloroform (١٠٠ مل) والتقليب باستخدام silica gel مرتبط بالمجموعة الوظيفية 3-mercaptopropyl ١٠ (٦.٥٠ جم، ١.٢٠ ملي مول /جم حمل) طوال الليل. تم ترشيح الخليط وتم تركيزه في وسط مفرغ للحصول على :

4-(5-bromo-2-methyl-phenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٦.٥٠ جم) في صورة مسحوق بلون الكريم.

خطوة ٣: تحضير :

4-methyl-3-(2,2,6,6-tetramethyl-3,5-dioxotetrahydropyran-4-yl)phenylboronic acid ١٥



تمت إذابة 4-(5-Bromo-2-methyl-phenyl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione (٥ جم، ٠.٠١٤٧ مول) في tetrahydrofuran غير مائي (١٥٠ مل)، وتم تبريد خليط التفاعل إلى صفر° م

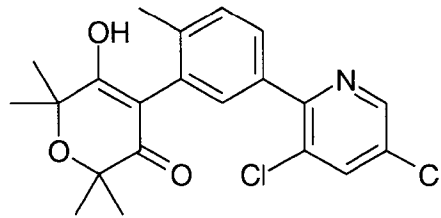
وتمت إضافة sodium hydride (٧٠٨ مجم، ٠.٠٢٩٤ مول، ٦٠٪ مشنت في الزيت). تم تقليب الخليط لمدة ٣٠ دقيقة، ثم تم تبريده إلى -٧٨°م. تمت إضافة n-Butyllithium (١٤.٧ مل، ٠.٠٢٩٤ مول، محلول بتركيز ٢ مولار في cyclohexane)، بالتدقيق على مدى ١٠ دقائق تقريباً وتم تقليب الخليط لمدة ١٥ دقيقة قبل إضافة trimethylborate (٤.٩٥ مل، ٠.٠٤٤٢ مول). تم تقليب خليط التفاعل لمدة ٤٥ دقيقة أخرى، وتم السماح له بالتبريد إلى درجة الحرارة الجو المحيط ثم تم تقليبه لمدة ١.٥ ساعة أخرى قبل إخماده باستخدام hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ مولار. تم تقليب خليط التفاعل لمدة ساعة واحدة وتم استخلاصه باستخدام dichloromethane. بعد فصل الطور العضوي تمت إزالة المذيبات تحت ضغط مخفض للحصول على مادة صمغية بلون أصفر باهت. أدى السحن باستخدام iso-hexane إلى الحصول على :

4-methyl-3-(2,2,6,6-tetramethyl-3,5-dioxo-tetrahydropyran-4-yl)phenylboronic acid

(٢٠٠١ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

خطوة ٤: تحضير :

4-[5-(3,5-dichloropyridin-2-yl)-2-methylphenyl]-2,2,6,6-tetra-methylpyran-3,5-dione



تمت إضافة : ١٥

4-[5-(3,5-dichloropyridin-2-yl)-2-methylphenyl]-2,2,6,6-tetra-methylpyran-3,5-dione

(٢٠٠ مجم، ٠.٦٥٧ ملي مول)، 2-bromo-3,5-dichloropyridine (١٤٩ مجم، ٠.٦٥٧ ملي

مول)، palladium acetate (٣.٧ مجم، ٠.٠١٦٤ ملي مول)، ملح :

potassium tris(3-sulfophenyl)phosphine trisodium (٢٢ مجم، ٠.٠٣٩٤ ملي مول) و

phosphate (٦٩٧ مجم، ٣.٢٨ مول) إلى قارورة ميكروويف، متبوعاً بخليط مذيب منزوع الغازات

من ماء / acetonitrile (١.٦ مل، بنسبة ٢:١). تم غسل الخليط باستخدام nitrogen ثم تم تقليبه

عند درجة حرارة الجو المحيط لمدة ٥ دقائق قبل تسخينه عند ١٦٠°م في بأشعة الميكروويف لمدة

١٥ دقيقة. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تمت تجزئة خليط التفاعل بين hydrochloric acid

مائي بتركيز ٢ مولار و dichloromethane ، وتم فصل الطور العضوي. تم استخلاص الطور

المائي على نحو أكبر باستخدام dichloromethane و تم تجميع كافة الأجزاء العضوية ثم تم

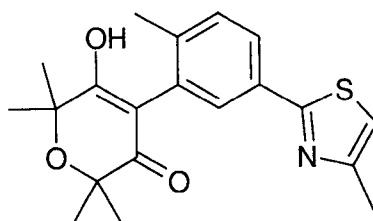
١٠ تبخيرها. تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-[5-(3,5-dichloropyridin-2-yl)-2-methylphenyl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(١١٣ مجم) .

مثال رقم ١٥ : تحضير :

4-[2-methyl-5-(4-methylthiazol-2-yl)phenyl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



١٥

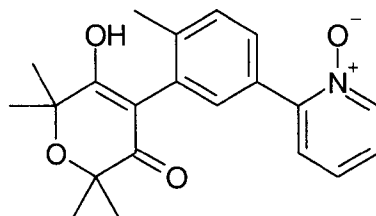
إلى خليط من :

٢٠٠) 4-[2-methyl-5-(4-methylthiazol-2-yl)phenyl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione
 مجم، ٠.٥٨٩ ملي مول)، 4-methylthiazole (٧٠ مجم، ٠.٧٠٧ ملي مول)، silver carbonate
 (٨١٤ مجم، ٢.٩٤ ملي مول)، triphenylphosphine (١٥ مجم، ٠.٠٥٨٩ ملي مول) و [1,1-
 bis(diphenylphosphino)-ferrocene]palladium(II)chloride (٢٤ مجم، ٠.٠٢٩٤ ملي مول)
 ٥ تمت إضافة خليط مذيب منزوع الغازات من الماء/ acetonitrile (١.٥ مل، بنسبة ١ : ١)، متبوعاً
 بالنيتروجين nitrogen ثم التسخين عند درجة حرارة ٦٥°م لمدة ٦٥ ساعة مع الرج. بعد التبريد إلى
 درجة حرارة الغرفة تمت تجزئة الخليط التفاعل بين hydrochloric acid مائيتركيز ٢ مولار
 و dichloromethane ، وتم فصل الطور العضوي. تم غسل الطبقة المائية بجزء آخر من
 dichloromethane ، وتم تبخير الطبقات العضوية المجمعة تحت ضغط مخفض للحصول على
 ١٠ مادة صلبة بنية تتم تنقيتها بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-[2-methyl-5-(4-methylthiazol-2-yl)phenyl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione في
 صورة مادة صلبة بلون أصفر باهت (٣٦ مجم).

مثال رقم ١٦ : تحضير :

4-[2-methyl-5-(1-oxypyridin-2-yl)phenyl]-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



١٥

تم تسخين خليط من :

٠.٠٨٨٨ مجم، ٣٠) 4-(5-bromo-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione

١) ملي مول)، pyridine-N-oxide (٣٣.٧ مجم، ٠.٣٥٥ ملي مول)، palladium acetate

مجم، ٠.٠٠٤٤ ملي مول)، potassium carbonate (٢٤.٥ مجم، ٠.١٧٧٥ ملي مول) و

toluene tri-tert-butylphosphonium tetrafluoroborate (٣.٨٦ مجم، ٣٣.٠٠١ ملي مول) في

٥ (١ مل) عند درجة حرارة ١١٠°م لمدة ١٨ ساعة مع الرج. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم

تبخير خليط التفاعل تحت ضغط مخفض وتمت تنقية المادة المتبقية بواسطة HPLC تحضير في

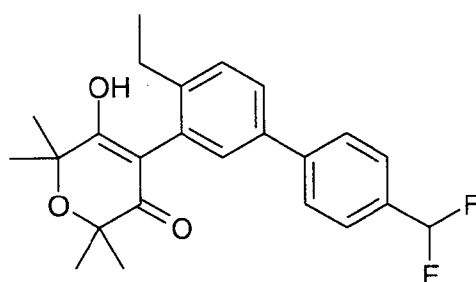
الطور العكسي للحصول على :

٥.٢) 4-[2-methyl-5-(1-oxy-pyridin-2-yl)phenyl]-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

مجم) في صورة مادة صمغية عديمة اللون.

١٠ مثال رقم ١٧: تحضير :

4-(4'-Difluoromethyl-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



تمت إضافة (diethylamino)sulfur trifluoride (٠.١٤ مل، ١.٠٦ ملي مول) إلى محلول من 4-

(4'-carbaldehyde-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.١١٠ جم،

١٥ ٠.٣ ملي مول) في dichloromethane غير مائي (٤ مل) بالتقطيع عند صفر°م. بعد التقليب لمدة

ساعة واحدة تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، وتم تقليب المحلول على نحو أكبر

طوال الليل. بعد ذلك تم تبريد المحلول في حمام ثلج وتمت إضافة sodium carbonate مائية

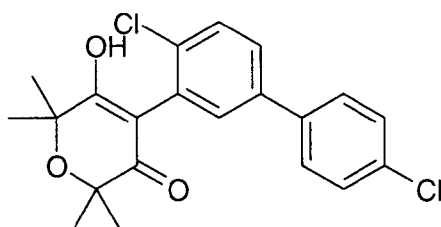
مشبعة (٤ مل) مع التقليب بقوة على مدى ٣٠ دقيقة. تم تخفيف خليط التفاعل باستخدام ethyl acetate (٢ ×) ثم تم فصل الطورين وتم استخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate . تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتم غسلها بمحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية. تم ترشيح الخليط، وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ وتنقية المادة المتبقية بواسطة الكروماتوجراف التحضير في الطور العكسي للحصول على :

٠.٠١٥ 4-(4'-difluoromethyl-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

مثال رقم ١٨: تحضير :

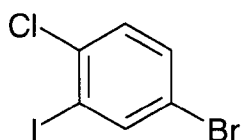
4-(4,4'-dichlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



١٠

خطوة ١: تحضير

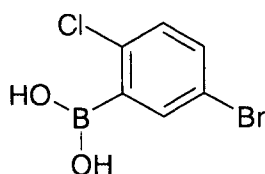
4-bromo-1-chloro-2-iodobenzene



تمت إضافة tert-Butyl nitrite (٣ مل، ٢٥ ملي مول) إلى معلق من copper(II) chloride (٢.٧١ جم، ٢٠ ملي مول) في acetonitrile (٦٠ مل) وتم تسخين الخليط مع التقليب إلى درجة حرارة ٦٠ °م . تمت إضافة محلول من 4-bromo-2-iodoaniline (٥ جم، ١٧ ملي مول) في

acetonitrile (١٥ مل) بالتقطيط، وبمجرد اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط عند درجة حرارة ٦٠° م لمدة ٢.٥ ساعة. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة الغرفة، وتم صبه في ٢٠٪ من hydrochloric acid مائي وتم استخلاصه باستخدام diethyl ether. تم تجفيف المادة المستخلصة العضوية باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تمت تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام silica gel للحصول على 4-bromo-1-chloro-2-iodobenzene (٤.٣٢ جم) في صورة زيت.

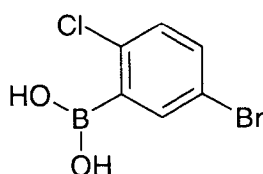
خطوة ٢: تحضير 5-bromo-2-chlorophenylboronic acid



تمت إذابة 4-Bromo-1-chloro-2-iodobenzene (١٠.٣٥ جم، ٣٣ ملي مول) في tetrahydrofuran غير مائي (٦٠ مل) وتم تبريد المحلول إلى -٧٥° م في جو من argon. تمت إضافة isopropylmagnesium chloride (١٧.١ مل، ٣٤ ملي مول، محلول بتركيز ٢ مولار في tetrahydrofuran) بالتقطيط على مدى ٣٠ دقيقة، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة عند أقل من -٧٠° م بالتبريد الخارجي. بمجرد اكتمال الإضافة، يتم تقليب خليط التفاعل عند -٧٠° م تقريباً لمدة ٣٠ دقيقة ثم تم السماح له بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة وتم تقليبه لمدة ساعة. بعد ذلك تم تبريد خليط التفاعل إلى -٧٨° م وتمت إضافة trimethylborate (٧.٣ مل، ٦٥ ملي مول) بالتقطيط. تم تقليب الخليط عند درجة حرارة -٧٨° م لمدة ٣٠ دقيقة ثم تمت إزالة حمام التبريد وتم تقليب الخليط عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١.٥ ساعة. تمت إضافة hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ مولار (٣٠ مل)، ثم تم استخلاص المنتج الخام باستخدام ethyl acetate. تم غسل الطور العضوي بالماء ومحلول ملحي، وتم تجفيفه باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحه وتبخير

ناتج الترشيح في وسط مفرغ. أدى السحن بـ hexane إلى الحصول على 5-bromo-2-chlorophenylboronic acid (٦.١٦ جم) في صورة مادة صلبة مائلة للبياض.

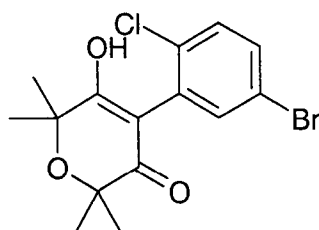
خطوة ٣: تحضير : 5-bromo-2-chlorophenylboronic acid



تمت إضافة chloroform غير مائي (٢.٥ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (١.٤٦ جم، ٣.٣ ملي مول) و mercuric diacetate (٤٢ مجم، ٠.١٣ ملي مول)، تم غسله بالكامل بالنيتروجين، وتم تقليب الخليط التفاعل وتسخينه إلى ٤٠° م. تمت إضافة :

5-bromo-2-chlorophenylboronic acid (٠.٦٢ جم، ٢.٦ ملي مول) دفعة واحدة، وتم تقليب الخليط التفاعل عند ٤٠° م لمدة ٤ ساعات. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تمت إضافة potassium carbonate (٠.١٨ جم)، تم تقليب الخليط بقوة لمدة ٥ دقائق وبعد ذلك تم ترشيحه. تم تركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على 5-bromo-2-chlorophenyllead triacetate (١.٢٣ جم)، وتم استخدامه دون المزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٤: تحضير : 4-(5-bromo-2-chlorophenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (١٢٠ مل) إلى خليط من 2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٢.٧٨ جم، ١٦.٣ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (٩.٩٧ جم، ٨١.٦ ملي مول). تمت إضافة toluene غير مائي (٣٠ مل) إلى هذا المحلول، متبوعاً بـ

5-bromo-2-chlorophenyllead triacetate (١٠.٣٢ جم، ١٨ ملي مول) دفعة واحدة وتم تسخين

خليط التفاعل عند ٨٠ ° م طوال الليل. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، ثم تم

تخفيفه dichloromethane (١٢٠ مل) و hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ مولار (٢٥٠ مل)،

متبوعاً بالترشيح من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية. تم غسل عجينة ناتج

الترشيح باستخدام dichloromethane ، وتم تجميع كافة الأجزاء العضوية، وتم غسلها باستخدام

hydrochloric acid بتركيز ٢ مولار، وماء ومحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium

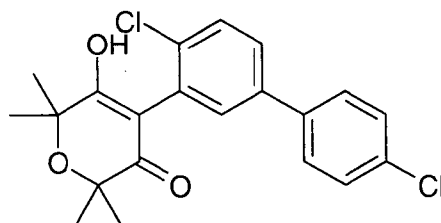
sulfate غير مائية ثم تم تركيزها في وسط مفرغ. تم تنقية المادة في النهاية بواسطة كروماتوجراف

العمود الوميسي باستخدام silica gel للحصول على :

4-(5-bromo-2-chlorophenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٤٤ جم) يتم بالنقاء

الكافي لاستخدامه مباشرة في الخطوة التالية.

خطوة ٥: تحضير 4-(4,4'-dichlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione :



تم تقليب خليط من :

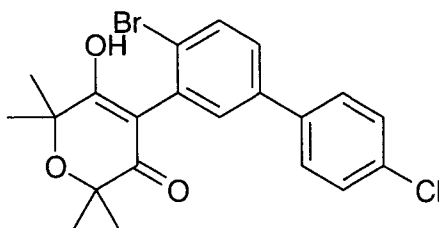
4-(5-bromo-2-chlorophenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٢٢ جم، ٠.٦ ملي مول)، 4-chlorophenylboronic acid (٠.١٤ جم، ٠.٩ ملي مول)، و cesium fluoride (٠.٢٨ جم، ١.٨ ملي مول) معاً في 1,2-dimethoxyethan (٢.٤ مل) في جو من nitrogen عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٤٥ دقيقة. تمت إضافة :

٥ [1,1'-bis(diphenyl-phosphino)ferrocene]dichloropalladium(II) (٨٠ مجم، ٠.٠٩٨ ملي مول) وتم تسخين خليط التفاعل عند ٨٠° م طوال الليل. تم ترشيح خليط التفاعل من خلال تراب دياتومي، مع غسيل عجينة ناتج الترشيح باستخدام dichloromethane (٧ مل) وماء (٣ مل). تم إكساب الخليط الخاصية الحمضية إلى الرقم الهيدروجيني pH بإضافة hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ مولار، وتم فصل الطور العضوي. تم استخلاص الطور المائي باستخدام dichloromethane ، وتم تجميع كافة المواد المستخلصة العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتبخير ناتج الترشيح . تمت إذابة المادة المتبقية في N,N-dimethylformamide (١ مل تقريباً) وتمت تنقيتها بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

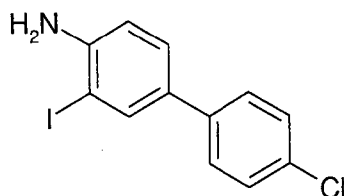
4-(4,4'-dichlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٨٠ مجم).

١٥ مثال رقم ١٩: تحضير :

4-(4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



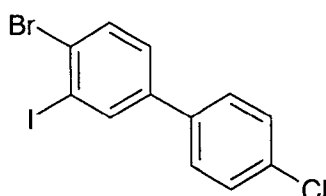
خطوة ١: تحضير 4'-chloro-3-iodobiphenyl-4-ylamine :



إلى محلول من 4'-chlorobiphenyl-4-ylamine (٢.٠٣ جم، ٠.٠١ ملي مول) في نظام مذيب مختلط من methanol (١٠ مل) والماء المقطر (٤٠ مل) تمت إضافة potassium chlorate (٠.٨٣٠ جم، ٦.٧٧ ملي مول) و potassium iodide (٣.٣٢ جم، ٠.٠٢ مول). بعد تسخين خليط التفاعل إلى ٨٠° م ، تمت إضافة hydrochloric acid مركز (٠.٦٠ مل)، وتم تسخين الخليط على نحو أكبر طوال الليل عند درجة الحرارة هذه. تم تبريد المحلول إلى درجة حرارة الغرفة وتم استخلاص المنتج الخام باستخدام diethyl ether (٣ ×)، متبوعاً بغسيل الأجزاء العضوية المجمعة باستخدام ٥% من محلول مائي من sodium thiosulfate وماء مقطر. تم تجفيف الطور العضوي باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحه وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على مادة صلبة داكنة، يتم سحنها بال hexane للحصول على :

4'-chloro-3-iodobiphenyl-4-ylamine (٢.٩٤ جم) في صورة مادة صلبة ذات لون بني فاتح.

خطوة ٢: تحضير 4-bromo-4'-chloro-3-iodobiphenyl:

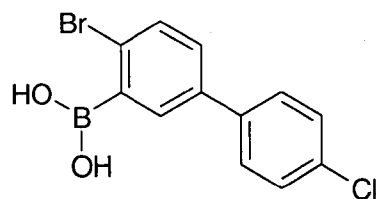


١٥ يتم سحق 4'-Chloro-3-iodobiphenyl-4-ylamine (١٣.٥ جم، ٠.٠٤١ مول) إلى مسحوق دقيق الجسيمات وتعليقه في خليط من ٤٨% hydrogen bromide مائي (٥٤ مل) وماء مقطر (٤٢

(مل). بعد ذلك تم تسخين هذا المعلق إلى درجة حرارة ٤٥° م لمدة ٣٠ دقيقة، ثم تم تبريده إلى درجة حرارة صفر -٥° م وتمت إضافة محلول من sodium nitrite (٣.٥٤ جم، ٠.٠١٢٥ مول) في ماء مقطر (٦ مل) بالتدقيق، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة الداخلية عند أقل من ٥° م في الخليط بالكامل. بعد ذلك تمت إضافة هذا الخليط بالتدقيق إلى معلق ثان سابق التكوين من copper sulfate pentahydrate (II) (١٥ جم، ٠.٠٦ مول) ومسحوق النحاس (٥.٢٩ جم، ٠.٠٨٤ مول) في ٤٨٪ من hydrogen bromide مائي (٨٠ مل) عند درجة حرارة ٨٠° م. عند اكتمال الإضافة تم تقليب خليط التفاعل عند ٨٠° م لمدة ٩٠ دقيقة أخرى. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة، تمت إضافة ethyl acetate وتم صب خليط التفاعل في ماء مقطر وتم فصل الطبقتين. تم استخلاص الطور المائي على نحو أكبر باستخدام ethyl acetate (٢×)، وتم غسل المواد المستخلصة العضوية المجمعة بماء مقطر حتى تم الوصول إلى رقم هيدروجيني pH طبيعي، ثم تم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية. تم ترشيح الخليط، وتم تبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ، وتمت تنقية المادة المتبقية على نحو أكبر بواسطة كروماتوجراف العمود الوميسي باستخدام silica gel (مادة شطف من hexane) للحصول على :

4-bromo-4'-chloro-3-iodobiphenyl (١٠.٥ جم) في صورة سائل بلون برتقالي باهت.

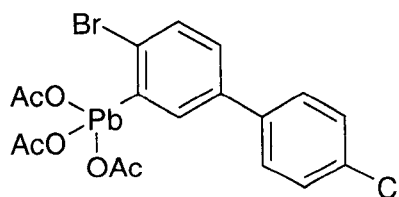
خطوة ٣: تحضير 4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-ylboronic acid



تمت إضافة isopropylmagnesium bromide (٣١.٦٠ مل، ١٥٪ في tetrahydrofuran) بالتدقيق إلى محلول من 4-bromo-4'-chloro-3-iodobiphenyl (٨.٠٠ جم، ٢٠.٤٠ ملي مول) في نظام

مذيب مختلط من diethyl ether غير مائي (٨٠ مل) و tetrahydrofuran غير مائي (٨٠ مل) عند درجة حرارة -٧٥ ° م، مع الاحتفاظ بدرجة حرارة خليط التفاعل عند أقل من -٧٠ ° م. عند اكتمال الإضافة تم تقليب الخليط عند درجة حرارة -٧٥ ° م لساعتين أخريين، ثم تم السماح له بالتسخين إلى درجة حرارة -٢٥ ° م وعند هذه النقطة تمت إضافة trimethylborate (٣.١٥ جم، ٣٠.٦٠ ملي مول) بالتدقيق. بعد اكتمال الإضافة، تم السماح للخليط بالتسخين إلى درجة حرارة الغرفة وتم تقليبه طوال الليل، متبوعاً بالتبريد في حمام ثلج وإكساب الخليط الخاصية الحمضية باستخدام hydrochloric acid مائي بتركيز ٢ مولار. تم استخلاص المنتج الخام باستخدام ethyl acetate (٣×)، وتم تجميع الأجزاء العضوية، وتم غسلها بمحلول ملحي، ثم تم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية. تم ترشيح الخليط وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على مادة صلبة يتم سحنها بالـ hexane على نحو أكبر للحصول على 4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl-boronic acid (٥.٢٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

خطوة ٤: تحضير 4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yllead triacetate :



تمت إضافة chloroform غير مائي (٢٥ مل) إلى خليط من lead tetraacetate (٣.٧٦ جم، ٨.٤٩ ملي مول) و mercuric diacetate (٠.٢٧ جم، ٠.٨٥ ملي مول)، ثم غسله بالكامل nitrogen. تم تسخين هذا الخليط إلى ٤٠ ° م، وتمت إضافة :

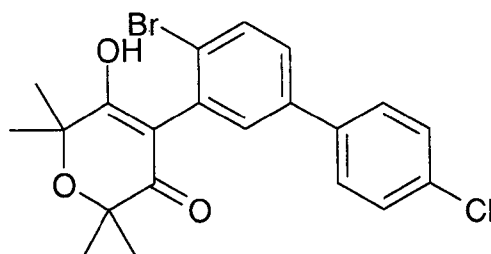
4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl-boronic acid (٢.٤٠ جم، ٧.٧٢ ملي مول) دفعة واحدة، وتم تقليب الخليط وتسخينه عند درجة الحرارة هذه لمدة ٤ ساعات. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة،

تم تخفيف الخليط باستخدام chloroform (٢٥ مل)، وتم تبريده في حمام ثلج، وتمت إضافة potassium carbonate مسحوقة غير مائية (٢.٧٥ جم) بسرعة، متبوعاً بالتقليب السريع لمدة ٥ دقائق. تمت إزالة المواد الصلبة بالترشيح، وتم تركيز ناتج الترشيح إلى ربع حجمه تقريباً. تمت إضافة hexane لحث التبلور، وتم تبخير المذيبات في وسط مفرغ. أدى السحن بـ hexane إلى الحصول على :

4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yllead triacetate (٣.٢٥ جم)، يتم استخدامه دون المزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٥: تحضير :

4-(4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



تمت إضافة chloroform غير مائي (٤٠ مل) إلى خليط من :

2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٧٥ جم، ٤.٩ ملي مول) و

N,N-dimethylaminopyridine (٢.٥٢ جم، ٢٠.٦ ملي مول)، متبوعاً بالتقليب عند درجة حرارة

الغرفة حتى الذوبان. تمت إضافة toluene غير مائي (١٢ مل) إلى هذا المحلول، متبوعاً:

4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yllead triacetate (٣.٢٥ جم، ٥.١ ملي مول) دفعة واحدة وتم

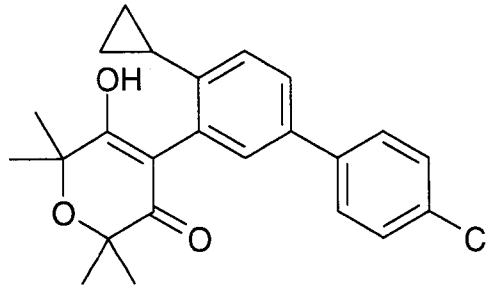
تسخين خليط التفاعل عند ٨٠°م لمدة ساعتين. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة الغرفة، وتم تخفيفه

باستخدام chloroform (٥٠ مل) و hydrochloric acid مائي بتركيز ١ مولار (٥٠ مل)، وتم تقليب الخليط لمدة ٥ دقائق. تمت إزالة ناتج الترسيب بالترشيح، وتم فصل الطورين، وتم غسل الطور العضوي بمحلول ملحي، وتم تجفيفه باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحه وتبخير ناتج الترشيح في وسط مفرغ. تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف العمود الوميسي باستخدام silica gel ، وتم تجميع الأجزاء المحتوية على المركب المرغوب فيه وتم تبخيره للحصول على مادة متبقية تتم تنقيتها على نحو أكبر بواسطة HPLC تحضير في الطور العكسي للحصول على :

4-(4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٠١٣ جم).

مثال رقم ٢٠: تحضير :

4-(4'-chloro-4-cyclopropylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-pyran-3,5-dione



تضاف palladium acetate (٠.٠١٠ جرام ، ٠.٠٤٤ مليمول) الى محلول مقلب من :

4-(4'-chloro-4-cyclopropylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.٣٩٠ جرام ، ٠.٩٠ مليمول) و cyclopropylboronic acid (٠.١٠٠ جرام ، ١.١٦ مليمول

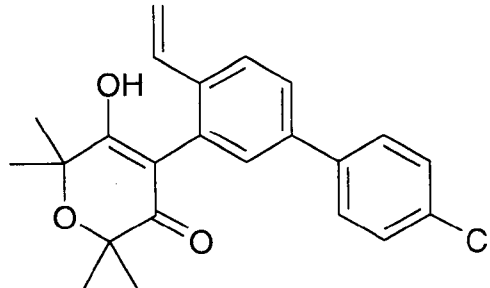
(٠.٦٦٥ جرام ، ٣.١٤ مليمول) و potassium phosphate (١٥

tricyclohexylphosphine (٠.٠٢٥ جرام ، ٠.٠٠٩ مليمول) في نظام مذيب مختلط من toluene (٤ مل) وماء مقطر (٠.٢ ملي) . بعد ذلك يسخن هذا الخليط في ١٠٠ درجة مئوية لمدة ليلة وبعد التبريد الى درجة حرارة الغرفة يخفف المحلول باستخدام ethyl acetate وماء مقطر ثم الترشيح من خلال تراب دياتومي (غسيل اضافي باستخدام ethyl acetate / ماء مقطر) . يتم تحويل الطور المائي الى حمض باستخدام hydrochloric acid مائي 2M في تركيز هيدروجيني pH ٣ ثم يفصل الطور العضوي ويستخلص الطور المائي مرة اخرى باستخدام ethyl acetate (مرتين) . تجمع كل الاجزاء العضوية وتغسل بمحلول ملحي ثم التجفيف فوق magnesium sulfate لا ما ئية والترشيح بعد ذلك . بعد التركيز في الفراغ ينقى الزيت الخام باستخدام HLC بطور ارتجاعي تحضيرى ثم السحق مع hexanes للحصول على :

١٠ 4-(4'-chloro-4-cyclopropylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione (٠.٠١١ جرام) على هيئة مادة صلبة بيضاء .

مثال ٢١ : تحضير :

4-(4'-chloro-4-vinylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione



١٥ يقلب محلول 4-(4-bromo-4'-chlorobiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.٣١٤ جرام ، ٠.٧٢ مليمول) ومركب vinylboronic anhydride pyridine (٠.١٧٥ جرام

، ٠.٧٣ مليمول) lithium hydroxide monohydrate (٠.١٧٧ جرام ، ٤.٢٢ مليمول) و 1,3-

bis(diphenylphosphino)propane (٠.٠١٥ جرام ، ٠.٠٣٦ ملي مول) و palladium acetate (٠.٠١٠ جرام ، ٠.٠٤٤ مليمول) في نظام مذيب مختلط من :

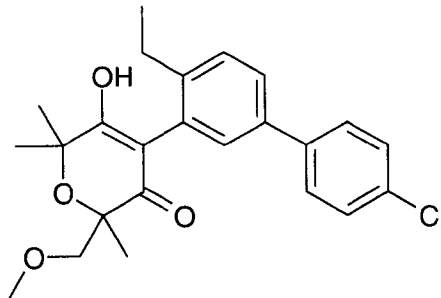
1,2-dimethoxyethane (٥ مل) وماء مقطر (١ مل) في ٨٠ ° م لمدة ٣ ساعات . بعد التبريد الى درجة حرارة الغرفة يرشح الخليط من خلال تراب دياتومي ، متبوعاً بالغسل باستخدام ethyl acetate والماء المقطر . يتم تحويل الطور المائي الى صورة حمضية باستخدام hydrochloric acid حتى تركيز هيدروجيني pH ٣ ثم يفصل الطور العضوي ويتم استخلاص الطور المائي مرة اخرى باستخدام ethyl acetate . تجمع كل الاجزاء العضوية ويلى ذلك التجفيف فوق magnesium sulfate لا مائية والترشيح . بعد التركيز في الفراغ ينقى الزيت الخام باستخدام HPLC بطور ارتجاعي تحضيرى ثم السحق مع hexanes للحصول على :

4-(4'-chloro-4-vinylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

(٠.٠٣٨ جرام) على هيئة مادة صلبة بيضاء اللون

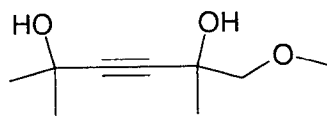
مثال ٢٢ تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2-methoxymethyl-2,6,6-trimethylpyran-3,5-dione



خطوة ١: تحضير 1-methoxy-2,5-dimethylhex-3-yne-2,5-diol ١٥

- ١٣٤ -

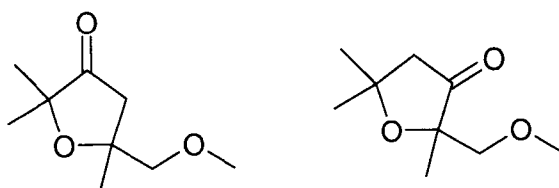


تمت إضافة ethyl magnesium bromide (٣٧، ٣٣ مل، ١١٢ ملي مول، محلول بتركيز ٣ مولار في diethyl ether) إلى محلول غير مائي من diethyl ether عند درجة حرارة صفر - ٥٥ م ، ثم تمت إضافة 2-methyl-3-butyne-2-ol (٤.٧٠ جم، ٥٥.٨٧ ملي مول) بالتقطيط. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، متبوعاً بالتقليب عند درجة الحرارة هذه لمدة ٣٠ دقيقة، ثم عند درجة حرارة ٤٠ م حتى يتوقف تكون الغاز (ساعة واحدة تقريباً). بع ذلك تم تبريد الخليط اللزج إلى درجة حرارة الغرفة وتمت إضافة methoxyacetone (٣.٧٨ جم، ٤٢.٩٠ ملي مول) بالتقطيط، متبوعاً بالتسخين إلى ٤٠ م لمدة ساعة. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم صب المعلق في خليط من ثلج و ammonium chloride مائي مشبع، وتم استخلاص المنتج باستخدام diethyl ether (٢ x ٥٠ مل) ثم dichloromethane (٢ x ٥٠ مل، ٢ x ١٠٠ مل). تم تجميع المواد المستخلصة العضوية، وتم غسلها بمحلول ملحي، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية ثم تركيزها في وسط مفرغ للحصول على :

1-methoxy-2,5-dimethylhex-3-yne-2,5-diol (٦.٩٨ جم) في صورة زيت نقي.

خطوة ٢: تحضير :

5-methoxymethyl-2,2,5-trimethyldihydrofuran-3-one and 2-methoxymethyl-2,5,5-trimethyldihydrofuran-3-one



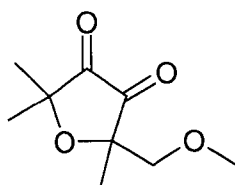
إلى mercury oxide (٠.٠٥ جم، ٠.٢٣١ ملي مول) تمت إضافة محلول من trichloroacetic acid (٠.٠٢ جم، ٠.١٢٢ ملي مول) في methanol (٠.٠٥٣ مل)، ثم boron trifluoride-diethyl etherate (٠.٠٥٣ مل، ٠.٣٧ ملي مول). تم تقليب الخليط ل

فترة وجيزة ثم تم تسخينه حتى تم الحصول على عجينة بلون الكريم (لمدة ٥ دقائق تقريباً)، متبوعاً بالتخفيف بمزيد من methanol (١ مل). بعد ذلك تمت إضافة محلول من : ٥

methanol في methanol (١.٢٢ جم، ٧.٠٩ ملي مول) 1-methoxy-2,5-dimethylhex-3-yne-2,5-diol (١ مل) بالتقطيط إلى هذا المعلق، وتم تسخين الخليط الناتج عند ٥٥° م لمدة ٣ ساعات. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة تم ترشيح خليط التفاعل من خلال تراب دياتومي (مع الغسيل بمزيد من methanol) ثم تم تركيزه عند ٤٠° م / ١٥٠ مللي بار للحصول على زيت خام. تم تخفيف هذه المادة على نحو أكبر باستخدام diethyl ether ، وتم تقليبها باستخدام sodium bicarbonate ١٥ صلبة ثم تم ترشيحها وتركيزها عند درجة حرارة ٤٠° م / ١٥٠ مللي بار للحصول على خليط من :

5-methoxymethyl-2,2,5-trimethyldihydrofuran-3-one (٠.٧٣ جم) في صورة زيت بني، يتم استخدامه دون المزيد من التنقية في الخطوة التالية.

خطوة ٣: تحضير 2-methoxymethyl-2,5,5-trimethylfuran-3,4-dione:



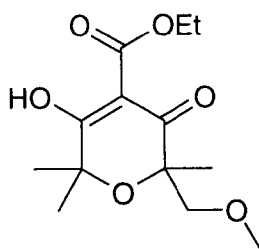
تم تسخين محلول تم تقليبه من selenium dioxide (٢.١٠ جم، ١٨.٩١ ملي مول) في dioxane رطب (١٧ مل، المحتوي على ٠.٥٪ ماء مقطر بالحجم) إلى ١٠٠° م، وعند هذه النقطة تمت إضافة محلول ثان (مختلط) من :

5-methoxymethyl-2,2,5-trimethyldihydrofuran-3-one and 2-methoxymethyl-2,5,5-trimethyldihydrofuran-3-one

(٢.٥٥ جم، ١٤.٨٢ ملي مول) في dioxane رطب (٥ مل، يحتوي على ٠.٥% ماء مقطر بالحجم) بالتقطيط على مدى ٤٠ دقيقة، ثم تم تعريضه لمزيد من التسخين عند درجة الحرارة هذه لمدة ٣ ساعات بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة وتم ترشيح الخليط من خلال تراب دياتومي (مع الغسيل بـ diethyl ether) ثم تمت إزالة المذيبات عند ٤٠° م / ٥٠ ملي بار للحصول على زيت لزج بلون بني مشوب بحمرة. تمت تنقية هذه المادة بالتقطير من تجويف إلى تجويف للحصول على 2-methoxymethyl-2,5,5-trimethylfuran-3,4-dione (٢.١٥ جم) في صورة زيت بلون أحمر فاتح.

خطوة ٤: تحضير :

2-methoxymethyl-2,6,6-trimethyl-3,5-dioxotetrahydropyran-4-carboxylic acid ethyl ester ١٠



تمت إضافة محلول ثان من 2-methoxymethyl-2,5,5-trimethylfuran-3,4-dione (٢.١٥ جم، ١١.٥٦ ملي مول) في tert-butyl methyl ether (٨ مل) بحذر إلى محلول من zinc chloride (١١.٨٠ مل، ١١.٨٠ ملي مول، محلول بتركيز ١ مولار في diethyl ether) عند درجة حرارة ٨° م. تم السماح لهذا الخليط بالتسخين إلى درجة حرارة ١٥° م وعند هذه المرحلة تمت إضافة محلول من ethyl diazoacetate (١.٣٥ جم، ١١.٨٤ ملي مول) في tert-butyl methyl ether

methyl (٦ مل) بالتقطيط على مدى ساعة واحدة، مع الاحتفاظ بدرجة الحرارة الداخلية عند أقل من ٢١°م والمزيد من التقليب عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل.

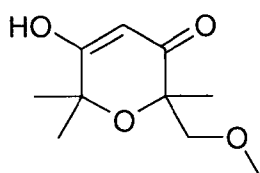
تم تخفيف الخليط باستخدام tert-butyl methyl ether (٥ مل)، وغسله باستخدام hydrochloric acid بتركيز ١ مolar (٣ × ٢٠ مل) وتم استخلاصه باستخدام sodium hydroxide بتركيز ١ مolar (٢ × ١٠٠ مل).

تمت إضافة sodium hydroxide صلب إلى هذا الطور المائي، متبوعاً بإكساب الخاصية الحمضية باستخدام hydrochloric acid مركز ثم تم استخلاص الخليط باستخدام dichloromethane . تم تجفيف المواد العضوية على نحو أكبر باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ للحصول على :

2-methoxymethyl-2,6,6-trimethyl-3,5-dioxo-tetrahydropyran-4-carboxylic acid ethyl ester ١٠

(٢٠١١ جم) في صورة زيت قرنفل.

خطوة ٥: تحضير 2-methoxymethyl-2,6,6-trimethylpyran-3,5-dione :



١٥ تمت إضافة ٢٠٪ من sulfuric acid مائي (٢٠٥ مل) إلى محلول من :

2-methoxymethyl-2,6,6-trimethyl-3,5-dioxotetrahydropyran-4-carboxylic acid (٢٠١١)

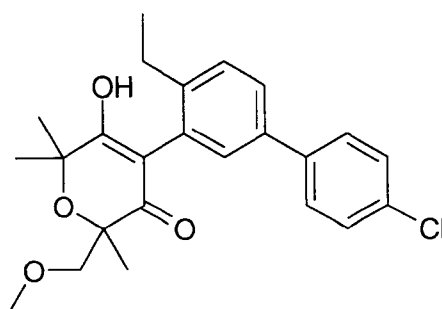
جم، ٧.٧٢ ملي مول) في dioxane (٢٠٥ مل) وتم تسخين الخليط عند درجة حرارة ١١٠°م لمدة

٢.٥ ساعة. تم تبريد الخليط إلى درجة حرارة الغرفة، وتم تخفيفه باستخدام محلول ملحي مشبع وتم استخلاصه باستخدام dichloromethane . تم استخلاص المادة الخام في sodium hydroxide مائي، وتم غسل الطور المائي باستخدام dichloromethane ، ثم تم إكسابه الخاصية الحمضية باستخدام hydrochloric acid مركز وتم استخلاصه في dichloromethane (٢ × ١٥ مل). تم تركيز الطور العضوي في وسط مفرغ للحصول على زيت خام تتم تنقيته بواسطة كروماتوجراف العمود الومضي باستخدام silica gel (diethyl ether/ isohexane بنسبة ٧.٥ : ١.٥) للحصول على :

2-methoxymethyl-2,6,6-trimethylpyran-3,5-dione (٠.٢٥٠ جم) في صورة مادة صلبة قرنفلية.

١٠ خطوة ٦: تحضير :

4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2-methoxymethyl-2,6,6-trimethyl-pyran-3,5-dione



تمت إضافة 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (٠.٤٦٥ جم، ٠.٧٧٥ مللي مول) إلى خليط من 2-methoxymethyl-2,6,6-trimethylpyran-3,5-dione (٠.١٤١ جم، ٠.٧٠٥ مللي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (٠.٤٣ جم، ٣.٥٢ مللي مول) في نظام مذيب مختلط من chloroform غير مائي (٧.٥ مل) و toluene غير مائي (٧٥.١ مل) دفعة واحدة وتم تسخين الخليط عند ٨٠° م لمدة ساعتين. تم السماح للخليط بالتبريد إلى درجة حرارة الغرفة، وتم تخفيفه باستخدام

hydrochloric acid وdichloromethane مائي مخفف، وتم تقلبيه لمدة ٥ دقائق ثم تم ترشيحه من خلال تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية (مع مزيد من الغسيل بالمذيبات). تم تجميع الأجزاء العضوية، وتم تجفيفها باستخدام magnesium sulfate غير مائية، وتم ترشيحها وتركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ.

٥ تمت تنقية المادة المتبقية بواسطة كروماتوجراف العمود باستخدام ethyl / hexane) silica gel acetate بنسبة ٤ : ١). تم تجميع الأجزاء المحتوية على المنتج المرغوب فيه وتم تبخيرها في وسط مفرغ. أدى السحن بـ hexane إلى الحصول على :

4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2-methoxymethyl-2,6,6-trimethylpyran-3,5-dione

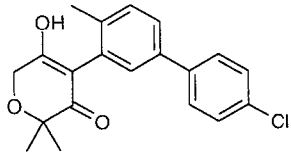
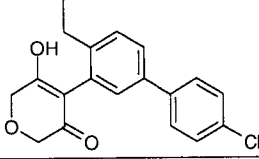
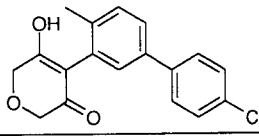
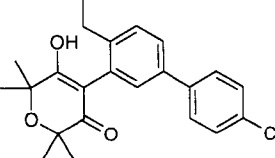
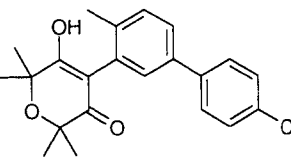
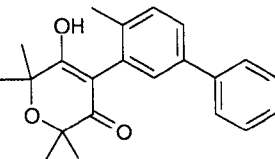
(٠.٠٧٠ جم) في صورة مادة صلبة بيضاء.

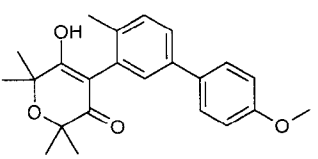
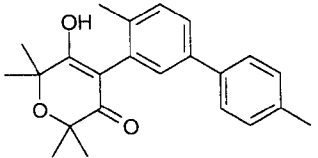
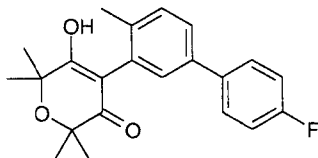
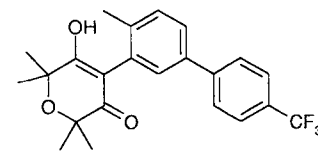
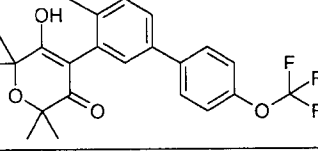
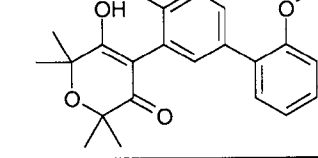
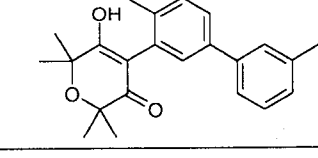
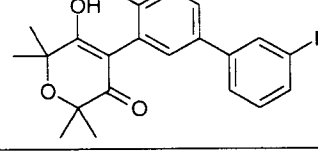
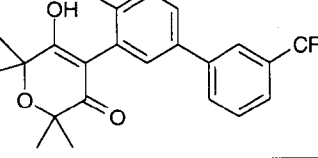
١٠ تم تحضير المركبات الإضافية الموضحة في جدول أ بعمليات مناظرة من المواد البادئة الملائمة. وينبغي ملاحظة أن هناك مركبات معينة خاصة بالاختراع توجد في صورة خليط من أيزومرات لا مدارية أو غير ذلك من الأيزومرات الموضحة اعلاه، في ظل الظروف المستخدمة في الحصول على بيانات $^1\text{H NMR}$.

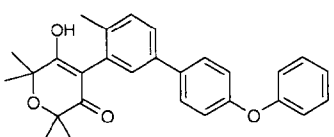
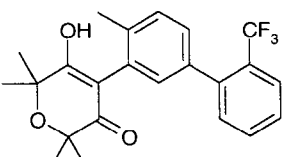
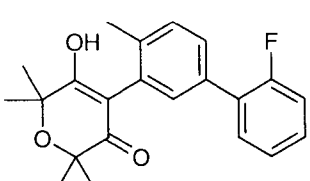
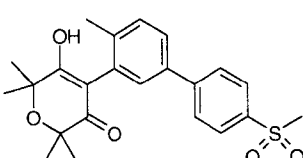
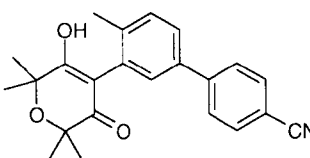
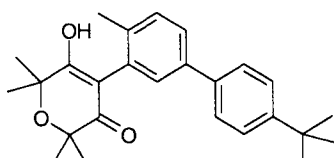
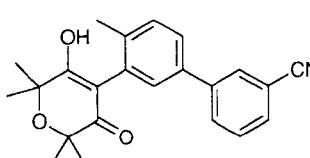
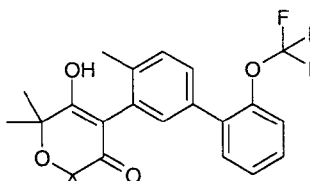
وحيث يحدث هذا، يتم تسجيل البيانات المميّزة لخليط الأيزومرات اللا مدارية، أو غيرها من الأيزومرات.

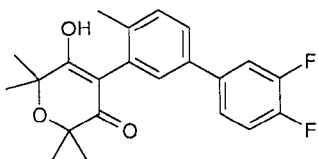
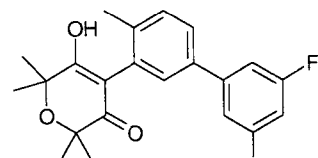
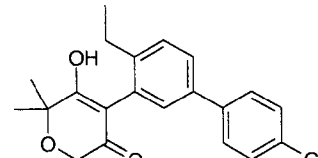
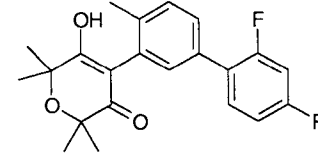
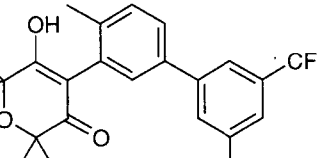
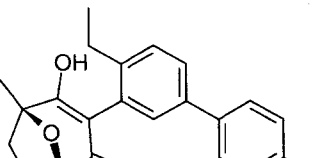
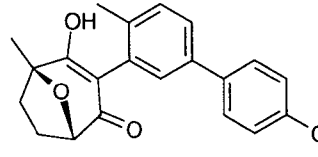
١٥

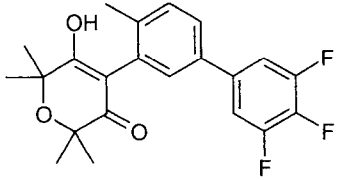
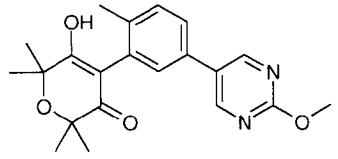
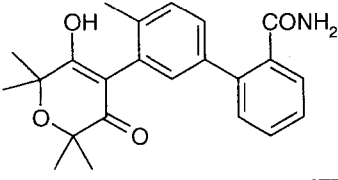
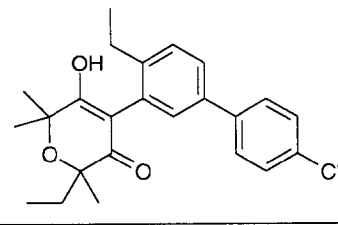
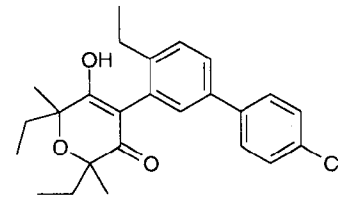
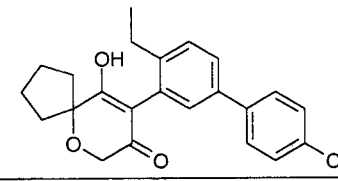
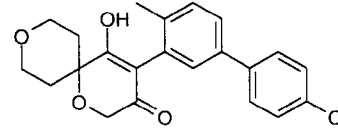
جدول أ

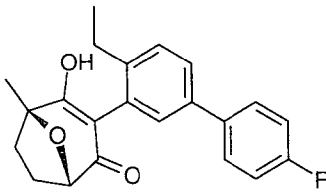
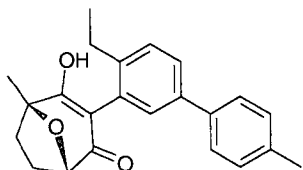
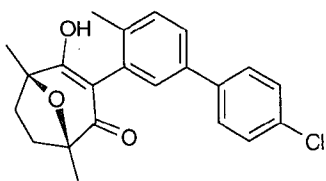
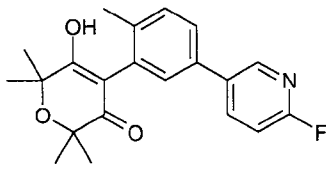
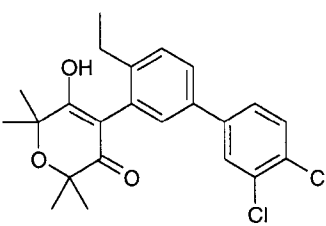
رقم المركب	البنية الكيميائية	ما لم يتم التحديد) أو البيانات ^1H nmr) CDCl_3 الفيزيائية الأخرى
A-1		o 7.50-7.44 (m, 3H, isomers A and B), 7.40-7.32 (m, 3H, isomers A and B), 7.25 (m, 1 H, isomers A and B), 5.86 (br. s, 0.58H, isomer A), 5.78 (br. s, 0.42H, A-I isomer B), 4.56 (br. s, 1.16H, isomer A), 4.33 (br. s, 0.84, isomer B) 2.14 (s, 3H, isomers A and B), 1.57 (br. s, 3H, isomers A and B), 1.45 (br. s, 3H, isomers A and B)
A-2		6 7.50 (dd, 1 H), 7.45 (m, 2H), 7.37 (d, 1 H), 7.37 (m, A-2 2H), 7.21 (d, 1H), 4.33 (br. q, 4H), 2.48 (q, 2H), 1.12 (t, 3H).
A-3		8 7.52 (dd, 1 H), 7.50 (m, 2K), 7.40 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 4.39 (m, 4H-I), 2.20 (s, 3H)
A-4		67.55 (dd, 1H), 7.52-7.50 (m, 2H), 7.42 (d, 1K), 7.40- 7.38 (m, 2H), 7.24 (d, 1K), 5.61 (br. s, 1H), 2.53-2.42 (m, 2H), 1.62 (br. s, 6H-I), 1.51 (app. d, 6K), 1.15 (t, 3H).
A-5		6 7.51-7.49 (m, 3H), 7.40-7.38 (m, 3H), 7.27 (d, 1 H), 5.63 (s, 1K), 2.18 (s, 3H), 1.62 (br. S, 6K), 1.51 (app. d, 6H).
A-6		67.58 (m, 2K), 7.55 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.41 (d, 1K), 7.34 (t, 1K), 7.31 (d, 1K), 5.70 (br. s, 1K), 2.19 (s, 3K), 1.60 (d, 6H), 1.51 (d, 6H).

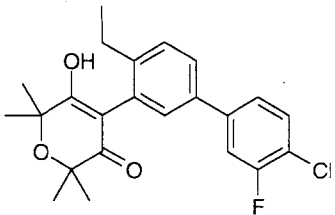
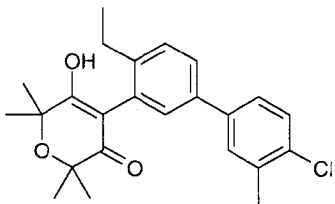
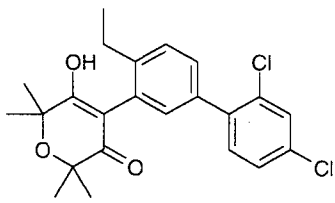
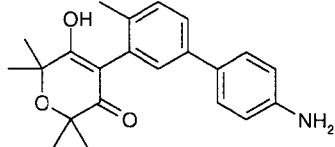
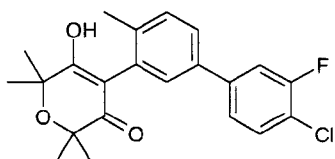
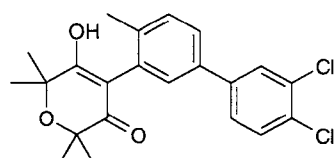
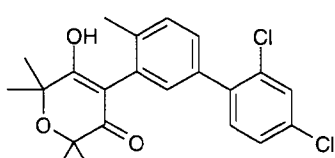
A-7		87.50 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.36 (ci, 1H), 7.27 (ci, 1K), 6.97 (m, 2H), 5.71 (br. s, 1K), 3.83 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.58 (ci, 6H), 1.50 (ci, 6H).
A-8		6 7.59 (dci, 1 H), 7.51 (m, 2H), 7.40 (d, 1 H), 7.32 (ci, 1H), 7.30 (m, 2K), 5.81 (br. s, 1K), 2.45 (s, 3K), 2.21 (s, 3H), 1.68 (ci, 6H), 1.57 (ci, 6H).
A-9		87.50 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.39 (ci, 1H), 7.25 (ci, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.05 (br. s, 1K), 2.17 (s, 3H), 1.60 (br. s, 6H), 1.51 (br. ci, 6K).
A-10		87.69 (s, 4H), 7.55 (cid, 1H), 7.41 (d, 1K), 7.31 (d, 1H), 5.60 (s, 1K), 2.20 (s, 3K), 1.62 (s, 6K), 1.50 (ci, 6K).
A-11		6 7.59 (m, 2H), 7.51 (dd, 1 H), 7.40 (d, 1K), 7.27 (m, 2H), 7.27 (ci, 1K), 5.60 (s, 1 H), 2.20 (s, 3K), 1.62 (s, 6K), 1.50 (ci, 6K).
A-12		67.49 (dci, 1H), 7.30-7.37(m, 3H), 7.22 (ci, 1K), 7.01 (1, 1K), 6.99 (d, 1K), 6.00 (br. s, 1K), 3.80 (s, 3K), 2.19 (s, 3K), 1.60 (s, 6K), 1.49 (s, 6K).
A-13		8 7.52 (dd, 1 H), 7.37 (m, 3H), 7.32 (d, 1 H), 7.29 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 5.90 (br. s, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.50 (br. s, 6H).
A-14		8 7.41-7.32 (m, 3H), 7.30-7.23 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.03(m, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.50 (br. s, 6H).
A-15		87.80 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.51 (s, 6H).

A-16		87.53 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.12 (t, 1H), 7.05 (m, 4H), 5.77 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.51 (br. d, 6H).
A-17		87.73 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.09 (s, 1H), 5.87 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.51 (s, 3H), 1.49 (s, 3H).
A-18		87.50 (dt, 1 H), 7.44 (dt, 1 H), 7.39 (d, 1 H), 7.31 (m, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.20 (dt, 1H), 7.15 (m, 1H), 6.01 (br. s, 1 H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-19		87.95 (m, 2H), 7.72 (m, 2H), 7.54 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.31 (ci, 1H), 5.85 (br. s, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.58 (br. s, 12H).
A-20		5 7.69 (m, 4H), 7.54 (dci, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-21		87.55 (dd, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.69 (s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H), 1.35 (s, 9H).
A-22		87.84 (d, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.70 (s, 1 H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-23		87.44-7.30 (m, 6H), 7.20 (d, 1H), 6.01 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).

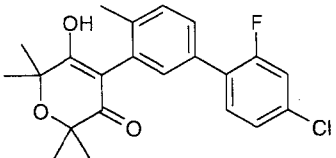
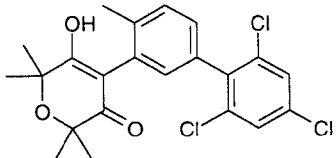
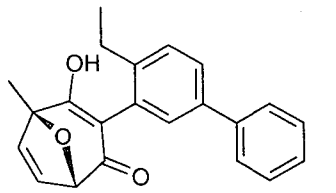
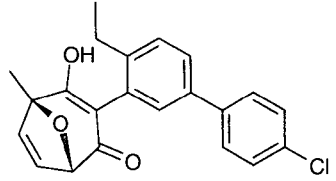
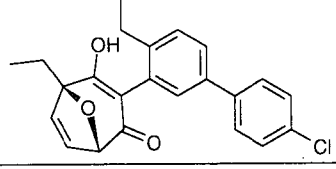
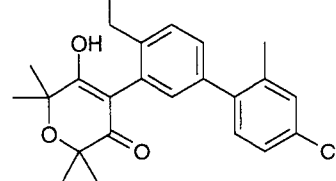
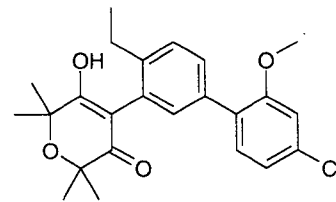
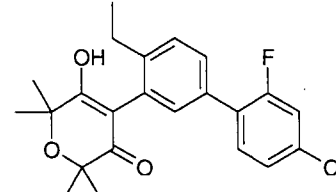
A-24		1H), 7.24 (d, 1H), 7.21 (m, 1H), 5.60 (s, 1H), 2.19 (s, 6H), 7.47 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.29 (m, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-25		87.50 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 726 (d, 1H), 7.09 (m, 2H), 6.78 (m, 1H), 5.64 (s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-26		6 7.57-7.48 (m, 3H, isomers A and B), 7.43-7.37 (m, 3H, isomers A and B), 7.27 (ddd, 0.5H, isomer A or B), 7.22 (ddd, 0.5H, isomer A or B), 5.59 (app. d, 0.5H, isomer A or B), 5.48 (app. d, 0.5H, isomer A or B), 4.77 (m, 0.5H, isomer A or B), 4.45 (m, 0.5H, isomer A or B), 2.55-2.36 (m, 2H, isomers A and B), 1.63-1.45 (m, 9H, isomers A and B), 1.17-1.12 (m, 3H, isomers A and B).
A-27		8 7.49-7.38 (m, 3H), 7.21 (s, 1H), 6.98-6.88 (m, 2H), 5.70 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-28		68.00 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.58 (dd, 1H), 7.47 (d, (app. d, 6H), 1.55 (s, 3H), 1.50 (s, 3H).
A-29		7.5-7.3 (m, 6H, isomers A and B), 7.23 (d, 0.59H, isomer A), 7.06 (d, 0.41 H, isomer B), 5.8 (app. br. d, 1 H, isomers A and B), 4.79 (app. d, 0.59H, isomer A), 4.60 (app. d, 0.41 H, isomer B), 2.6-1.8 (m, 6H, isomers A and B), 1.59 (s, 1.77H, isomer A), 1.51 (s, 1.23H, isomer B), 1.09 (t, 1.23H, isomer B), 1.04 (1, 1.77H, isomer A)
A-30		o 7.46-7.27 (m, 6H, isomers A and B), 7.25 (d, 0.55H, isomer A), 7.1 (d, 0.45H, isomer B), 5.8 (app. br. d, 0.45H, isomer B), 5.64 (app. br. s, 0.55H, isomer A), 4.79 (app. d, 0.55H, isomer A), 4.6 (app. dd, 0.45H, isomer B). 2.5-2.3 (m, 1 H, isomers A and B), 2.13 (s, 1.35H, isomer B),

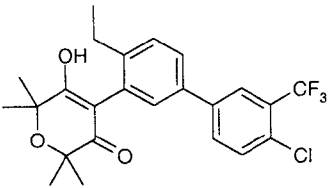
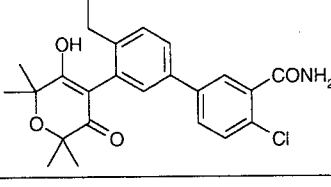
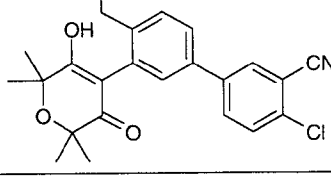
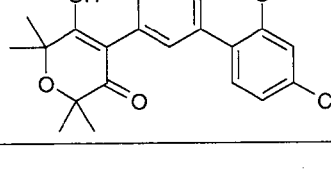
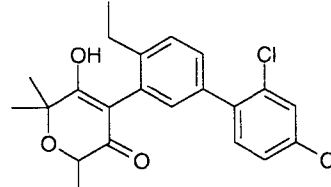
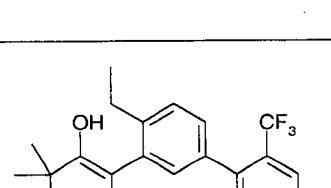
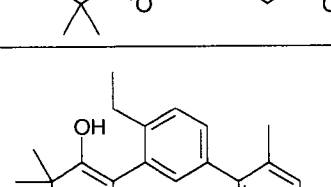
		2.02 (s, 1.65H, isomer A), 2.1-1.8 (m, 3H, isomers A and B), 1.61 (s, 1.35H, isomer B), 1.52 (s, 1.65H, isomer A).
A-31		07.47 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.19 (dd, 2H), 5.55 (s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-32		8.60 (s, 2H), 7.28 (br. s, 1H), 7.28 (br. s, 1H), 7.24 (br. s, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (s, 6H)
A-33		6 7.65 (d, 1H), 7.52 (dt, 1H), 7.45-7.38 (m, 2H), 7.36- 7.30 (m, 2H), 7.17 (d, 1H), 5.88-5.82 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.55 (br. s, 12H)
A-34		6 7.57-7.38 (m, 5H, isomers A and B), 7.23-7.19 (m, 2H, isomers A and B), 5.60-5.48 (m, 1H, isomers A and B), 2.57-2.39 (m, 2H, isomers A and B), 2.05- 1.91 (m, 1 H, isomer A or B), 1.80-1.68 (m, 1H, isomer A or B), 1.65-1.46 (m, 9H, isomers A and B), 1.18-1.13 (m, 3H, isomers A and B).
A-35		67.57-7.38 (m, 5H), 7.23-7.18 (m, 2H), 5.57-5.46 (m, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.07-1.61 (m, 4H), 1.64-1.41 (m, 6H), 1.19-1.13 (m, 3H), 1.04-0.94 (m, 6H).
A-36		6 7.57 (dd, 1 H), 7.50 (d, 2H), 7.43 (d, 1 H), 7.39 (d, 2H), 7.27 (m, 1 H), 5.66 (br. s, 1 H), 4.53-4.31 (m, 2H), 2.49(m,2H),2.19-1.74(m,8H), 1.15(t,3H).
A-37		6 7.53-7.45 (m, 3H, isomers A and B), 7.40-7.34 (m, 3H, isomers A and B), 7.26 (m, 1H, isomers A and B), 6.04 (br. s, 0.61 H, isomer A), 5.94 (br. s, 0.39H, isomer B), 4.54 (s, 1.22H, isomer A), 4.32 (s, 0.78H, isomer B), 3.90-3.81 (m, 2H, isomers A and B), 3.80-

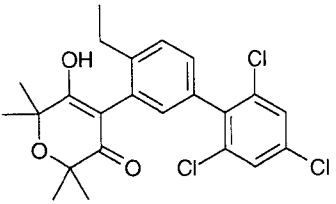
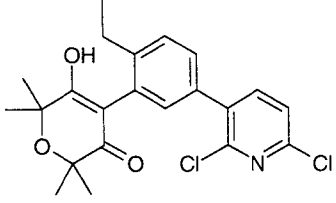
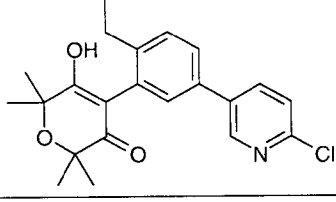
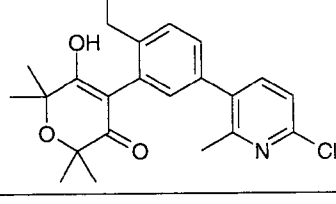
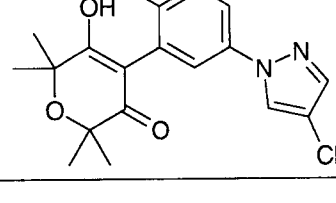
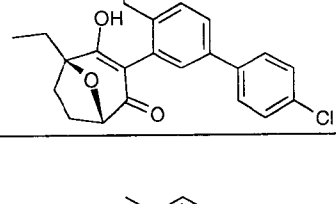
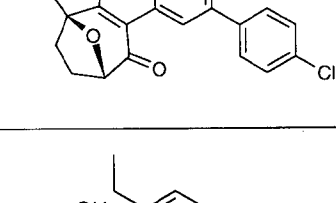
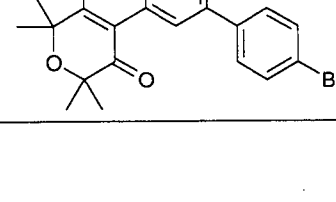
		3.71 (m, 2H, isomers A and B), 2.30-2.03 (m, 2H, isomers A and B), 2.16 (s, 1.17H, isomer B), 2.14 (s, 1.83H, isomer A), 1.95-1.72 (m, 2H, isomers A and B)
A-38		m.p. 165-167 °C; LC-MS (ES+) 353 (M+H)
A-39		δ 7.14-7.56 (m, 7H, isomers A and B), 6.1 (br. s, 1H, isomers A and B), 4.7 (d, 1H, isomer A), 4.6 (d, 1H, isomer II), 2.1-2.6 (m, 6H, isomers A and B), 2.0 (s, 3H, isomers A and B), 1.66 (s, 3H, isomers A and B), 1.16 (t, 3H, isomer A), 1.11 (s, 3H, isomer B).
A-40		67.16-7.48 (m, 7H), 5.65 (br. s, 1H), 2.0-2.2 (m, 7H), 1.64 (s, 3H), 1.55 (s, 3H).
A-41		5.8-8.10 (d, 1H), 7.94 (dl, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 6.94 (dd, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (app. d, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-42		8.7-7.66 (dd, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.63 (app. d, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.15 (s, 3H).

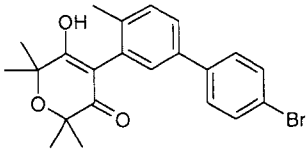
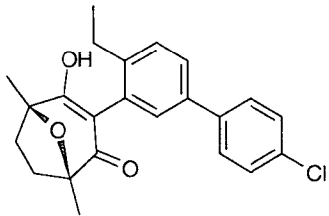
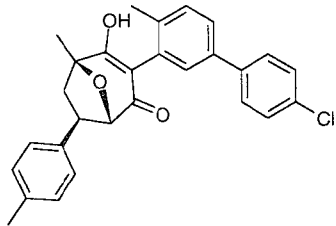
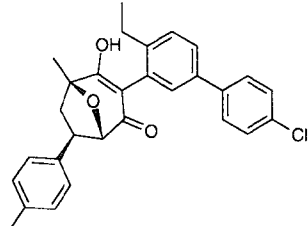
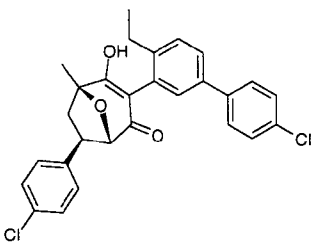
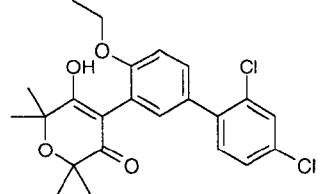
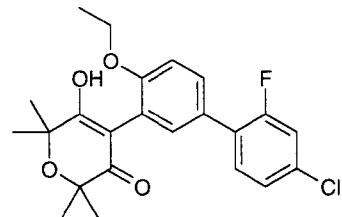
A-43		87.56 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.36(d, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.15 (1, 3H).
A-44		87.55 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 5.58 (br. s, 1H), 2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-45		87.48 (d, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.30 (m, 2H), 7.13 (d, 1H), 5.71 (1w. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.49 (app. d, 3H), 1.17 (1, 3H).
A-46		87.12 (br. s, 4H), 6.91 (br. m, 3H), 6.52 (br. S, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.49 (br. d, 12H).
A-47		87.49 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(d, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.51 (s, 6H).
A-48		87.67 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6H), 1.52 (app. d, 6H).
A-49		87.48 (dd, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.30 (m, 2H), 7.15 (d, 1H), 5.78 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (app. d, 6H), 1.50 (app. d, 6H).

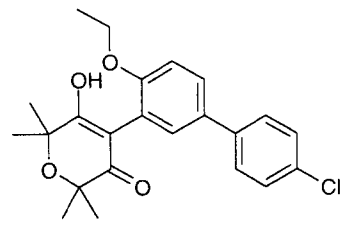
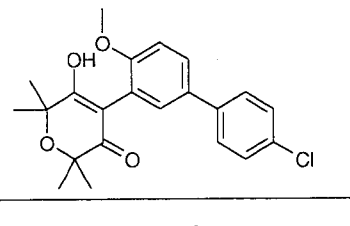
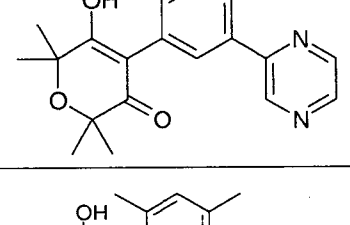
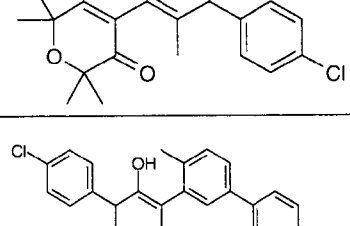
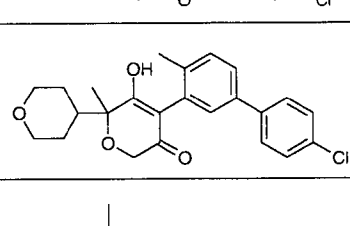
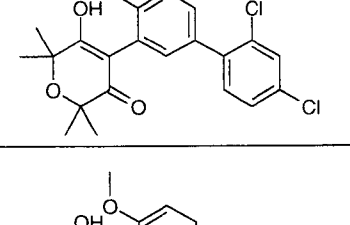
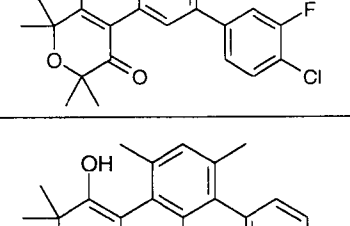
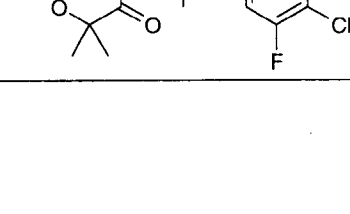
A-50		67.36 (dd, 1Ff), 7.25 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.19 (d, A-51 1Ff), 7.17 (d, 1Ff), 7.03 (d, 1Ff), 5.64 (br. s, 1Ff), 2.27 ci (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (app. d, 6Ff), 1.50 app. d, 6H).
A-51		67.36 (dd, 1Ff), 7.25 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.19 (d, A-51 1Ff), 7.17 (d, 1Ff), 7.03 (d, 1Ff), 5.64 (br. s, 1Ff), 2.27 ci (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (app. d, 6Ff), 1.50 app. d, 6H).
A-52		67.86, (d, 1Ff), 7.67 (dd, 1Ff), 7.54 (d, 1Ff), 7.51 (dd, A-52 1Ff), 7.42 (d, 1Ff), 7.27 (d, 1Ff), 5.64 (br. s, 1Ff), 2.19 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.52 (s, 6Ff).
A-53		6 7.54-7.30 (m, 6H), 5.90 (br. s, 1 H), 2.52 (s, 3H), A-53 2.24 (s, 3H), 1.68 (s, 6H), 1.57 (s, 6Ff).
A-54		6 8.52 (s, 1H), 7.84 (dd, 1Ff), 7.47 (d, 1 H), 7.40 (d, A-54 1Ff), 7.36 (d, 1 H), 7.24 (s, 1 H), 5.90 (br. s, 11-1), 2.20 (s, 3Ff), 1.63 (s, 6Ff), 1.51 (s, 1Ff).
A-55		67.72 (d, 1Ff), 7.53 (ci, 1H), 7.37 (d, 1Ff), 7.33 (ci, A-55 1Ff), 7.26 (ci, 11-fl, 7.04 (ci, 1Ff), 5.71 (br. s, 11-1), 2.20 (a, 3H), 1.61 (app. d, 6H), 1.50 (app. ci, 6Ff).
A-56		67.52 (dci, 1H), 7.40 (ci, 1Ff), 7.28 (ci, 1H), 7.22 (ci, A-56 1H), 7.05 (a, 1Ff), 5.53 (br. s, 1Ff), 2.52 (a, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6Ff), 1.51 (app. ci, 6H).
A-57		87.52 (s, 1Ff), 7.18 (a, 1Ff), 7.15 (d, 1Ff), 7.03, (a, A-57 1Ff), 6.97 (ci, 1N), 5.53 (br. s, 1Ff), 2.30 (a, 3Ff), 2.25 (a, 3Ff), 1.65 (ci, 6Ff), 1.51 (ci, 6Ff).
A-58		7.67 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 5.75 (br. s, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.62 (app. d, 6H), 1.50 (app. d, 6H).

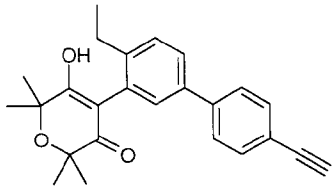
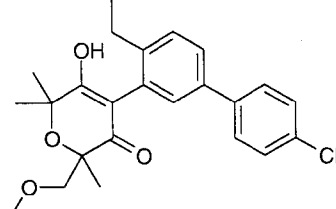
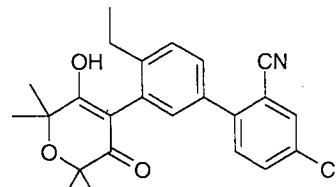
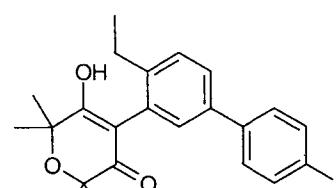
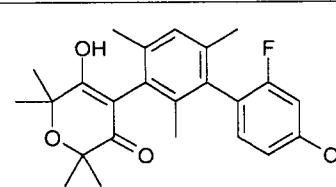
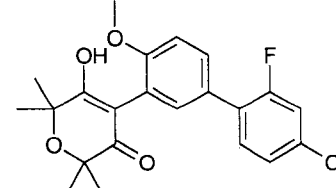
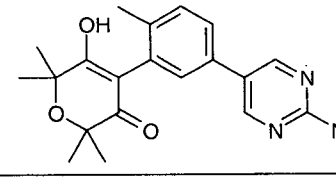
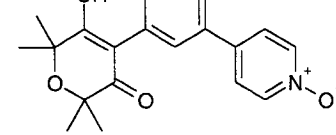
A-59		δ 7.47 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 5.75 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (d, 6H).
A-60		δ 7.42 (app. dd, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.21 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.74 (br. s, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.59 (app. d, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-61		δ 7.5-7.28 (m, 8H), 6.4 (dd, 1H), 6.2 (dd, 1H), 5.44 (s, 1H), 5.39 (dd, 1H), 2.5 (m, 2H), 1.73 (s, 3H), 1.17 (t, 3H).
A-62		δ 7.46-7.3 (m, 7H), 6.43 (dd, 1H), 6.25 (d, 1H), 5.45 (s, 1H), 5.39 (d, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.73 (s, 3H), 1.14 (t, 3H).
A-63		δ 7.46-7.3 (m, 7H), 6.4 (dd, 1H), 6.2 (d, 1H), 5.43 (s, 1H), 5.4 (m, 1H), 2.45 (m, 2H), 2.1 (q, 2H), 1.15 (t, 3H), 1.05 (t, 3H).
A-64		δ 7.40 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.60 (app. d, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-65		δ 7.49 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.95 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.45 (br., 2H), 1.56 (br., 12H), 1.15 (t, 3H).
A-66		δ 7.52 (dd, 1H), 7.44-7.36 (m, 2H), 7.21-7.16 (m, 3H), 5.77 (br. s, 1H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).

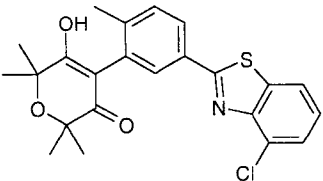
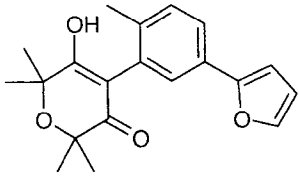
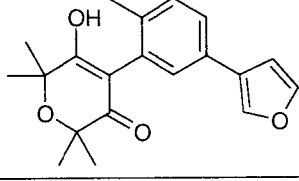
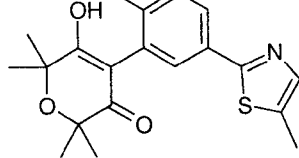
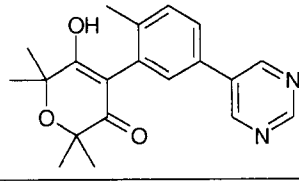
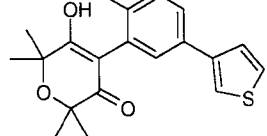
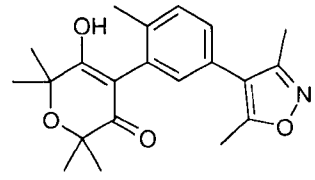
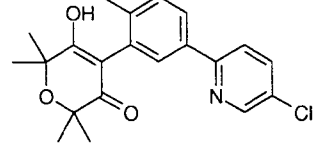
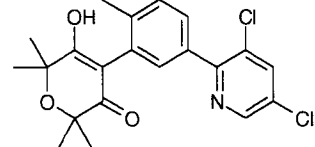
A-67		δ 7.86 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-68		δ 8.02 (s, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 6.61 (br. s, 2H), 2.48 (m, 2H), 1.56 (br., 12H), 1.15 (t, 3H).
A-69		δ 7.84 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 5.68 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-70		δ 7.46 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.01 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-71		δ 7.48 (app. d, 1H), 7.44-7.40 (m, 2H, isomers A and B), 7.29 (m, 2H, isomers A and B), 7.15-7.10 (m, 1H, isomers A and B), 5.80 (app. d, 0.5H, isomer A or B), 5.66 (app. d, 0.5H, isomer A or B), 5.76 (m, 0.5H, isomer A or B), 4.44 (m, 0.5H, isomer A or B), 2.58-2.36 (m, 2H, isomers A and B), 1.62-1.44 (m, 9H, isomers A and B), 1.19-1.14 (m, 3H, isomers A and B).
A-72		δ 7.76 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.35 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 5.82 (br. s, 1H), 2.54 (m, 2H), 1.66 (br., 12H), 1.22 (t, 3H).
A-73		δ 7.82 (s, 1H), 7.58 (br., 1H), 7.33 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.17 (dd, 1H), 7.04 (s, 1H), 2.59 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.63 (br., 6H), 1.53 (br., 6H), 1.21 (t, 3H).

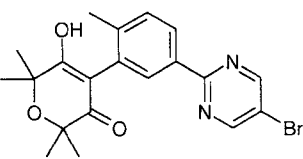
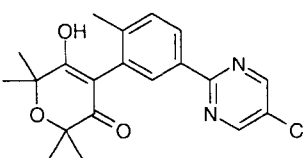
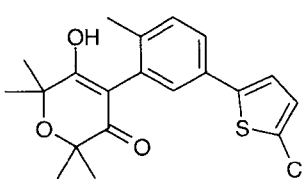
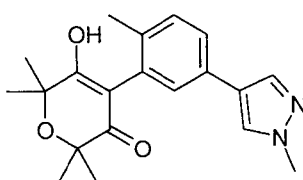
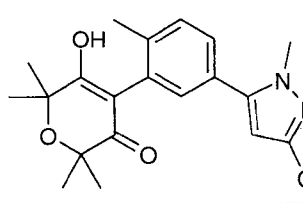
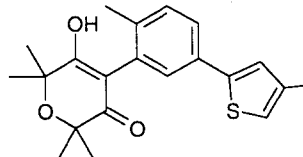
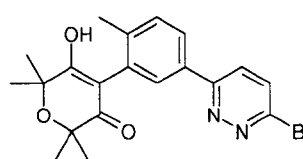
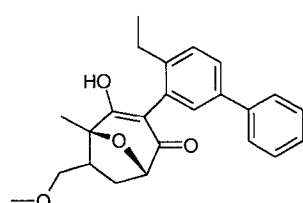
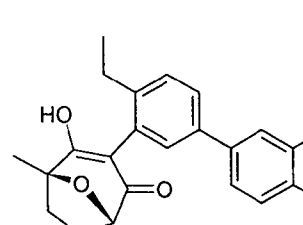
A-74		δ 7.52-7.45 (m, 3H), 7.30 (dd, 1H), 7.02 (s, 1H), 5.86 (br. s, 1H), 2.57 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.23 (t, 3H).
A-75		δ 7.68 (d, 1H), 7.43 (s, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.81 (br. s, 1H), 2.51 (m, 2H), 1.58 (br., 6H), 1.48 (br., 6H), 1.17 (t, 3H).
A-76		δ 8.52 (s, 1H), 7.84 (dd, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 2.48 (t, 2H), 1.58 (br., 6H), 1.47 (br., 6H), 1.14 (t, 3H).
A-77		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 1.61 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-78		δ 7.81 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.44 (dd, 1H), 7.32-7.30 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.42 (s, 6H).
A-79		δ 7.6-7.1 (m, 7H), 4.7 (br. s, 1H), 1.8-2.5 (m, 8H), 1.2 (t, 3H), 1.1 (t, 3H).
A-80		δ 7.47-7.17 (m, 7H, isomers A and B), 5.9 (br. s, 1H, isomer A), 5.8 (br. s, 1H, isomer B), 4.8 (dd, 1H, isomer A), 4.7 (d, 1H, isomer B), 2.1 (s, 3H, isomers A and B), 1.8-2.5 (m, 6H, isomers A and B), 1.1 (t, 3H, isomer B), 1.0 (t, 3H, isomer A).
A-81		δ 7.54 (m, 3H), 7.42 (m, 3H), 7.24 (s, 1H), 5.63 (s, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).

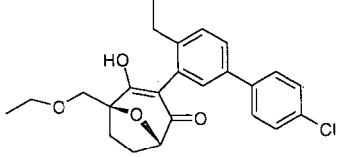
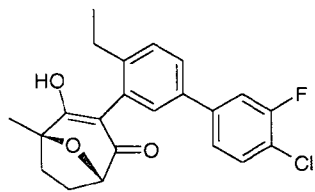
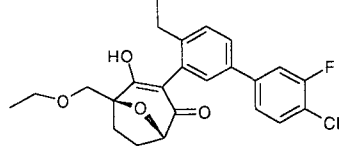
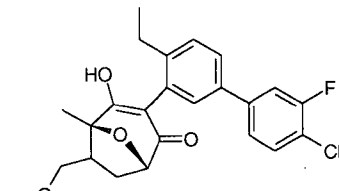
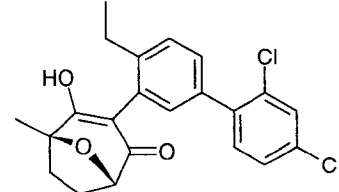
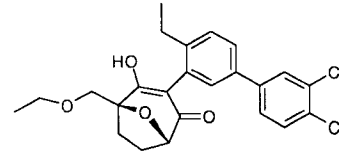
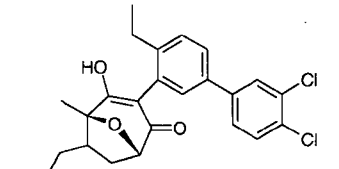
A-82		δ 7.55 (d, 2H), 7.50 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.35 (d, 2H), 7.27 (s, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-83		δ 7.55-7.14 (m, 7H, isomers A and B), 5.7 (br. s, 1H, isomer B), 5.6 (br. s, isomer A), 2.6-2.1 (m, 6H, isomers A and B), 1.62 (s, 6H, isomers A and B), 1.2 (m, 3H, isomer B), 1.1 (m, 3H, isomer A).
A-84		δ 7.51-7.46 (m, 4H), 7.40-7.37 (m, 4H), 7.1 (m, 3H), 6.25 (br. s, 1H), 4.7 (s, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 2.9-2.6 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.68 (s, 3H).
A-85		δ 7.55-7.16 (m, 11H), 5.8 (br. s, 1H), 4.7 (d, 1H), 3.6-3.4 (m, 1H), 2.66-2.4 (m, 4H), 2.35 (s, 3H), 1.7 (s, 3H), 1.12 (m, 3H).
A-86		δ 7.55-7.25 (m, 11H), 5.95 (br. s, 1H), 4.7 (d, 1H), 3.6-3.35 (m, 1H), 2.85-2.4 (m, 4H), 1.66 (d, 3H), 1.15 (m, 3H).
A-87		Methanol-d ₄ δ 7.50 (m, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.32 (t, 3H).
A-88		Methanol-d ₄ δ 7.50 (m, 2H), 7.25 (m, 2H), 7.20 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.32 (t, 3H).

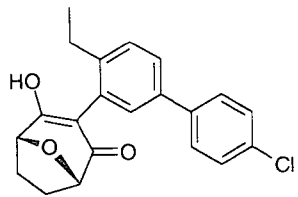
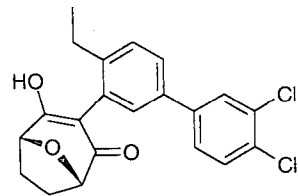
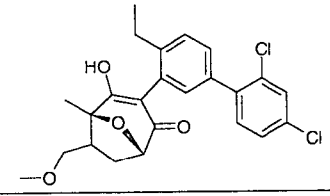
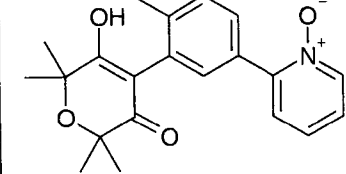
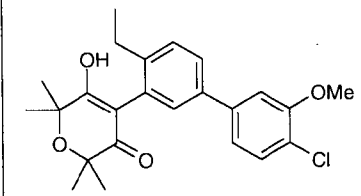
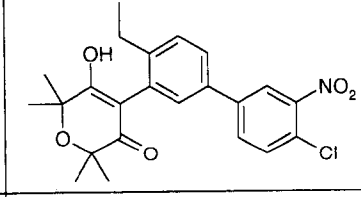
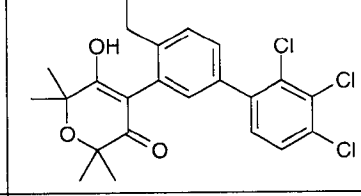
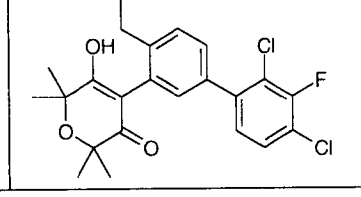
A-89		Methanol-d ₄ δ 7.55 (m, 3H), 7.38 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.30 (t, 3H).
A-90		δ 7.57-7.53 (d, 1H), 7.5-7.46 (dd, 2H), 7.39-7.36 (dd, 2H), 7.28-7.26 (d, 1H), 7.09-6.9 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 1.5-1.7 (m, 12H).
A-91		Methanol-d ₄ δ 9.10 (s, 1H), 8.65 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.52 (s, 12H).
A-92		δ 7.39 (m, 2H), 7.11 (dd, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.04 (dd, 1H), 5.51 (br. s, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).
A-93		δ 7.52-7.22 (m, 11H, isomers A and B), 5.28 and 5.26 (br. s each, 1H together, isomers A and B), 4.36 (m, 2H, isomers A and B), 2.19 and 2.16 (s each, 3H together, isomers A and B).
A-94		δ 7.49-7.16 (m, 7H), 4.38 (m, 2H), 3.91 (m, 2H), 3.30 (m, 2H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.14 and 2.11 (s each, 3H together), 1.75 (m, 1H), 1.55 (m, 3H), 1.37 (br. s, 3H).
A-95		δ 7.5-7.4 (m, 2H), 7.35-7.25 (m, 3H), 7.05-6.95 (2xd, 1H), 3.9 (2 x s, 3H), 1.55-1.45 (m, 12H).
A-96		δ 7.55-7.6 (d, 1H), 7.5-7.3 (m, 3H), 7.1-7.0 (dd, 2H), 3.9-3.8 (2x s, 3H), 1.6-1.5 (m, 12H).
A-97		δ 7.44 (m, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.99 (m, 0.5H), 6.91 (m, 1H), 6.84 (m, 0.5H), 5.50 (br. d, 1H), 2.11 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).

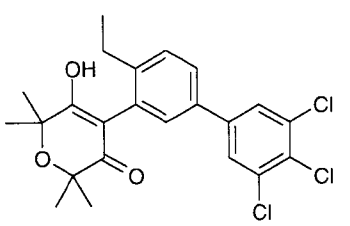
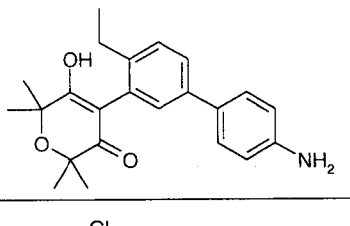
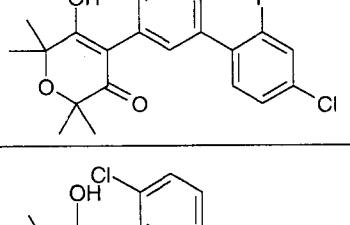
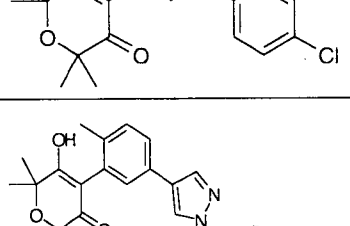
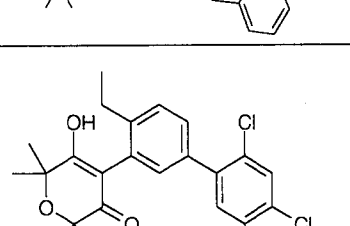
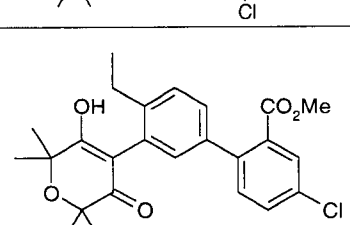
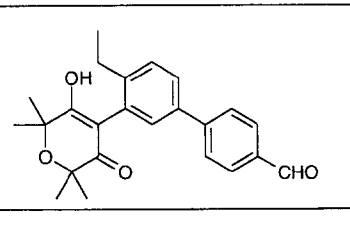
A-98		δ 7.58 (dd, 1H), 7.55 (s, 4H), 7.43 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.62 (br. s, 1H), 3.13 (s, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-99		m.p. 123-124 °C; LC-MS (ES+) : 415, 417 (M+H)+
A-100		δ 7.77 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.53 (m, 3H), 7.29 (s, 1H), 6.00 (s, 1H), 2.55 (m, 2H), 1.68 (d, 6H), 1.54 (d, 6H), 1.22 (t, 3H).
A-101		δ 7.74 (d, 2H), 7.53 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.31 (d, 2H), 7.23 (s, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-102		δ 7.24-7.00 (m, 4H), 5.80 (br. s, 0.75H), 5.51 (br. s, 0.25H), 2.12 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).
A-103		δ 7.55-7.5 (m, 1H); 7.4-7.35 (m, 1H); 7.33-7.34 (m, 1H); 7.2-7.14 (m, 2H); 7.14-6.96 (2xd, 1H); 3.86-3.75 (2xs, 3H); 1.63-1.45 (m, 12H).
A-104		DMSO-d6 δ 8.46 (s, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.66 (s, 2H), 1.98 (s, 3H), 1.44 (br. s, 6H), 1.31 (br. s, 6H).
A-105		DMSO-d6 δ 8.19 (d, 2H), 7.71 (d, 2H), 7.60 (dd, 1H), 7.31 (s, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.50 (br. s, 6H), 1.32 (br. s, 6H).

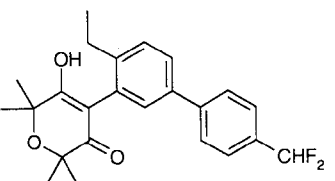
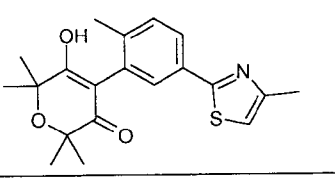
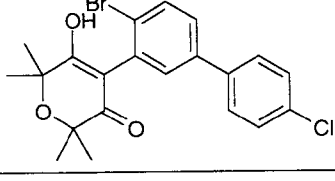
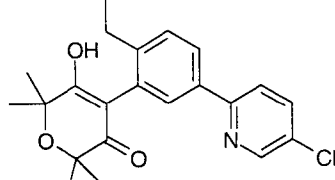
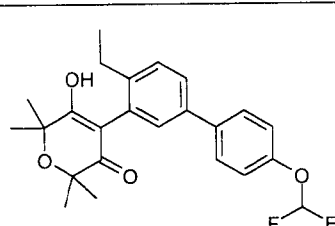
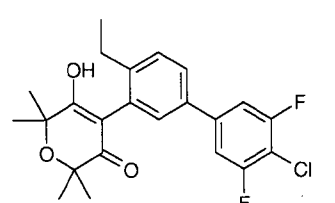
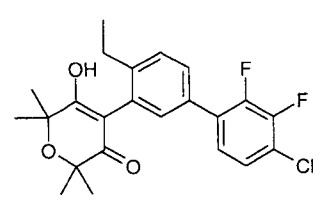
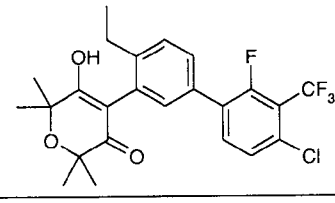
A-106		DMSO-d6 δ 8.00 (d, 1H), 7.82 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.35 (m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.38 (br. s, 12H).
A-107		DMSO-d6 δ 7.60 (s, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.17(m, 2H), 6.78 (d, 1H), 6.47(m, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-108		DMSO-d6 δ 8.10 (s, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.89 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.47 (br. s, 6H), 1.33 (br. s, 6H).
A-109		DMSO-d6 δ 7.63 (dd, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 2.44 (app. d, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-110		DMSO-d6 δ 9.09 (s, 1H), 9.04 (s, 2H), 7.60 (dd, 1H), 7.33 (m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.38 (br. s, 12H).
A-111		DMSO-d6 δ 7.70 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.17 (m, 2H), 1.94 (s, 3H), 1.35 (br. s, 12H).
A-112		DMSO-d6 δ 7.27 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-113		DMSO-d6 δ 8.63 (s, 1H), 7.93 (s, 2H), 7.86 (dd, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.41 (br. s, 12H).
A-114		DMSO-d6 δ 8.65 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.41 (br. d, 12H).

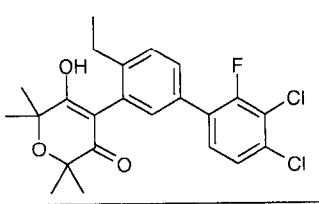
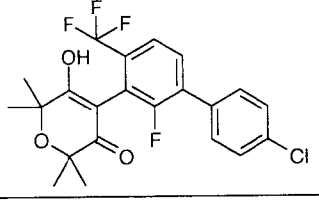
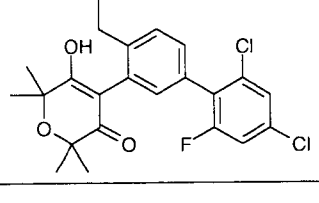
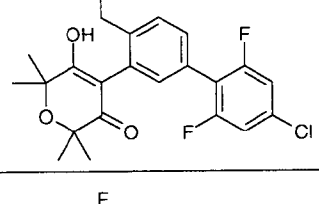
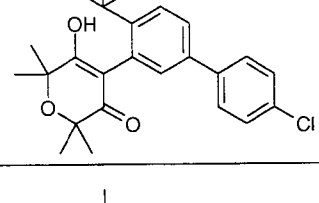
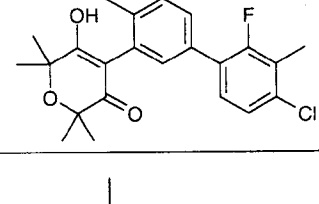
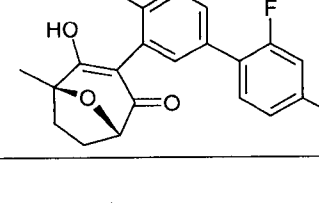
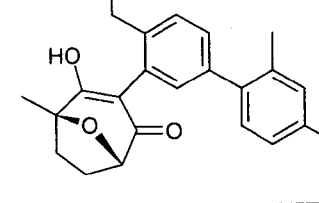
A-115		DMSO-d6 δ 9.00 (s, 2H), 8.15 (dd, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-116		DMSO-d6 δ 8.98 (s, 2H), 8.20 (dd, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-117		DMSO-d6 δ 7.44 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-118		DMSO-d6 δ 8.03 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 3.78 (s, 3H), 1.94 (s, 3H), 1.44 (br. s, 6H), 1.32 (br. s, 6H).
A-119		DMSO-d6 δ 7.42 (app. dd, 1H), 7.38 (app. d, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-120		DMSO-d6 δ 7.62 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.39 (br. s, 6H), 1.51 (br. s, 6H).
A-121		DMSO-d6 δ 8.20 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-122		δ 7.1-7.47 (m, 7H), 6.15 (br. s, 1H), 4.5-4.8 (m, 1H), 3.44 (s, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.7-2.25 (m, 5H), 1.65 (s, 3H), 1.14 (m, 3H).
A-123		δ 7.64-7.12 (m, 6H, isomers A and B), 5.75 (br. s, 1H, isomers A and B), 4.8 (d, 1H, isomer A), 4.7 (d, 1H, isomer B), 2.6-1.9 (m, 6H, isomers A and B), 1.56 (s, 3H, isomers A and B), 1.2 (t, 3H, isomer A), 1.14 (t, 3H, isomer B).

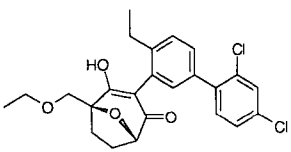
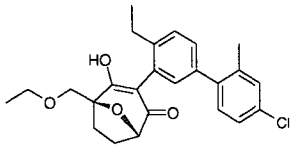
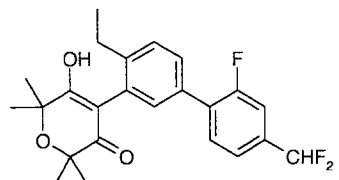
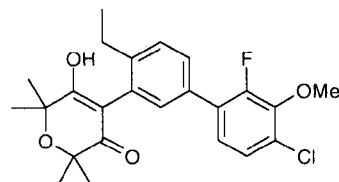
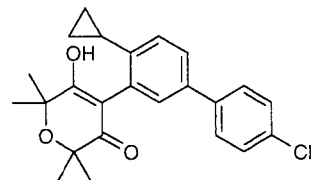
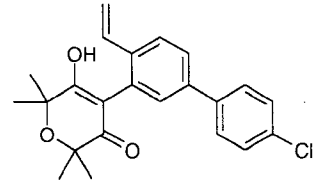
A-124		δ 8.6 (br. s, 1H, isomer A), 8.4 (br. s, 1H, isomer B), 7.5-7.2 (m, 7H, isomers A and B), 4.9 (m, 1 H, isomer B), 4.72 (m, 1H, isomer A), 4.14-3.7 (m, 4H, isomers A and B), 2.4-2.3 (m, 6H, isomers A and B), 1.25 (m, 3H, isomers A and B), 1.2 (m, 3H, isomer B), 1.18 (m, 3H, isomer A)
A-125		δ 7.42-7.12 (m, 6H, isomers A and B), 5.9 (br. s, 1H, isomers A and B), 4.85 (d, 1H, isomer A), 4.69 (d, 1H, isomer B), 2.5-1.95 (m, 6H, isomers A and B), 1.67 (s, 3H, isomers A and B), 1.16 (t, 3H, isomer A), 1.11 (t, 3H, isomer B).
A-126		δ 8.8 (br. s, 1H isomer A), 8.7 (br. s, 1H, isomer B), 7.51-7.15 (m, 6H, isomers A and B), 4.9 (m, 1H, isomer B), 4.7 (m, 1H, isomer A), 4.2 (m, 1H, isomers A and B), 3.77-3.6 (m, 2H, isomers A and B), 3.46 (s, 1H, isomers A and B), 2.47-1.86 (m, 6H, isomers A and B), 1.3 (m, 3H, isomers A and B), 1.2 (m, 3H, isomer B), 1.1 (m, 3H, isomer A).
A-127		δ 7.5-7.14 (m, 6H), 6.0 (br. s, 1H), 4.8-4.62 (m, 1H), 3.5 (s, 3H), 3.2 (m, 2H), 2.8-2.3 (m, 5H), 1.6 (s, 3H), 1.2 (t, 3H).
A-128		δ 7.47-7.25 (m, 6H, isomers A and B), 6.1 (br. s, 1H isomers A and B), 4.8 (d, 1H, isomer A), 4.7 (m, 1H, isomer B), 2.5-1.9 (m, 6H, isomers A and B), 1.66 (s, 3H, isomers A and B), 1.2 (t, 3H, isomer A), 1.15 (t, 3H, isomer B).
A-129		δ 8.8 (br. s, 1H, isomer A), 8.6 (br. s, 1H, isomer B), 7.7-7.1 (m, 6H, isomers A and B), 4.9 (m, 1H, isomer B), 4.7 (m, 1H, isomer A), 4.2-3.6 (m, 4H, isomers A and B), 2.7-2.3 (m, 6H, isomers A and B), 1.3 (m, 3H, isomers A and B), 1.2 (t, 3H, isomer B), 1.1 (t, 3H, isomer A).
A-130		δ 7.64-7.14 (m, 6H), 5.9 (br. s, 1H), 4.6 (m, 1H), 3.48 (s, 3H), 3.3 (m, 2H), 2.8-2.4 (m, 5H), 1.7 (s, 3H), 1.15 (m, 3H).

A-131		Gum; LC-MS (ES-) 355, 353 (M-H)-
A-132		Gum; LC-MS (ES-) 389, 387 (M-H)-
A-133		δ 7.04-7.5 (m, 6H), 6.0 (br. s, 1H), 4.7-4.6 (m, 1H), 3.4 (m, 2H), 3.2 (m, 3H), 2.8-2.3 (m, 5H), 1.6 (s, 3H), 1.2 (m, 3H).
A-134		DMSO-d ₆ δ 8.27-8.24(2xd, 1H); 7.72-7.67 (2xd, 1H); 7.54-7.51 (2xd, 1H); 7.37-7.24 (m, 4H); 2.03 (s, 3H); 1.24-1.2 (2xs, 12H).
A-135		δ 7.59 (dd, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.14 (m, 2H), 5.68 (s, 1H), 4.01 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.55 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-136		δ 8.12 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.58 (m, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.56 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-137		δ 7.45 (m, 3H), 7.26 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.82 (s, 1H), 2.54 (m, 2H), 1.66 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.21 (t, 3H). ^[1]
A-138		δ 7.42 (s, 2H), $\square$ 7.34 (t, 1H), 7.12 (m, 2H), 5.76 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).

A-139		δ 7.58 (s, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-140		δ 7.52 (d, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.21 (s, 1H), 6.73 (d, 2H), 5.75 (br., 1H), 3.71 (br., 2H), 2.45 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-141		δ 7.59 (d, 1H), 7.51 (dt, 1H), 7.41-7.31 (m, 2H), 7.24-7.17 (m, 2H), 5.65 (br. s, 1H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-142		δ 7.60-7.56 (m, 1H), 7.56-7.51 (m, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.38 (d, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-143		δ 7.71 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.38 (m, 3H), 7.32 (app. d, 2H), 7.27 (app. d, 2H), 7.17 (s, 1H), 5.31 (s, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.65 (br. s, 6H), 1.54 (br. s, 6H).
A-144		δ 7.58 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.42 (s, 2H), 7.11 (s, 1H), 5.72 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-145		δ 7.90 (s, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.30 (dd, 1H), 7.01 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.63 (d, 6H), 1.62 (d, 6H), 1.22 (t, 3H).
A-146		δ 10.04 (s, 1H), 7.94 (app. d, 2H), 7.75 (app. d, 2H), 7.65 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 5.66 (br. s, 1H), 2.55-2.45 (m, 2H), 1.61-1.51 (m, 12H), 1.16 (t, 3H).

A-147		δ 7.66 (app. d, 2H), 7.61-7.56 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.69 (t, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-148		DMSO-d6 δ 7.72 (dd, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.52 (br. s, 6H), 1.37 (br. s, 6H).
A-149		δ 7.76 (d, 1H), 7.51-7.37 (m, 6H), 5.55 (br. s, 1H), 1.66 (s, 3H), 1.60 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.48 (s, 3H).
A-150		Methanol-d4 δ 8.56 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.85 (s, 2H), 7.61 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 2.50 (q, 2H), 1.52 (s, 12H), 1.15 (t, 3H).
A-151		Methanol-d4 δ 7.64 (d, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.20 (m, 3H), 6.83 (t, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.51 (s, 12H), 1.13 (t, 3H).
A-152		δ 7.58 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 5.64 (br. s, 1H), 2.59-2.47 (m, 2H), 1.67 (app. d, 6H), 1.55 (s, 6H), 1.20 (t, 3H).
A-153		δ 7.58-7.46 (m, 2H), 7.31-7.19 (m, 3H), 7.57 (br. s, 1H), 2.60-2.45 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.55-1.53 (m, 6H), 1.23-1.18 (m, 3H).
A-154		δ 7.55-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 5.70 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).

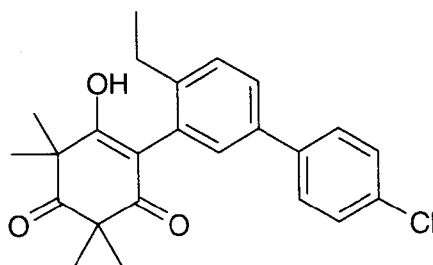
A-155		δ 7.51 (dt, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 5.74 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-156		Methanol-d4 δ 7.65 (app. d, 2H), 7.59 (app. d, 1H), 7.56 (app. d, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 1.50 (s, 6H), 1.47 (s, 6H).
A-157		δ 7.50 (d, 1H), 7.40-7.37 (m, 2H), 7.18-7.15 (dd, 1H), 7.11 (s, 1H), 5.82 (br. s, 1H), 2.63-2.47 (m, 2H), 1.65 (app. d, 6H), 1.54 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.22 (t, 3H).
A-158		δ 7.49 (s, 2H), 7.20 (br. s, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 5.78 (br. s, 1H), 2.60-2.48 (m, 2H), 1.65 (s, 3H), 1.62 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.21 (t, 3H).
A-159		δ 7.83 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.44 (d, 2H), 7.39 (s, 1H), 5.48 (br. s, 1H), 1.60 (app. d, 6H), 1.47 (s, 6H).
A-160		δ 7.55 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.27-7.22 (m, 3H), 5.74 (br. s, 1H), 2.58-2.47 (m, 2H), 2.41 (d, 3H), 1.66 (s, 6H), 1.54 (app. d, 6H), 1.20 (t, 3H).
A-161		δ 7.5-6.9 (m, 6H, isomers A and B), 6.1 (d, 1H, isomer A), 5.95 (d, 1H, isomer B), 4.8 (t, 1H, isomer A), 4.7 (t, 1H, isomer B), 2.6-2.3 (m, 3H, isomers A and B), 2.1-1.8 (m, 3H, isomers A and B), 1.6 (s, 3H, isomers A and B), 0.9-0.8 (m, 3H, isomers A and B).
A-162		δ 7.40-6.88 (m, 6H each of isomer I and II), 5.9 (d, 1H, isomer II), 5.8 (s, 1H, isomer I), 4.85 (t, 1H, isomer I), 4.7 (m, 1H, isomer II), 2.6-1.8 (m, 9H each of isomer I and II), 1.5 (s, 3H each of isomer I and II), 1.2 (t, 3H, isomer II), 1.1 (t, 3H, isomer I).

A-163		δ 8.47 (s, 1H, isomer A), 8.22 (s, 1H, isomer B), 7.5-7.0 (m, 6H, isomers A and B), 4.9 (d, 1H, isomer B), 4.7 (t, 1H, isomer A), 4.2-3.5 (m, 4H, isomers A and B), 2.6-1.9 (m, 6H, isomers A and B), 1.3-1.1 (m, 6H, isomers A and B)
A-164		δ 8.08 (s, 1H, isomer A), 8.07 (s, 1H, isomer B), 7.5-6.9 (m, 6H, isomers A and B), 4.9 (m, 1H, isomer B), 4.7 (m, 1H, isomer A), 4.6 (s, 1H, isomers A and B), 4.2-3.5 (m, 3H, isomers A and B), 2.76 (s, 3H, isomers A and B), 2.6-1.9 (m, 6H, isomers A and B), 1.3-1.1 (m, 6H, isomers A and B).
A-165		δ 7.62-7.57 (m, 2H), 7.50 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.71 (t, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 2.60-2.49 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.54 (app. d, 6H), 1.21 (t, 3H).
A-166		δ 7.52 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.21-7.19 (m, 2H), 7.10 (t, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 3.99 (s, 3H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-167		δ 7.58-7.51 (m, 3H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.31 (m, 1H), 7.18 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 1.82-1.75 (m, 1H), 1.67 (s, 6H), 1.56 (app. d, 6H), 0.94-0.88 (m, 2H), 0.85-0.79 (m, 1H), 0.63-0.58 (m, 1H).
A-168		δ 7.80 (d, 1H), 7.64 (dd, 1H), 7.57 (app. d, 2H), 7.45 (app. d, 2H), 7.34 (d, 1H), 6.67 (dd, 1H), 5.82 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 5.36 (d, 1H), 1.66 (app. d, 6H), 1.55 (s, 6H).

مثال ٢٣:

تحضير :

6-(4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,4,4-tetramethyl-cyclohexane-1,3,5-trione



٥ إلى خليط من 2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione (٠.١٠٠ جرام ، ٠.٥٥ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (٠.٣٣ جرام، ٢.٧٠ ملي مول) تمت إضافة chloroform لامائي (٣.٦٠ مل)، ثم تبع ذلك التقليل عند درجة حرارة الغرفة إلى الوصول إلى الذوبان . إلى هذا المحلول تمت بعد ذلك إضافة toluene لامائي (١.٠٠ مل)، ثم :

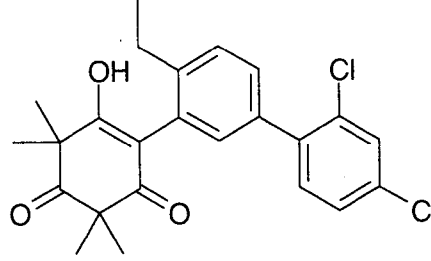
١٠ 4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (٠.٣٦ جرام، ٠.٦٠ ملي مول) على جزء واحد . تم تسخين المحلول عند ٨٠° م لمدة ساعة ، ثم تم تبريده إلى درجة حرارة الغرفة، بالتتابع تمت إضافة dichloromethane (٢٠٠ مل)، ثم تم الغسيل باستخدام ١ مولار hydrochloric acid (٢٠٠ مل) . تم فصل الطور العضوي ، وتم تجفيفه على magnesium sulfate اللامائية ، وتم الترشيح وتم تركيز ناتج الترشيح في حيز من الفراغ . تمت تنقية الكمية الباقية باستخدام عمود كروماتوجراف الوميض على silica gel (ethyl acetate / hexane بنسبة ٥ : ١) لتوفير :

6-(4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,4,4-tetra-methylcyclohexane-1,3,5-trione

(٠.١٧ جرام) كمادة صلبة متبلرة بيضاء .

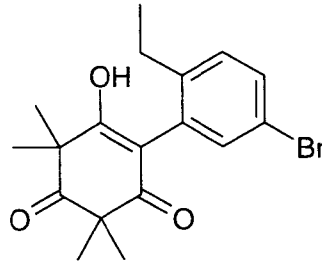
مثال ٢٤: تحضير :

6-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione



خطوة ١ تحضير :

6-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione



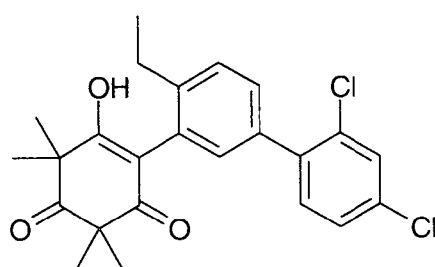
إلى خليط من : 2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione (٠.٦ جم، ٣.٦ ملي مول)،
5-bromo-2-ethylphenyllead triacetate (٢.٢٧ جم، ٤.٠٠ ملي مول) و
N,N-dimethylaminopyridine (٢.٢٢ جم، ١٨ ملي مول) تمت إضافة chloroform لامائي
(٢٥ مل) و toluene (٦.٣ مل)، وخليط التفاعل تم تسخينه عند ٨٠° م لمدة ٣ ساعات. تم تخفيف
التفاعل باستخدام dichloromethane (٥٠ مل) و ٢ مولار من hydrochloric acid المائي (١٠٠
مل)، وتم الترشيح عبر تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية . تم غسل عجينة
الترشيح باستخدام dichloromethane ، وتم تجميع كل الأجزاء العضوية ، وتم الغسل باستخدام
محلول ملحي، وتم تجفيفه على magnesium sulphate اللامائية ثم تم الترشيح . تم تركيز ناتج
الترشيح في حيز من الفراغ و تمت تنقية الكمية الباقية على عمود كروماتوجراف الوميض لتوفير :

6-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione

بيضاء (٠.٨٤ جم).

خطوة ٢: تحضير :

6-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,4,4-tetramethylcyclo-hexane-1,3,5-trione



٥

إلى وعاء ميكروويف تمت إضافة palladium(II) acetate (١.١ مجم، ٠.٠٠٤٩ ملي مول)،

tris(3-sulphophenyl)phosphine trisodium salt (٥.١ مجم، ٠.٠٠٩٩ ملي مول)، و-2,4,

dichlorophenylboronic acid (٠.٠٠٩٩ جم، ٠.٥ ملي مول)، :

6-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione (٠.١٩ جم، ٠.٥

١٠ ملي مول) و potassium phosphate (٠.٥٣ جم، ٢.٥ ملي مول). ماء غير محتوي على غازات

(٠.٧٥ مل) تمت إضافته بعد ذلك (وتم غسل أي مادة صلبة من منزلقات الوعاء)، ثم تبع ذلك

تقليب لمدة ٥ دقائق ثم التعريض إلى argon . تم بعد ذلك تسخين هذا الخليط عند ١٦٠°م تحت

إشعاع من الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة . كمية أخرى إضافية من :

2,4-dichlorophenylboronic acid (٠.٠٩٩ جم، ٠.٥ ملي مول) و potassium phosphate

١٥ (٠.٠٩٥ جم، ٠.٥ ملي مول) تمت إضافتها ، تمت تغطية خليط التفاعل مرة أخرى في جو من

argon ، و الخليط تم تسخينه عند ١٦٠°م لفترة تبلغ ١٥ دقيقة . بعد التبريد إلى درجة حرارة

الغرفة خليط التفاعل تم تخفيفه باستخدام dichloromethane (٥ مل) وتم جعله حمضيا باستخدام

٢ مولار من hydrochloric acid المائي . تم فصل الطور العضوي ، وتم تجفيفه على magnesium sulphate اللامائية ، وتم الترشيح باستخدام سداة من silica gel . تم تركيز ناتج الترشيح تحت ضغط منخفض وتم إذابة الكمية المتبقية N,N-dimethylformamide (تقريبا ١ مل) وتمت التنقية باستخدام HPLC تحضير ذي طور عكسي لتوفير :

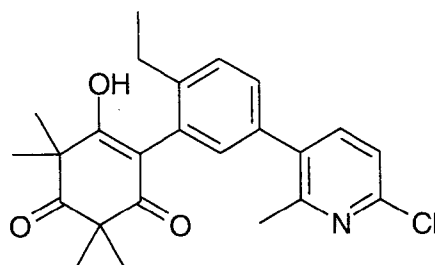
6-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,4,4-tetramethyl-cyclohexane-1,3,5-trione

٥

كزيت لا لون له (٨٠.٦ مجم).

مثال ٢٥: تحضير

6-[5-(6-chloro-2-methylpyridin-3-yl)-2-ethylphenyl]-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione



١٠

خليط من : 6-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione

(٠.١٩ جم، ٠.٥ ملي مول)، cesium fluoride (٠.٢٤ جم، ١.٦ ملي مول) ، :

6-chloro-2-methylpyridin-3-ylboronic acid (٠.١٣ جم، ٠.٨ ملي مول) ومركب منزوع

الغازات عبارة عن 1,2-dimethoxyethane (١.٧ مل) تم تقليبه في nitrogen عند درجة حرارة

الغرفة لمدة ٣٠ دقيقة . [1,1'-Bis-(diphenylphosphino)ferrocene]dichloro-palladium(II)

١٥

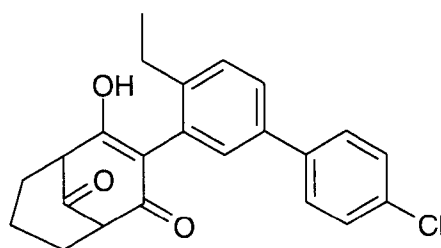
(٠.٠٣٤ جم، ٠.٠٤٢ ملي مول) تمت إضافته وتم تقليب التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة

١٠ دقائق و ثم تم التسخين ٨٠ درجة مئوية طوال الليل. بعد التبريد إلى درجة حرارة الغرفة خليط التفاعل تم تخفيفه باستخدام dichloromethane (٥ مل) و ماء وتم الترشيح عبر تراب دياتومي . تم جعل ناتج الترشيح حمضي باستخدام ٢ مولار من hydrochloric acid المائي ، و تم فصل الطور العضوي ، وتم تجفيفه على magnesium sulphate اللامائية وتم التركيز في وسط مفرغ. تمت إذابة الكمية المتبقية N,N-dimethylformamide (تقريبا ١ مل) وتمت التنقية باستخدام HPLC تحضير ذي طور عكسي لتوفير :

6-[5-(6-chloro-2-methylpyridin-3-yl)-2-ethylphenyl]-2,2,4,4-tetramethylcyclohexane-1,3,5-trione

كمادة صلبة بنية باهتة اللون (٧٥.٣ مجم).

١٠ مثال ٢٦: تحضير : 3-(4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)bicyclo[3.2.1]nonane-2,4,9-trione



4'-Chloro-4-ethylbiphenyl-3-yllead triacetate (٠.٩٤ جم، ١.٥٧ ملي مول) تمت إضافتها بحرص إلى محلول من bicyclo[3.2.1]nonane-2,4,9-trione (تم تحضيره طبقا للإجراء الوارد في F. EffenbeRgeR et al., Chem BeR. (1986) 119, 3394-3404) (٠.٢٣٧ جم، ١.٤٢ ملي مول

١٥) و N,N-dimethylaminopyridine (٠.٨٧ جم، ٧.١٣ ملي مول) في خليط من chloroform لامائي (١٠ مل) و toluene (٢.٥ مل) عند ٨٠ درجة مئوية . وتم تقليب التفاعل عند ٨٠ درجة مئوية لمدة ٣ ساعات ، ثم تم تبريده إلى درجة حرارة الغرفة، تم التخفيف باستخدام

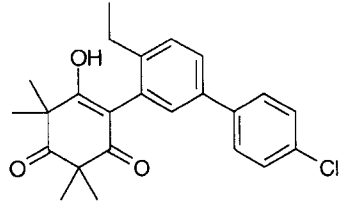
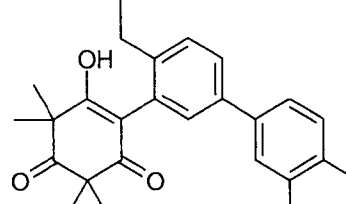
dichloromethane و ٢ مولار من hydrochloric acid المائي تمت إضافة . تم ترشيح الخليط عبر تراب دياتومي لإزالة المواد المتبقية غير العضوية . تم غسل عجينة الترشيح باستخدام dichloromethane وتم تجميع نواتج الترشيح، وتم الغسل باستخدام محلول ملحي، وتم تجفيفه على magnesium sulphate اللامائية ، وتم الترشيح. تم تركيز ناتج الترشيح في وسط مفرغ و تمت تنقية الكمية الباقية باستخدام عمود كروماتوجراف الوميض silica gel و ثم تمت التنقية أيضا

بإستخدام HPLC تحضيرى ذى طور عكسي لتوفير :

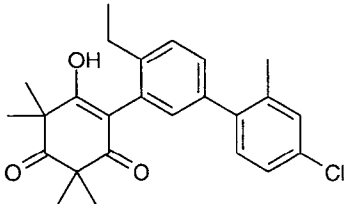
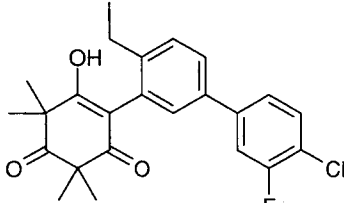
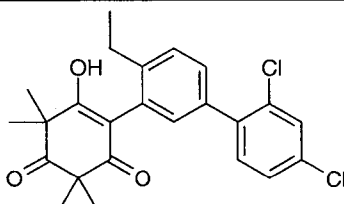
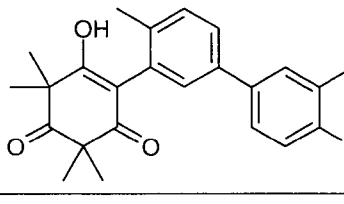
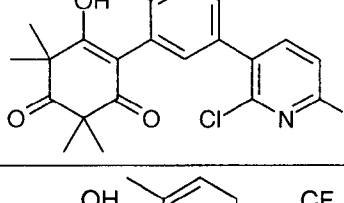
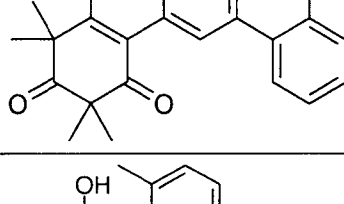
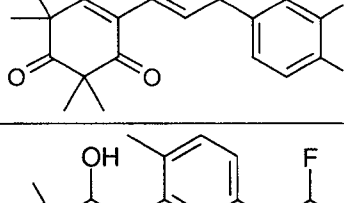
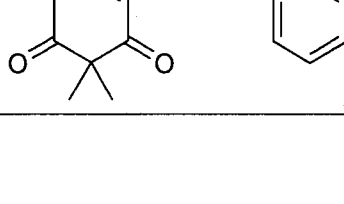
3-(4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)bicyclo[3.2.1]nonane-2,4,9-trione (٠.٠٨٧ جم) كمادة صلبة مائلة إلى الإصفرار .

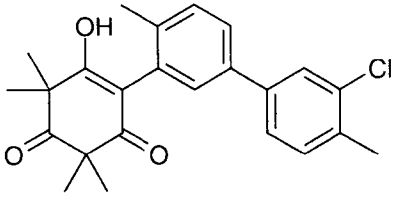
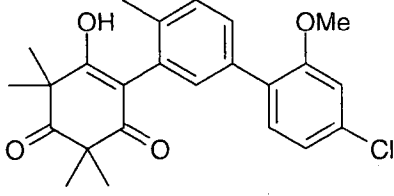
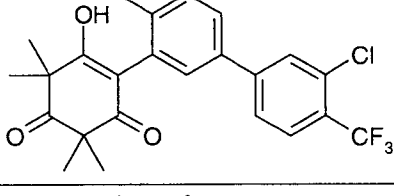
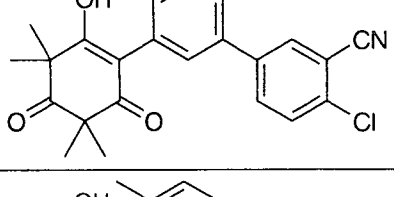
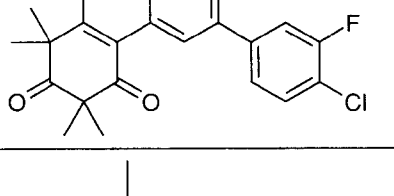
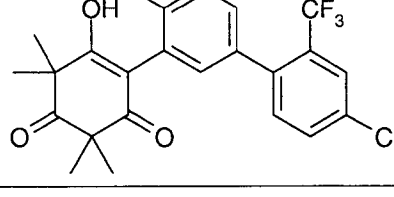
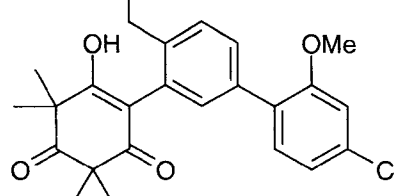
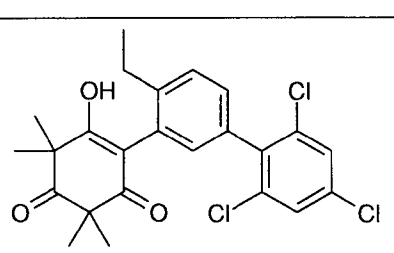
تم تحضير بعض المركبات الأخرى في الجدول ب باستخدام إجراءات مناظرة من مواد البدء المناسبة .

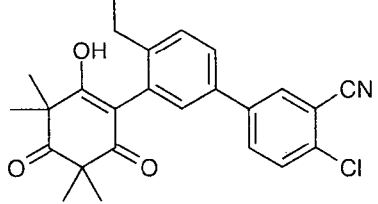
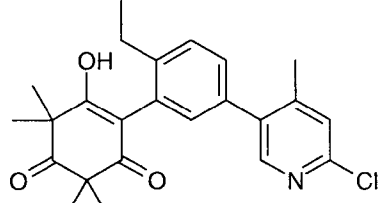
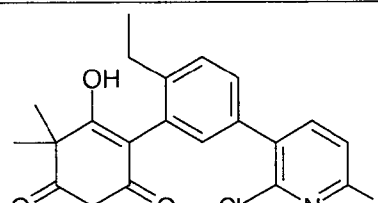
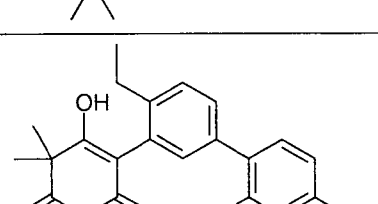
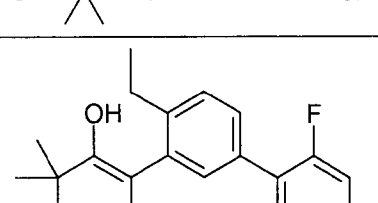
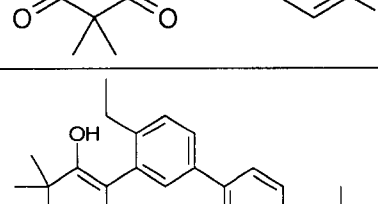
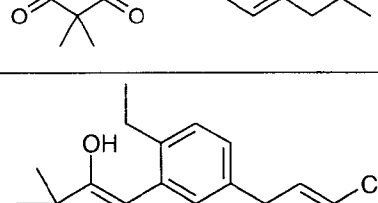
جدول ب

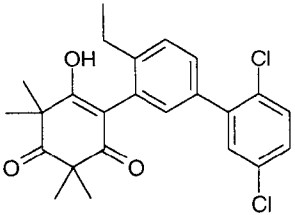
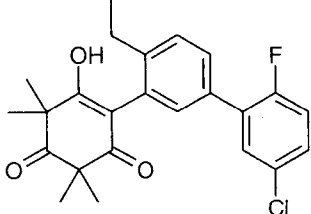
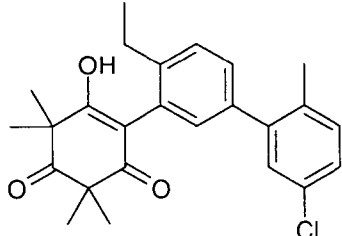
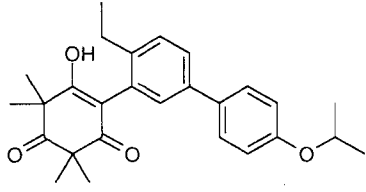
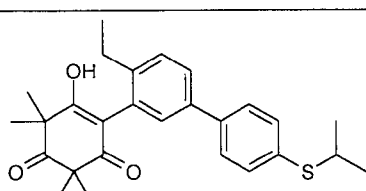
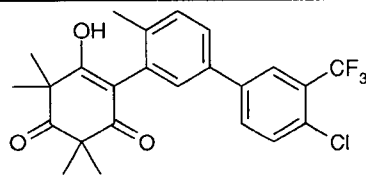
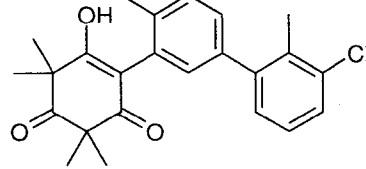
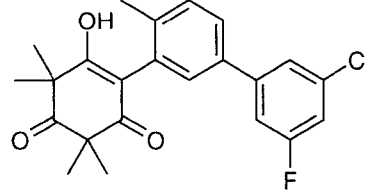
رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
B-1		δ 7.58 (dd, 1H), 7.52-7.59 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.41-7.38 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 5.74 (s, 1H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.56 (app. d, 6H), 1.46 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-2		δ 7.55 (dd, 1H), 7.44-7.29 (m, 4H), 7.22-7.26 (m, 1H), 5.91 (br. s, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 1.55 (app. d, 6H), 1.45 (app. d, 6H), 1.14 (t, 3H).

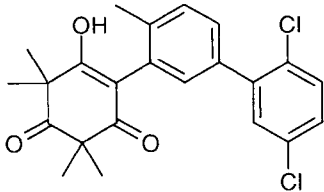
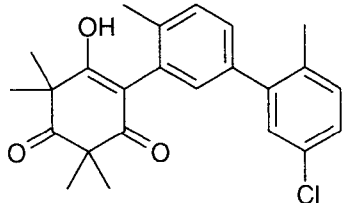
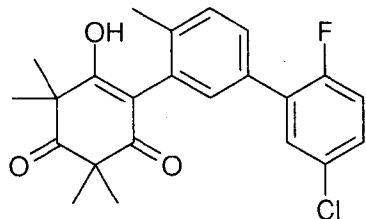
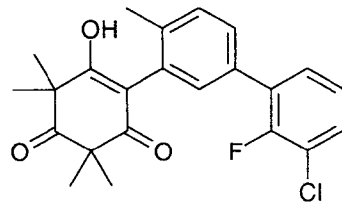
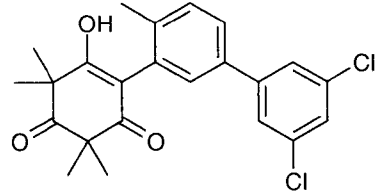
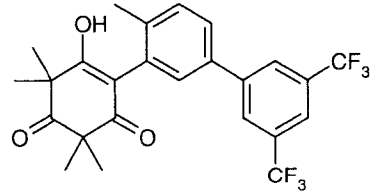
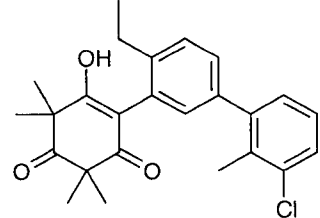
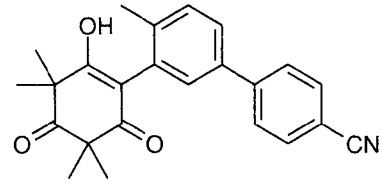
B-3		δ 7.38 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.18(m, 2H) 7.02 (s, 1H), 5.84 (b, 1H), 2.28 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-4		δ 7.55 (m, 3H), 7.43 (m, 3H), 7.3 (m, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).
B-5		δ 8.37 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.8 (m, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.12 (m, 1H), 1.82 (b, 6H), 1.5 (b, 6H).
B-6		δ 7.5 (d,1H), 7.4 (d,1H), 7.28 (dd, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.04 (d, 1H) 2.5 (s, 3H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (bd, 6H), 1.43 (bd, 6H).
B-7		δ 7.5 (s, 1H), 7.4 (s, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.55 (b, 6H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-8		δ 7.9 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H).
B-9		δ 8.32 (d, 1H), 7.52-7.38 (m, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.29-7.21 (m, 2H), 6.03-5.67 (m, 1H), 2.58-2.35 (m, 2H), 1.65-1.38 (m, 12H), 1.16 (t, 2.3H), 1.10 (t, 0.7H).
B-10		δ 7.87 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.61-7.53 (m, 2H), 7.51-7.46 (m, 1H), 7.31-7.23 (m, 1H), 5.73 (s, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.62-1.52 (m, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).

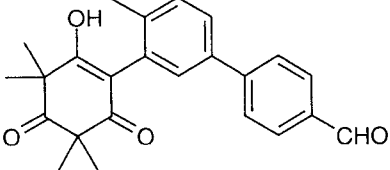
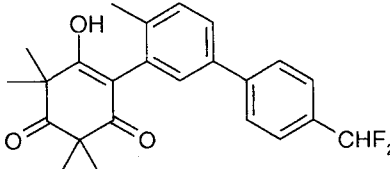
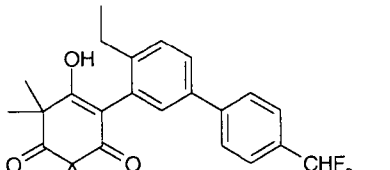
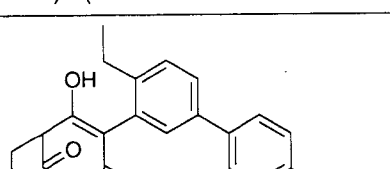
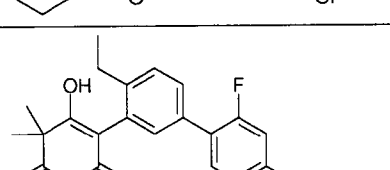
B-11		δ 7.42 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.29-7.24 (m, 1H), 7.23-7.14 (m, 2H), 7.03-6.99 (m, 1H), 5.84 (br. s, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-12		δ 7.57 (dd, 1H), 7.48-7.41 (m, 2H), 7.38-7.28 (m, 2H), 7.25-7.23 (m, 1H), 5.85 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H),.
B-13		δ 7.49 (s, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.34-7.29 (m, 2H), 7.14 (s, 1H), 6.02-5.91 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-14		δ 7.51 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.29 (s, 1H), 5.87 (s, 1H), 2.42 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-15		δ 7.68 (d, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.1 (b, 1H), 2.21 (s, 3H) 1.4-1.55 (br, 12H).
B-16		δ 7.72 (d, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.4 (s, 3H).
B-17		δ 7.69 (s, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.42 (m, 2H), 7.3 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.6 (br, 6H), 1.51 (br, 6H).
B-18		δ 7.53 (m, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.28 (m, 3H), 6.0 (s, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.6 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).

B-19		δ 7.52 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.28 (m, 2H), 5.87 (s, 1H), 2.4 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-20		δ 7.48 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.99 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.51 (s, 3H), 1.48 (s, 3H).
B-21		δ 7.77 (m, 2H), 7.59 (m, 2H), 7.49 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 5.88 (b, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).
B-22		δ 7.85 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.5 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 5.8 (b, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-23		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.35 (dd, 1H), 7.3 (m, 2H), 5.83 (s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (s, 6H).
B-24		δ 7.73-7.71 (m, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.03 (s, 1H), 5.80 (br. s, 1H), 2.56-2.44 (m, 2H), 1.54 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.18 (t, 3H),.
B-25		δ 7.50 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.27-7.23 (m, 1H), 7.15-7.18 (m, 1H), 7.02-6.98 (m, 1H), 6.96-6.93 (m, 1H), 6.16-6.04 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.54-2.41 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-26		δ 7.47 (d, 1H), 7.45-7.39 (m, 2H), 7.30-7.21 (m, 1H), 6.99-6.95 (m, 1H), 6.01-5.76 (m, 1H), 2.58-2.43 (m, 2H), 1.52-1.60 (m, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).

B-27		δ 7.86-7.84 (m, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.58-7.53 (m, 2H), 7.50-7.47 (m, 1H), 7.29-7.23 (m, 1H), 5.92 (br. s, 1H), 2.57-2.44 (m, 2H), 1.60-1.55 (m, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-28		δ 8.10-7.94 (m, 1H), 7.50-7.35 (m, 1H), 7.29-7.20 (m, 2H), 7.03-7.00 (m, 1H), 6.58-6.31 (m, 1H), 2.59-2.48 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-29		δ 7.68 (d, 1H), 7.50-7.44 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.19-7.15 (m, 1H), 6.01-5.95 (m, 1H), 2.57-2.45 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-30		δ 7.51 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.04-7.00 (m, 1H), 6.04-5.82 (m, 1H), 2.58-2.44 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-31		δ 7.54 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.23-7.16 (m, 3H), 5.96-5.84 (m, 1H), 2.56-2.42 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-32		δ 7.62-7.58 (m, 1H), 7.48 (d, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.29-7.25 (m, 1H), 7.20 (d, 2H), 6.03-5.96 (m, 1H), 2.54-2.41 (m, 2H), 2.51 (d, 2H), 1.94-1.83 (m, 1H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.15 (t, 3H), 0.93 (d, 6H).
B-33		δ 7.61-7.54 (m, 2H), 7.45 (d, 2H), 7.38-7.29 (m, 2H), 7.27-7.25 (m, 1H), 5.91-5.84 (m, 1H), 2.55-2.42 (m, 2H), 1.59-1.54 (m, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).

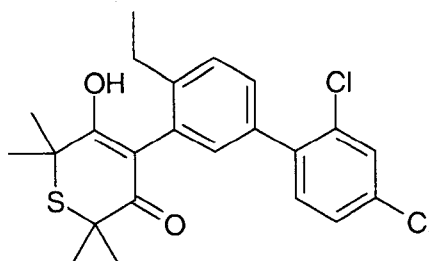
B-34		δ 7.47-7.44 (m, 2H), 7.41-7.36 (m, 2H), 7.26-7.23 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.00-5.94 (m, 1H), 2.57-2.44 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-35		δ 7.56 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.29-7.21 (m, 2H), 7.08 (t, 1H), 5.99-5.90 (m, 1H), 2.56-2.41 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-36		δ 7.42 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.25-7.16 (m, 3H), 7.03-7.00 (m, 1H), 5.87 (s, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-37		δ 7.54-7.58 (m, 1H), 7.48 (d, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.24-7.22 (m, 1H), 6.94 (d, 2H), 6.03-5.95 (m, 1H), 4.58 (quintet, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.36 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-38		δ 7.61-7.58 (m, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.46-7.42 (m, 3H), 7.28-7.26 (m, 1H), 5.87 (br. s, 1H), 3.41 (quintet, 1H), 2.54-2.41 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.32 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-39		δ 7.91 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.59 (d, 6H), 1.56 (d, 6H).
B-40		δ 7.38 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.13 (m, 2H), 7.02 (s, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.3 (s, 3H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-41		δ 7.5 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.06 (m, 1H), 5.78 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.47 (d, 6H).

B-42		δ 7.4 (m, 4H), 7.24 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 6.0 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.54 (d, 6H), 1.45 (d, 6H).
B-43		δ 7.38 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.02 (s, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.23 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.54 (d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.43 (s, 3H).
B-44		δ 7.5 (m, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.08 (t, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.43 (s, 3H).
B-45		δ 7.49 (d, 1H), 7.41 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.13 (m, 1H), 5.94 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-46		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (m, 3H), 7.32 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 5.8 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (s, 6H), 1.47 (d, 6H).
B-47		δ 7.99 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.31 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.55 (b, 6H), 1.48 (b, 6H).
B-48		δ 7.42 (d, 1H), 7.38-7.34 (m, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.01 (d, 1H), 5.86 (br. s, 1H), 2.57-2.43 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-49		δ 7.69 (q, 4H), 7.57 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 5.81 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.46 (s, 6H).

B-50		δ 10.04 (s, 1H), 7.93 (d, 2H), 7.73 (d, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.37 (s, 1H) 5.88 (b, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.47 (d, 6H).
B-51		δ 7.65 (m, 2H), 7.58 (m, 3H), 7.43 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 6.82 – 6.54 (t, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H)
B-52		δ 7.66 (app. d, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.57 (app. d, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.69 (t, 1H), 5.80 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.57 (br. s, 6H), 1.47 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H)
B-53		m.p. 79.5 °C; LC-MS (ES+) 381 (M+H)+
B-54		δ 7.65-7.50 (m, 3H), 7.40-7.29 (m, 3H), 6.71 (t, 1H), 5.93 (br. s, 1H), 2.61-2.48 (m, 2H), 1.61-1.60 (m, 6H), 1.51-1.47 (m, 6H), 1.23-1.18 (m, 3H).

المثال ٢٧ : تحضير :

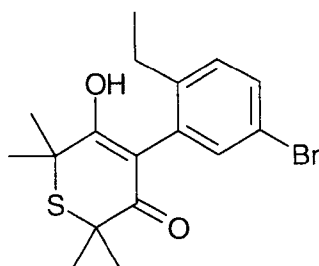
4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-thiopyran-3,5-dione



خطوة ١ : تحضير :

4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione

٥



إلى محلول من 2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione (تم تحضيره طبقا للإجراء الوارد في

E. Er and P. Margaretha, Helvetica Chimica Acta (1992), 75(7), 2265-69) (١.٨ جرام .

٩.٩ ملي مول) و N,N-dimethylaminopyridine (٥.٣ جم، ٤.٣٤ ملي مول) في

chloroform (٦٠ مل)، تمت إضافة toluene (١٨ مل) ثم 5-bromo-2-ethylphenyllead ٥

triacetate (٦.٢ جرام، ١.٠٩ ملي مول) على جزء واحد . الخليط الناتج تم تسخينه عند الارتجاع

لمدة ساعتين، ثم ترك ليبرد إلى درجة الحرارة المحيطة، تم التخفيف باستخدام

dichloromethane وواحد مولار من hydrochloric acid المائي، و تم فصل الطور العضوي. تم

تركيز الطور العضوي تحت ضغط منخفض، و تمت تنقية الكمية الباقية على كروماتوجراف

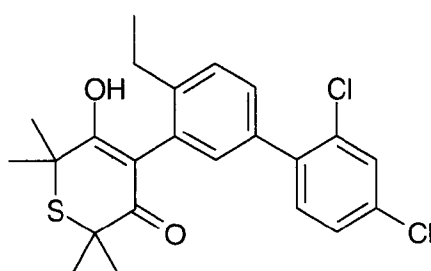
١٠ ومبضي على silica gel (ethyl acetate / hexane ٩٥:٥ إلى ٧:٣ بنسبة)، لتوفير :

4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione (٢.٤٢ جم) كمادة

صلبة برتقالية .

خطوة ٢: تحضير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-thiopyran-3,5-dione



إلى وعاء ميكروويف تمت إضافة :

4-(5-bromo-2-methylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione (٥٠٠ مجم، ١.٣٦

ملي مول)، 2,4-dichlorophenylboronic acid (٣٨٩ مجم، ٢.٠٥ ملي مول) ، :

[1,1-bis(diphenyl-phosphino)ferrocene] palladium(II) chloride (١١١ مجم ، ٠.٠٠٠١٣٦

مول)، و cesium fluoride (٦٢٠ مجم ، ٠.٠٠٠٤٠٨ مول) ، ثم تبع ذلك المركب المنزوع الماء

من 1,2-dimethoxyethane (٣ مل) في جو من nitrogen . ثم تم تقليب الخليط ٥ دقائق عند

درجة الحرارة المحيطة ، ثم تم التسخين ١٦٠°م تحت إشعاع من الميكروويف لمدة ١٥ دقيقة . تم

تبريد خليط التفاعل إلى درجة حرارة الغرفة، وتمت تجزئته بين ٢ مولار من hydrochloric acid

المائي و dichloromethane . تم فصل الطور العضوي وتم التركيز تحت ضغط منخفض . تمت

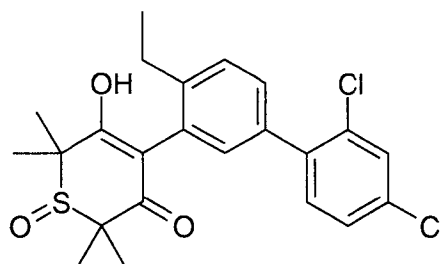
١٠ تنقية الكمية الباقية باستخدام HPLC تحضير ذي طور عكسي لتوفير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-thiopyran-3,5-dione (٢٦٤

مجم) كمادة صمغية بنية .

مثال ٢٨: تحضير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-1-oxothio-pyran-3,5-dione



١٥

خليط من :

٧٩ مجم ، 4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione
٠.١٨١٦ ملي مول) ، peracetic acid (١.٨ جرام . ٧.٢ ملي مول ، ٣٦-٤٠٪ محلول من
حمض الأسيتيك) و dichloromethane (٠.٢٣ مل) تم تقليبها لمدة ٤ ساعات عند درجة الحرارة
المحيطة .

٥ خليط التفاعل تمت تجزئته بين ماء و dichloromethane ، و تم فصل الطور العضوي ثم تم
تركيزه تحت ضغط منخفض . تمت تنقية الكمية الباقية باستخدام HPLC تحضير ذي طور
عكسي لتوفير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-1-oxothiopyran-3,5-dione

(٣٢.٩ مجم) كمادة صمغية رائقة .

١٠ مثال ٢٩: تحضير :

4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-1,1-dioxothiopyran-3,5-dione

خليط من 4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylthiopyran-3,5-dione

(٧٩ مجم، ٠.١٨١٦ ملي مول) و oxone (٤٤٦ مجم، ٠.٧٢٦ ملي مول) تم تقليبها عند درجة
الحرارة المحيطة لمدة ٢٠ ساعة كمحلول في methanol / ماء (١ مل ، بنسبة ١:١). ثم تمت

١٥ تجزئة خليط التفاعل بين ماء و dichloromethane ، تم فصل الطور العضوي وتم التركيز تحت
ضغط منخفض . تمت تنقية الكمية الباقية باستخدام HPLC تحضير ذي طور عكسي لتوفير :

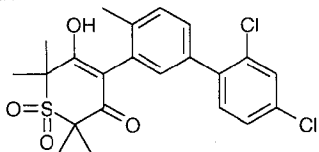
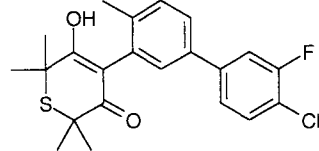
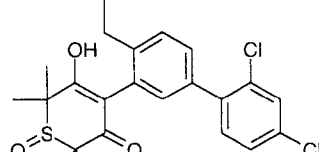
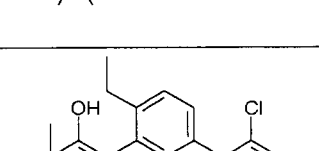
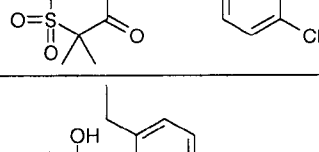
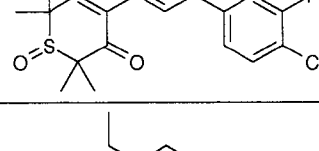
4-(2',4'-dichloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-1,1-dioxo-thiopyran-3,5-dione

(٢٤.٦ مجم) كمادة صمغية رائقة .

تم تحضير بعض المركبات الإضافية في الجدول ج بالإجراءات المناظرة، من مواد البدء المناسبة.

جدول ج

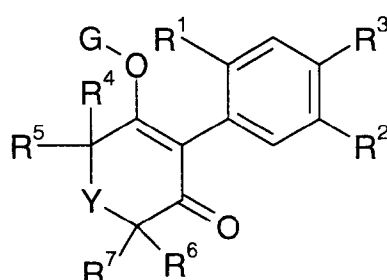
رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3) ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
C-1		δ 7.55 (dd, 1H), 7.51-7.48 (m, 2H), 7.43-7.38 (m, 1H), 7.43-7.38 (m, 2H), 7.21 (d, 1H), 5.42 (br.s, 1H), 2.53-2.42 (m, 2H), 1.72 (app. d, 6H), 1.60 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
C-2		δ 7.58 (dd, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.40 (d, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.69 (s, 12H), 1.16 (t, 3H).
C-3		δ 7.60 (dd, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.23 (d, 1H), 5.78 (s, 1H), 2.44 (m, 2H), 1.86 (s, 6H), 1.74 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
C-4		δ 7.52-7.31 (m, 5H), 7.14 (s, 0.65H, isomer A), 7.08 (s, 0.25H, isomer B), 5.87 (br. s, 0.25H, isomer B), 5.67 (br. s, 0.65H, isomer A), 2.62-2.48 (m, 2H), 1.76-1.59 (m, 12H), 1.28-1.19 (m, 3H)
C-5		δ 7.59-7.31 (m, 5H); 7.25 (d, 0.7H, isomer A), 7.19 (d, 0.3H, isomer B), 5.90 (br. s, 0.3H, isomer B), 5.54 (br. s, 0.7H, isomer A), 2.62-2.47 (m, 2H); 1.17-1.61 (m, 12H); 1.26-1.18 (m, 3H)
C-6		Methanol- d_4 δ 7.55 (s, 1H); 7.40 (s, 2H); 7.35 (s, 2H); 7.03 (s, 1H); 2.18 (s, 3H); 1.65 (s, 6H), 1.60 (s, 6H)
C-7		Methanol- d_4 δ 7.53 (s, 1H), 7.36 (s, 2H), 7.34 (s, 2H), 7.09 (s, 0.5H, isomer A), 7.00 (s, 0.5H, isomer B), 2.16 (s, 1.5H, isomer A or B), 2.13 (s, 1.5H, isomer A or B), 1.69 (s, 3H, isomer A or B), 1.67 (s, 3H, isomer A or B), 1.62 (s, 6H, isomers A and B)

C-8		Methanol-d ₄ δ 7.53 (s, 1H); 7.37 (s, 2H), 7.33 (s, 2H), 7.03 (s, 1H); 2.13 (s, 3H); 1.72 (s, 12H)
C-9		δ 7.50-7.15 (m, 6H); 5.75 (br. s, 1H), 2.23 (s, 1H, isomer A), 2.18 (s, 2H, isomer B), 1.65 (br. s, 12H)
C-10		δ 7.51 (s, 1H); 7.46 (s, 2H); 7.33 (s, 2H), 7.16 (s, 0.5H, isomer A), 7.09 (s, 0.5H, isomer B), 6.16 (br. s, 1H), 2.55-2.45 (m, 2H); 1.76 (app. d, 6H); 1.62 (app. d, 6H); 1.20 (m, 3H)
C-11		δ 7.48 (s, 1H); 7.45 (s, 2H); 7.31 (s, 2H); 7.12 (s, 1H); 6.04 (br. s, 1H), 2.50-2.41 (m, 2H); 1.85 (s, 6H); 1.72 (app. d, 6H); 1.16 (t, 3H)
C-12		δ 7.56 (dd, 1H); 7.47-7.41 (m, 2H); 7.37-7.28 (m, 2.5H); 7.16 (d, 0.5H); 2.49-2.39 (m, 2H); 1.68 (app. d, 12H); 1.17-1.12 (m, 3H)
C-13		δ 7.59 (dd, 1H); 7.47-7.44 (m, 2H); 7.35 (dd, 1H); 7.30 (dd, 1H); 7.22 (d, 1H); 5.84 (br. s, 1H), 2.49-2.40 (m, 2H); 1.87 (app. d, 6H); 1.73 (s, 6H); 1.14 (t, 3H)

المركبات الواردة في الجداول التالية من ١ إلى ٢٩٤ يمكن الحصول عليها بطريقة مناظرة.

الجدول ١:

يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركباً من النوع التالي:



حيث Y هي O، R¹ هي methyl، و R⁴، R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي
hydrogen و R² و R³ تكون على النحو المحدد أدناه :

R ³	رقم المركب	R ²
H	١.٠٠١	Phenyl
H	١.٠٠٢	2-fluorophenyl
H	١.٠٠٣	3-fluorophenyl
H	١.٠٠٤	4-fluorophenyl
H	١.٠٠٥	2-chlorophenyl
H	١.٠٠٦	3-chlorophenyl
H	١.٠٠٧	4-chlorophenyl
H	١.٠٠٨	2-bromophenyl
H	١.٠٠٩	3-bromophenyl
H	١.٠١٠	4-bromophenyl
H	١.٠١١	4-tert-butyl
H	١.٠١٢	2-iodophenyl
H	١.٠١٣	3-iodophenyl
H	١.٠١٤	4-iodophenyl
H	١.٠١٥	2-methylphenyl
H	١.٠١٦	3-methylphenyl
H	١.٠١٧	4-methylphenyl
H	١.٠١٨	2-cyanophenyl
H	١.٠١٩	3-cyanophenyl
H	١.٠٢٠	4-cyanophenyl
H	١.٠٢١	2-methoxyphenyl
H	١.٠٢٢	3-methoxyphenyl
H	١.٠٢٣	4-methoxyphenyl

H	1.024	2-difluoromethoxyphenyl
H	1.025	3-difluoromethoxyphenyl
H	1.026	4-difluoromethoxyphenyl
H	1.027	2-difluoromethylphenyl
H	1.028	3-difluoromethylphenyl
H	1.029	4-difluoromethylphenyl
H	1.030	2-trifluoromethylphenyl
H	1.031	3-trifluoromethylphenyl
H	1.032	4-trifluoromethylphenyl
H	1.033	2-trifluoromethoxyphenyl
H	1.034	3-trifluoromethoxyphenyl
H	1.035	4-trifluoromethoxyphenyl
H	1.036	4-methylthiophenyl
H	1.037	4-methylsulfinylphenyl
H	1.038	4-methylsulfonylphenyl
H	1.039	4-trifluoromethylthiophenyl
H	1.040	4-trifluoromethylsulfinylphenyl
H	1.041	4-trifluoromethylsulfonylphenyl
H	1.042	2,3-difluorophenyl
H	1.043	2,4-difluorophenyl
H	1.044	2,5-difluorophenyl
H	1.045	2,6-difluorophenyl
H	1.046	3,4-difluorophenyl
H	1.047	3,5-difluorophenyl
H	1.048	2,3-dichlorophenyl
H	1.049	2,4-dichlorophenyl

H	۱.۰۰۰	2,5-dichlorophenyl
H	۱.۰۰۱	2,6-dichlorophenyl
H	۱.۰۰۲	3,4-dichlorophenyl
H	۱.۰۰۳	3,5-dichlorophenyl
H	۱.۰۰۴	4-chloro-2-cyanophenyl
H	۱.۰۰۵	4-chloro-3-cyanophenyl
H	۱.۰۰۶	4-chloro-2-fluorophenyl
H	۱.۰۰۷	4-chloro-3-fluorophenyl
H	۱.۰۰۸	4-chloro-2-methoxyphenyl
H	۱.۰۰۹	4-chloro-3-methoxyphenyl
H	۱.۰۱۰	4-chloro-2-methylphenyl
H	۱.۰۱۱	4-chloro-3-methylphenyl
H	۱.۰۱۲	4-chloro-2-difluoromethoxyphenyl
H	۱.۰۱۳	4-chloro-3-difluoromethoxyphenyl
H	۱.۰۱۴	4-chloro-2-trifluoromethoxyphenyl
H	۱.۰۱۵	4-chloro-3-trifluoromethoxyphenyl
H	۱.۰۱۶	4-chloro-2-difluoromethylphenyl
H	۱.۰۱۷	4-chloro-3-difluoromethylphenyl
H	۱.۰۱۸	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl
H	۱.۰۱۹	4-chloro-3-trifluoromethylphenyl
H	۱.۰۲۰	4-chloro-2,3-difluorophenyl
H	۱.۰۲۱	4-chloro-2,5-difluorophenyl
H	۱.۰۲۲	4-chloro-2,6-difluorophenyl
H	۱.۰۲۳	2,4-dichloro-3-fluorophenyl
H	۱.۰۲۴	2,4-dichloro-5-fluorophenyl
H	۱.۰۲۵	2,4-dichloro-6-fluorophenyl

H	۱.۰۷۶	2,3,4-trichlorophenyl
H	۱.۰۷۷	2,3,5-trichlorophenyl
H	۱.۰۷۸	2,3,6-trichlorophenyl
H	۱.۰۷۹	2,4,5-trichlorophenyl
H	۱.۰۸۰	2,4,6-trichlorophenyl
H	۱.۰۸۱	2,3,4-trifluorophenyl
H	۱.۰۸۲	2,3,5-trifluorophenyl
H	۱.۰۸۳	2,3,6-trifluorophenyl
H	۱.۰۸۴	2,4,5-trifluorophenyl
H	۱.۰۸۵	2,4,6-trifluorophenyl
H	۱.۰۸۶	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
H	۱.۰۸۷	3-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
H	۱.۰۸۸	2-chloropyridin-5-yl
H	۱.۰۸۹	3-chloropyridinyl-5-yl
H	۱.۰۹۰	2-methylpyridin-5-yl
H	۱.۰۹۱	3-methylpyridinyl-5-yl
H	۱.۰۹۲	2-trifluoromethylpyridin-5-yl
H	۱.۰۹۳	3-trifluoromethylpyridin-5-yl
H	۱.۰۹۴	2-chloro-3-methylpyridin-5-yl
H	۱.۰۹۵	2-chloro-4-methylpyridin-5-yl
H	۱.۰۹۶	6-chloro-2-methylpyridin-3-yl
H	۱.۰۹۷	2,3-dichloropyridin-5-yl
H	۱.۰۹۸	2,4-dichloropyridin-5-yl
H	۱.۰۹۹	2,6-dichloropyridin-3-yl
H	۱.۱۰۰	pyrazin-2-yl
H	۱.۱۰۱	2-chloropyrazin-5-yl

H	۱.۱۰۲	2-bromopyrazin-5-yl
H	۱.۱۰۳	pyridazin-3-yl
H	۱.۱۰۴	6-bromopyridazin-3-yl
H	۱.۱۰۵	6-chloropyridazin-3-yl
H	۱.۱۰۶	pyrimidin-5-yl
H	۱.۱۰۷	2-bromopyrimidin-5-yl
H	۱.۱۰۸	5-bromopyrimidin-2-yl
H	۱.۱۰۹	2-chloropyrimidin-5-yl
H	۱.۱۱۰	5-chloropyrimidin-2-yl
H	۱.۱۱۱	2-furyl
i-I	۱.۱۱۲	3-furyl
H	۱.۱۱۳	2-thienyl
H	۱.۱۱۴	3-thienyl
H	۱.۱۱۵	4-bromothien-2-yl
H	۱.۱۱۶	5-bromothien-2-yl
H	۱.۱۱۷	4-chlorothien-2-yl
H	۱.۱۱۸	5-chlorothien-2-yl
H	۱.۱۱۹	pyrazol-1-yl
H	۱.۱۲۰	3-chloropyrazol-1-yl
H	۱.۱۲۱	4-chloropyrazol-1-yl
H	۱.۱۲۲	1-methylpyrazol-4-yl
H	۱.۱۲۳	1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-5-yl
H	۱.۱۲۴	2-thiazolyl
H	۱.۱۲۵	4-methylthiazol-2-yl
H	۱.۱۲۶	5-methylthiazol-2-yl
CH ₃	۱.۱۲۷	phenyl

CH ₃	1.128	2-fluorophenyl
CH ₃	1.129	3-fluorophenyl
CH ₃	1.130	4-fluorophenyl
CH ₃	1.131	2-chlorophenyl
CH ₃	1.132	3-chlorophenyl
CH ₃	1.133	4-chlorophenyl
CH ₃	1.134	2-bromophenyl
CH ₃	1.135	3-bromophenyl
CH ₃	1.136	4-bromophenyl
CH ₃	1.137	4-tert-butyl
CH ₃	1.138	2-iodophenyl
CH ₃	1.139	3-iodophenyl
CH ₃	1.140	4-iodophenyl
CH ₃	1.141	2-methylphenyl
CH ₃	1.142	3-methylphenyl
CH ₃	1.143	4-methylphenyl
CH ₃	1.144	2-cyanophenyl
CH ₃	1.145	3-cyanophenyl
CH ₃	1.146	4-cyanophenyl
CH ₃	1.147	2-methoxyphenyl
CH ₃	1.148	3-methoxyphenyl
CH ₃	1.149	4-methoxyphenyl
CH ₃	1.150	2-difluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.151	3-difluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.152	4-difluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.153	2-difluoromethylphenyl

CH ₃	1.104	3-difluoromethylphenyl
CH ₃	1.100	4-difluoromethylphenyl
CH ₃	1.106 -	2-trifluoromethylphenyl
CH ₃	1.107	3-trifluoromethylphenyl
CH ₃	1.108	4-trifluoromethylphenyl
CH ₃	1.109	2-trifluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.160	3-trifluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.161	4-trifluoromethoxyphenyl
CH ₃	1.162	4-methylthiophenyl
CH ₃	1.163	4-methylsulfinylphenyl
CH ₃	1.164	4-methylsulfonylphenyl
CH ₃	1.165	4-trifluoromethylthiophenyl
CH ₃	1.166	4-trifluoromethylsulfinylphenyl
CH ₃	1.167	4-trifluoromethylsulfonylphenyl
CH ₃	1.168	2,3-difluorophenyl
CH ₃	1.169	2,4-difluorophenyl
CH ₃	1.170	2,5-difluorophenyl
CH ₃	1.171	2,6-difluorophenyl
CH ₃	1.172	3,4-difluorophenyl
CH ₃	1.173	3,5-difluorophenyl
CH ₃	1.174	2,3-dichlorophenyl
CH ₃	1.175	2,4-dichlorophenyl
CH ₃	1.176	2,5-dichlorophenyl
CH ₃	1.177	2,6-dichlorophenyl
CH ₃	1.178	3,4-dichlorophenyl
CH ₃	1.179	3,5-dichlorophenyl

CH ₃	۱.۱۸۰	4-chloro-2-cyanophenyl
CH ₃	۱.۱۸۱	4-chloro-3-cyanophenyl
CH ₃	۱.۱۸۲	4-chloro-2-fluorophenyl
CH ₃	۱.۱۸۳	4-chloro-3-fluorophenyl
CH ₃	۱.۱۸۴	4-chloro-2-methoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۸۵	4-chloro-3-methoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۸۶	4-chloro-2-methylphenyl
CH ₃	۱.۱۸۷	4-chloro-3-methylphenyl
CH ₃	۱.۱۸۸	4-chloro-2-difluoromethoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۸۹	4-chloro-3-difluoromethoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۹۰	4-chloro-2-trifluoromethoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۹۱	4-chloro-3-trifluoromethoxyphenyl
CH ₃	۱.۱۹۲	4-chloro-2-difluoromethylphenyl
CH ₃	۱.۱۹۳	4-chloro-3-difluoromethylphenyl
CH ₃	۱.۱۹۴	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl
CH ₃	۱.۱۹۵	4-chloro-3-trifluoromethylphenyl
CH ₃	۱.۱۹۶	4-chloro-2,3-difluorophenyl
CH ₃	۱.۱۹۷	4-chloro-2,5-difluorophenyl
CH ₃	۱.۱۹۸	4-chloro-2,6-difluorophenyl
CH ₃	۱.۱۹۹	2,4-dichloro-3-fluorophenyl
CH ₃	۱.۲۰۰	2,4-dichloro-5-fluorophenyl
CR ³	۱.۲۰۱	2,4-dichloro-6-fluorophenyl
CH ₃	۱.۲۰۲	2,3,4-trichlorophenyl
۳OH	۱.۲۰۳	2,3,5-trichlorophenyl
CH ₃	۱.۲۰۴	2,3,6-trichlorophenyl
CH ₃	۱.۲۰۵	2,4,5-trichlorophenyl

CH ₃	1.206	2,4,6-trichlorophenyl
CH ₃	1.207	2,3,4-trifluorophenyl
CH ₃	1.208	2,3,5-trifluorophenyl
CH ₃	1.209	2,3,6-trifluorophenyl
CH ₃	1.21	2,4,5-trifluorophenyl
CH ₃	1.211	2,4,6-trifluorophenyl
CH ₃	1.212	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
CR ³	1.213	3-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
CH ₃	1.214	2-chloropyridin-5-yl
CH ₃	1.215	3-chloropyridinyl-5-yl
CH ₃	1.216	2-methylpyridin-5-yl
CH ₃	1.217	3-methylpyridinyl-5-yl
CH ₃	1.218	2-trifluoromethylpyridin-5-yl
CH ₃	1.219	3-trifluoromethylpyridin-5-yl
CH ₃	1.22	2-chloro-3-methylpyridin-5-yl
CH ₃	1.221	2-chloro-4-methylpyridin-5-yl
CH ₃	1.222	6-chloro-2-methylpyridin-3-yl
CH ₃	1.223	2,3-dichloropyridin-5-yl
CH ₃	1.224	2,4-dichloropyridin-5-yl
CH ₃	1.225	2,6-dichloropyridin-3-yl
CH ₃	1.226	pyrazin-2-yl
CH ₃	1.227	2-chloropyrazin-5-yl
CH ₃	1.228	2-bromopyrazin-5-yl
CH ₃	1.229	pyridazin-3-yl
CH ₃	1.23	6-bromopyridazin-3-yl
CH ₃	1.231	6-chloropyridazin-3-yl

CH ₃	۱.۲۳۲	pyrimidin-5-yl
CH ₃	۱.۲۳۳	2-bromopyrimidin-5-yl
CH ₃	۱.۲۳۴	5-bromopyrimidin-2-yl
CH ₃	۱.۲۳۵	2-chloropyrimidin-5-yl
CH ₃	۱.۲۳۶	5-chloropyrimidin-2-yl
CH ₃	۱.۲۳۷	2-furyl
CH ₃	۱.۲۳۸	3-furyl
CH ₃	۱.۲۳۹	2-thienyl
CH ₃	۱.۲۴	3-thienyl
CH ₃	۱.۲۴۱	4-bromothien-2-yl
CH ₃	۱.۲۴۲	5-bromothien-2-yl
CH ₃	۱.۲۴۳	4-chlorothien-2-yl
CH ₃	۱.۲۴۴	5-chlorothien-2-yl
CH ₃	۱.۲۴۵	pyrazol-1-yl
CH ₃	۱.۲۴۶	3-chloropyrazol-1-yl
CH ₃	۱.۲۴۷	4-chloropyrazol-1-yl
CR ³	۱.۲۴۸	1-methylpyrazol-4-yl
CH ₃	۱.۲۴۹	1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-5-yl
CH ₃	۱.۲۵	2-thiazolyl
CH ₃	۱.۲۵۱	4-methylthiazol-2-yl
CH ₃	۱.۲۵۲	5-methylthiazol-2-yl
Cl	۱.۲۵۳	phenyl
Cl	۱.۲۵۴	2-fluorophenyl
Cl	۱.۲۵۵	3-fluorophenyl
Cl	۱.۲۵۶	4-fluorophenyl
Cl	۱.۲۵۷	2-chlorophenyl

Cl	1.208	3-chlorophenyl
Cl	1.209	4-chlorophenyl
Cl	1.260 -	2-bromophenyl
Cl	1.261	3-bromophenyl
Cl	1.262	4-bromophenyl
Cl	1.263	4-tert-butyl
Cl	1.264	2-iodophenyl
Cl	1.265	3-iodophenyl
Cl	1.266 -	4-iodophenyl
Cl	1.267	2-methylphenyl
Cl	1.268	3-methylphenyl
Cl	1.269	4-methylphenyl
Cl	1.270	2-cyanophenyl
Cl	1.271 -	3-cyanophenyl
Cl	1.272	4-cyanophenyl
Cl	1.273	2-methoxyphenyl
Cl	1.274	3-methoxyphenyl
Cl	1.275	4-methoxyphenyl
Cl	1.276	2-difluoromethoxyphenyl
Cl	1.277	3-difluoromethoxyphenyl
Cl	1.278	4-difluoromethoxyphenyl
Cl	1.279	2-difluoromethylphenyl
Cl	1.280 -	3-difluoromethylphenyl
Cl	1.281	4-difluoromethylphenyl
Cl	1.282	2-trifluoromethylphenyl
Cl	1.283 -	3-trifluoromethylphenyl

Cl	1.284	4-trifluoromethylphenyl
Cl	1.285	2-trifluoromethoxyphenyl
Cl	1.286	3-trifluoromethoxyphenyl
Cl	1.287—	4-trifluoromethoxyphenyl
Cl	1.288	4-methylthiophenyl
Cl	1.289	4-methylsulfinylphenyl
Cl	1.290	4-methylsulfonylphenyl
Cl	1.291	4-trifluoromethylthiophenyl
Cl	1.292	4-trifluoromethylsulfinylphenyl
Cl	1.293	4-trifluoromethylsulfonylphenyl
Cl	1.294	2,3-difluorophenyl
Cl	1.295—	2,4-difluorophenyl
Cl	1.296	2,5-difluorophenyl
Cl	1.297	2,6-difluorophenyl
Cl	1.298	3,4-difluorophenyl
Cl	1.299	3,5-difluorophenyl
Cl	1.300	2,3-dichlorophenyl
Cl	1.301	2,4-dichlorophenyl
Cl	1.302	2,5-dichlorophenyl
Cl	1.303	2,6-dichlorophenyl
Cl	1.304	3,4-dichlorophenyl
Cl	1.305	3,5-dichlorophenyl
Cl	1.306	4-chloro-2-cyanophenyl
Cl	1.307	4-chloro-3-cyanophenyl
Cl	1.308	4-chloro-2-fluorophenyl
Cl	1.309	4-chloro-3-fluorophenyl

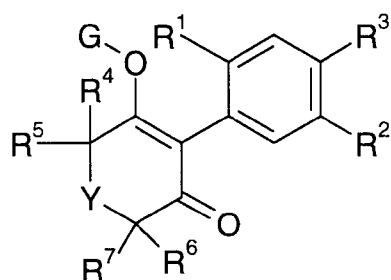
Cl	1.310	4-chloro-2-methoxyphenyl
Cl	1.311	4-chloro-3-methoxyphenyl
Cl	1.312	4-chloro-2-methylphenyl
Cl	1.313	4-chloro-3-methylphenyl
Cl	1.314	4-chloro-2-difluoromethoxyphenyl
Cl	1.315	4-chloro-3-difluoromethoxyphenyl
Cl	1.316	4-chloro-2-trifluoromethoxyphenyl
Cl	1.317	4-chloro-3-trifluoromethoxyphenyl
Cl	1.318	4-chloro-2-difluoromethylphenyl
	1.319	4-chloro-3-difluoromethylphenyl
Cl	1.320	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl
Cl	1.321	4-chloro-3-trifluoromethylphenyl
Cl	1.322	4-chloro-2,3-difluorophenyl
Cl	1.323	4-chloro-2,5-difluorophenyl
Cl	1.324	4-chloro-2,6-difluorophenyl
Cl	1.325	2,4-dichloro-3-fluorophenyl
Cl	1.326	2,4-dichloro-5-fluorophenyl
Cl	1.327	2,4-dichloro-6-fluorophenyl
Cl	1.328	2,3,4-trichlorophenyl
Cl	1.329	2,3,5-trichlorophenyl
Cl	1.330	2,3,6-trichlorophenyl
Cl	1.331	2,4,5-trichlorophenyl
Cl	1.332	2,4,6-trichlorophenyl
Cl	1.333	2,3,4-trifluorophenyl
Cl	1.334	2,3,5-trifluorophenyl
Cl	1.335	2,3,6-trifluorophenyl

Cl	1.336	2,4,5-trifluorophenyl
Cl	1.337	2,4,6-trifluorophenyl
Cl	1.338	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
Cl	1.339	3-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
Cl	1.34	2-chloropyridin-5-yl
Cl	1.341	3-chloropyridinyl-5-yl
Cl	1.342	2-methylpyridin-5-yl
Cl	1.343	3-methylpyridinyl-5-yl
Cl	1.344	2-trifluoromethylpyridin-5-yl
Cl	1.345	3-trifluoromethylpyridin-5-yl
Cl	1.346	2-chloro-3-methylpyridin-5-yl
Cl	1.347	2-chloro-4-methylpyridin-5-yl
Cl	1.348	6-chloro-2-methylpyridin-3-yl
Cl	1.349	2,3-dichloropyridin-5-yl
Cl	1.35	2,4-dichloropyridin-5-yl
Cl	1.351	2,6-dichloropyridin-3-yl
Cl	1.352	pyrazin-2-yl
Cl	1.353	2-chloropyrazin-5-yl
Cl	1.354	2-bromopyrazin-5-yl
Cl	1.355	pyridazin-3-yl
Cl	1.356	6-bromopyridazin-3-yl
Cl	1.357	6-chloropyridazin-3-yl
Cl	1.358	pyrimidin-5-yl
Cl	1.359	2-bromopyrimidin-5-yl
Cl	1.36	5-bromopyrimidin-2-yl
Cl	1.361	2-chloropyrimidin-5-yl

Cl	١.٣٦٢	5-chloropyrimidin-2-yl
Cl	١.٣٦٣	2-furyl
Cl	١.٣٦٤	3-furyl
Cl	١.٣٦٥	2-thienyl
Cl	١.٣٦٦	3-thienyl
Cl	١.٣٦٧	4-bromothien-2-yl
Cl	١.٣٦٨	5-bromothien-2-yl
Cl	١.٣٦٩	4-chlorothien-2-yl
Cl	١.٣٧٠	5-chlorothien-2-yl
Cl	١.٣٧١	pyrazol-1-yl
Cl	١.٣٧٢	3-chloropyrazol-1-yl
Cl	١.٣٧٣	4-chloropyrazol-1-yl
Cl	١.٣٧٤	1-methylpyrazol-4-yl
Cl	١.٣٧٥	1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-5-yl
Cl	١.٣٧٦	2-thiazolyl
Cl	١.٣٧٧	4-methylthiazol-2-yl
Cl	١.٣٧٨	5-methylthiazol-2-yl

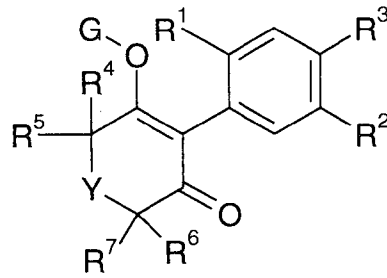
الجدول ٢:

يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي:



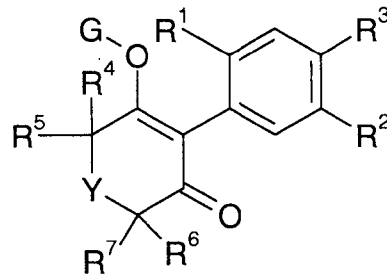
حيث Y هي O ، R' هي ethyl ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



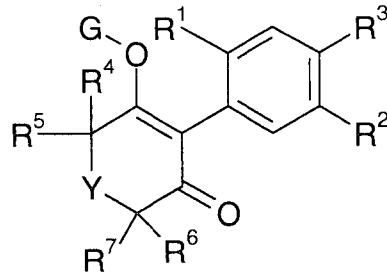
حيث Y هي O ، R¹ هي chlorine ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



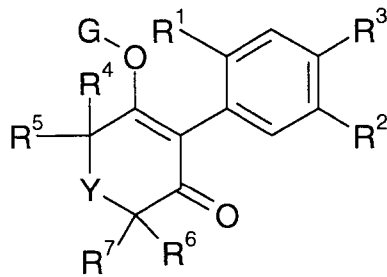
حيث Y هي O ، R¹ هي methyl ، R⁴ هي methyl ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥ : يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



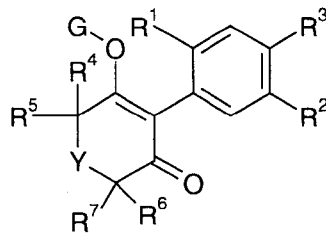
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



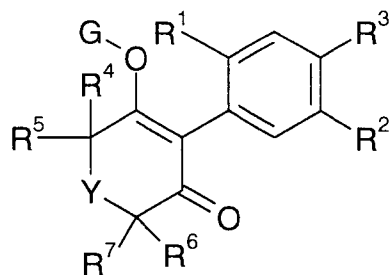
حيث Y هي O، R¹ هي chlorine، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



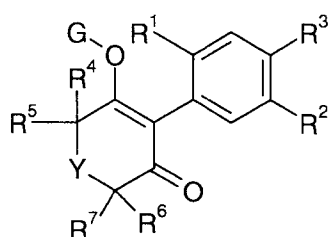
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

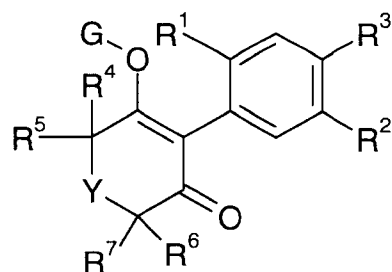
الجدول ٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

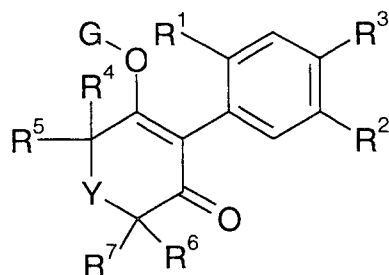
حيث Y هي O، R¹ هي chlorine، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، C
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



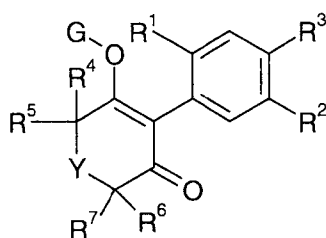
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R^1 هي ethyl، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، G هي
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

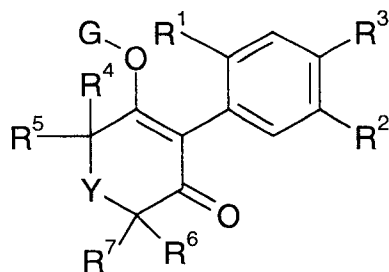
الجدول ١٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي O، R' هي chlorine، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، G هي
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

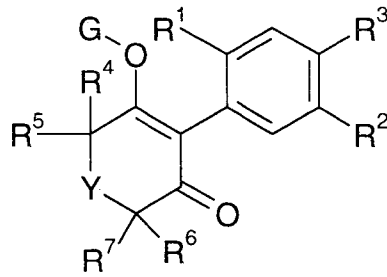


حيث Y هي O، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، G هي

١٠

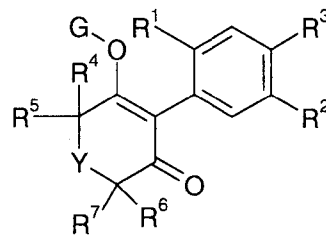
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

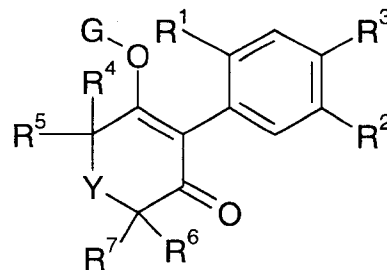
الجدول ١٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

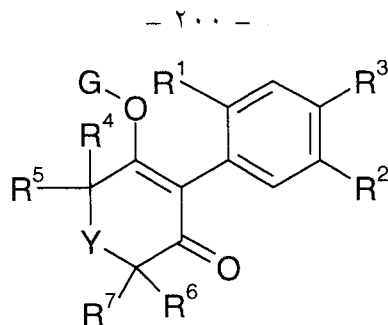
حيث Y هي O، R¹ هي chlorine، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١

الجدول ١٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R' هي methyl، و R⁴، R⁵ و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و
R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

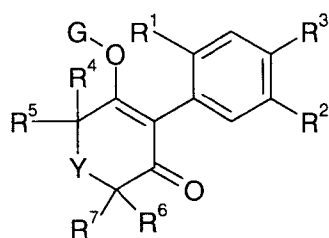
الجدول ١٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و

R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

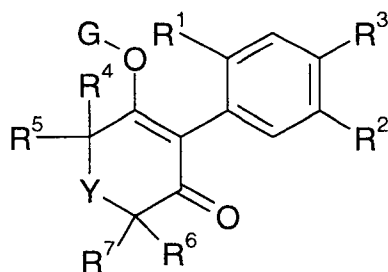


٥

حيث Y هي O، R¹ هي chlorine، و R⁴، R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و

R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

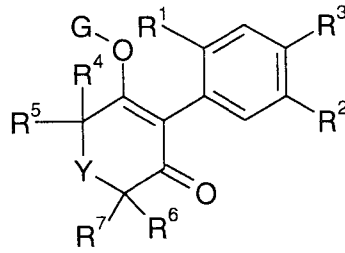


حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي ميثوكسي methyl، G،

١٠

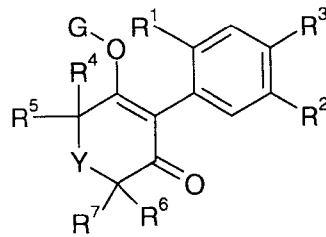
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



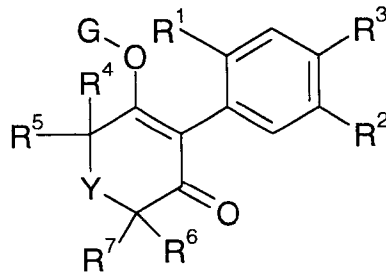
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي ميثوكسي methyl، G،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R' هي chlorine، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي ميثوكسي methyl،
G، هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

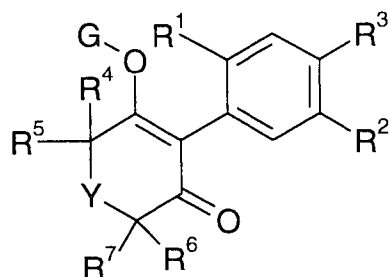
الجدول ٢٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R¹ هي methyl، و R⁴، R⁵ و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، C هي hydrogen
و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

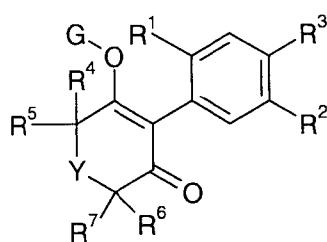
الجدول ٢٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

- ٢٠٢ -



حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، و R^4 ، R^5 ، و R^6 و R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

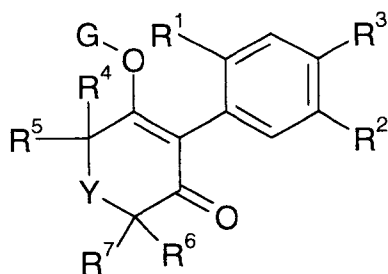
الجدول ٢٤ : يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، و R^4 ، R^5 ، و R^6 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

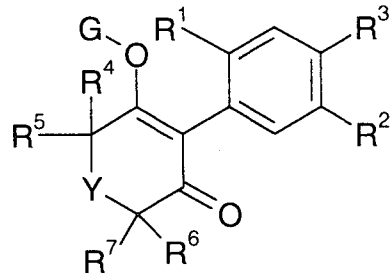
الجدول ٢٥ : يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^4 هي methyl، R^5 ، R^6 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

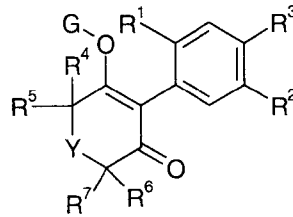
الجدول ٢٦ : يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

- ٢٠٣ -



حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ١.

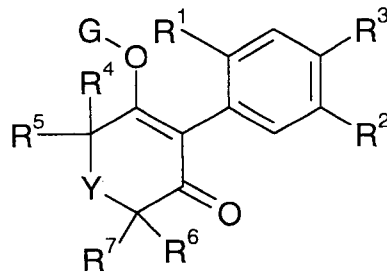
الجدول ٢٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي S، R¹ هي chlorine، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ١.

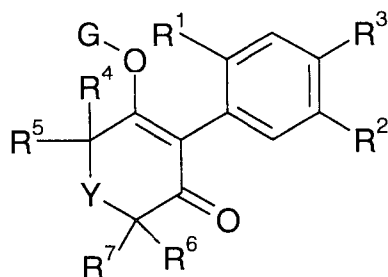
الجدول ٢٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ١.

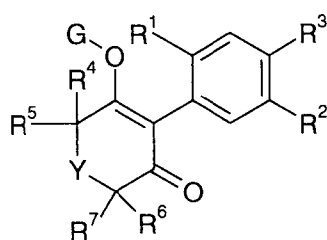
١٠

الجدول ٢٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

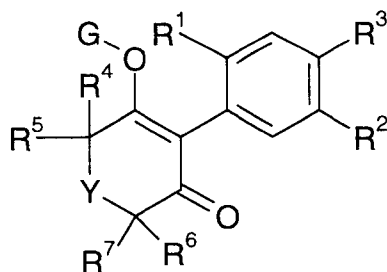
الجدول ٣٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

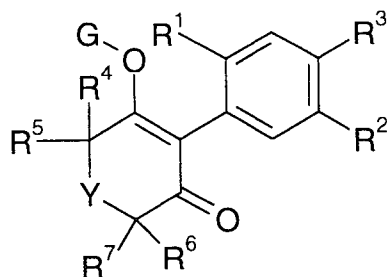
حيث Y هي S، R¹ هي chlorine، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٣١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



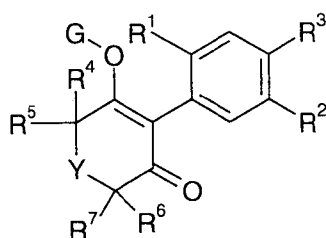
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁶ هي methyl، R⁵ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٣٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

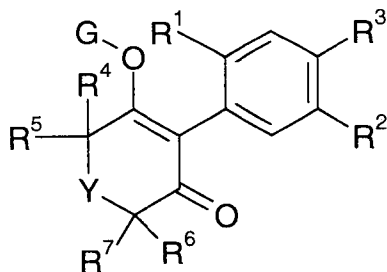
الجدول ٣٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

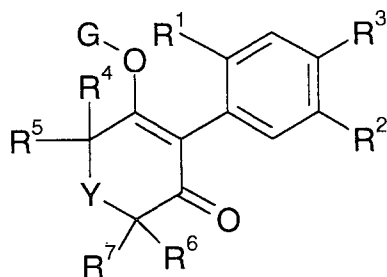
حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٣٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



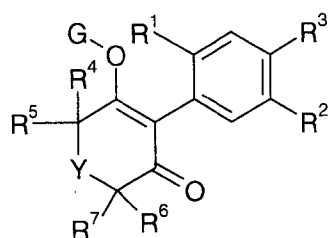
حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٣٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، C هي
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

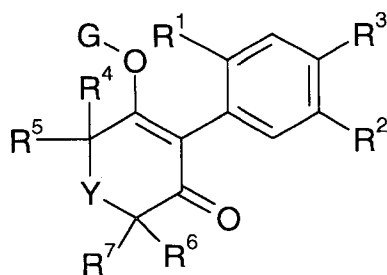
الجدول ٣٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، C هي
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

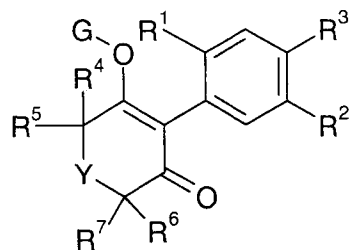
الجدول ٣٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



١٠ حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^4 ، R^5 و R^6 و R^7 هي methyl، C هي hydrogen و
 R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

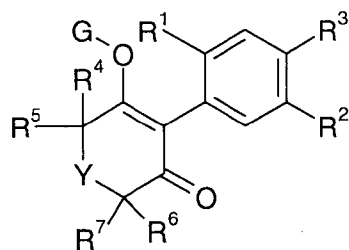
الجدول ٣٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

- ٢٠٧ -



حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

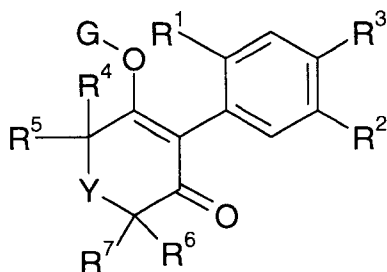
الجدول ٣٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

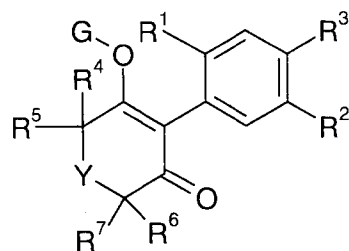
حيث Y هي S، R¹ هي chlorine، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



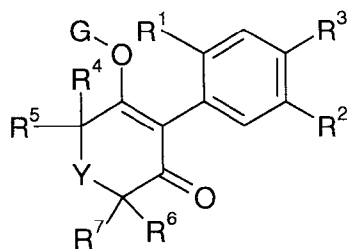
حيث Y هي O = S، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

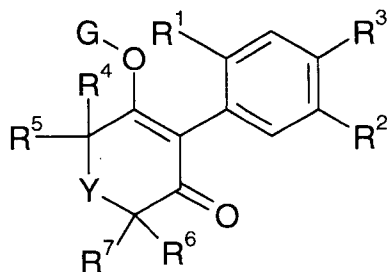
الجدول ٤٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي O = S ، R¹ هي chlorine ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

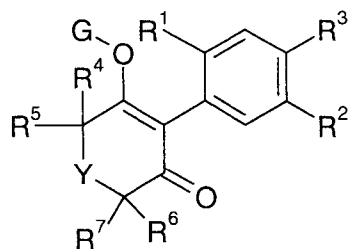
الجدول ٤٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



١٠ حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، ٤B هي methyl ، R⁵ ، ٦B و ٧B هي hydrogen ،

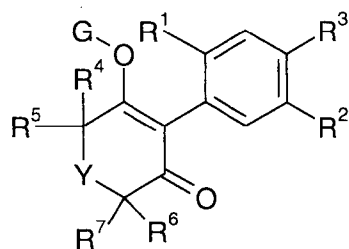
G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S=O، R¹ هي ethyl، R⁴ هي methyl، R⁵، B^o و VB هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

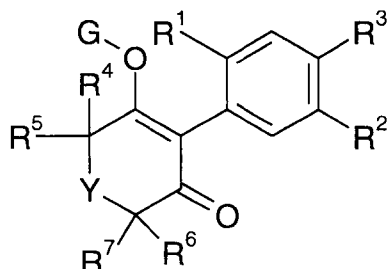
الجدول ٤٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

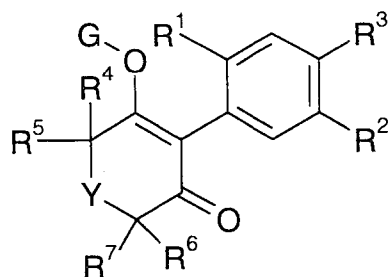
حيث Y هي O = S، R¹ هي chlorine، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



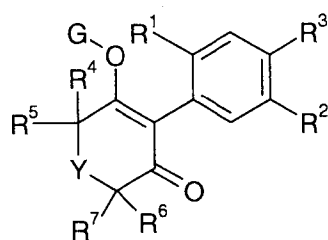
حيث Y هي O = S، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

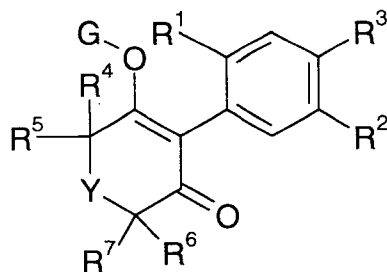
الجدول ٤٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

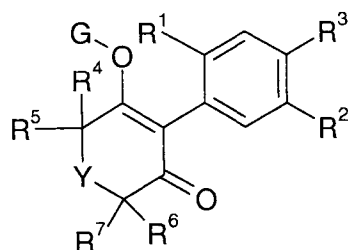
حيث Y هي O = S ، R¹ هي chlorine ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ،
G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٤٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



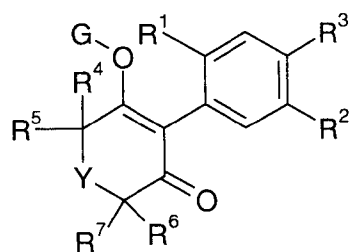
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S ، R' هي ethyl ، R⁴ و R⁸ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

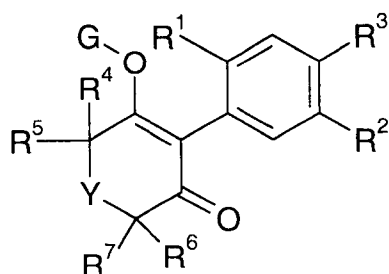
الجدول ٥١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي O = S ، R¹ هي chlorine ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٢ يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

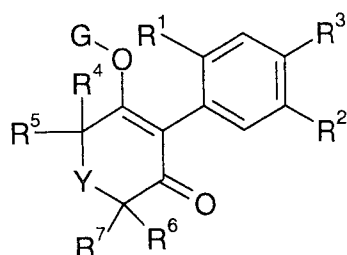


حيث Y هي S = O ، R¹ هي methyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G ،

١٠

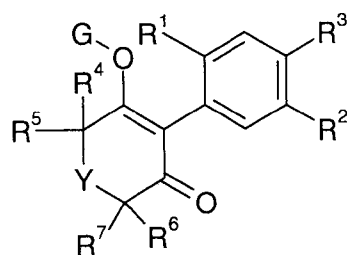
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، C ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

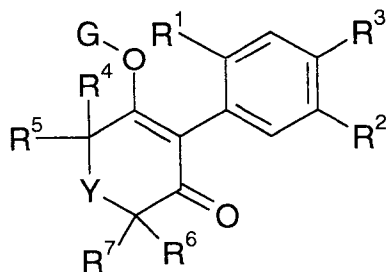
الجدول ٥٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي O = S ، R¹ هي chlorine ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ،
G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

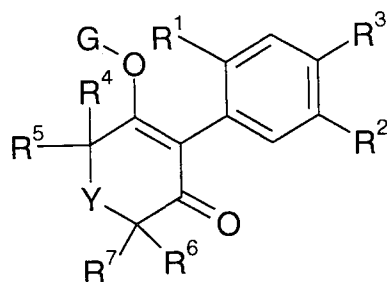


حيث Y هي S=O ، R' هي methyl ، R⁴ ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي methyl ، C هي hydrogen و

١٠

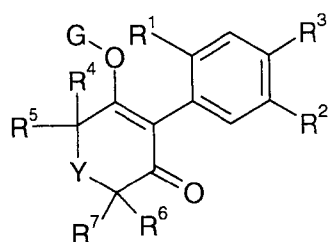
R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



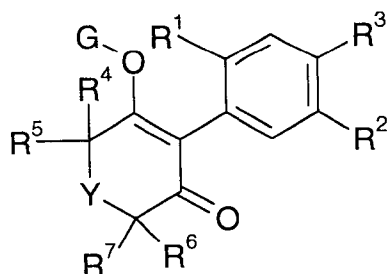
حيث Y هي S ، R¹ هي ethyl ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي methyl ، G هي hydrogen
و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



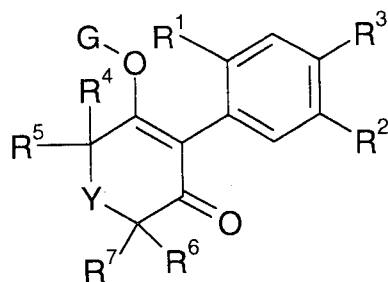
حيث Y هي O = S ، R¹ هي chlorine ، R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي methyl ، G هي hydrogen
و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



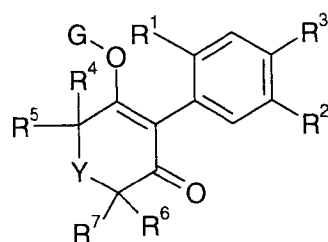
حيث Y هي S(= O)₂ ، R¹ هي methyl ، و R⁴ ، و R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G هي
hydrogen و R² هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٥٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S (O =)²، R¹ هي ethyl ، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C هي
hydrogen و R² و هي على النحو الموضح في الجدول ١.

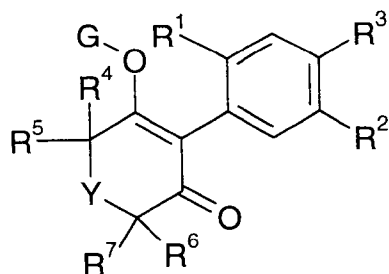
الجدول ٦٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي S(=O)₂، R¹ هي chlorine ، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

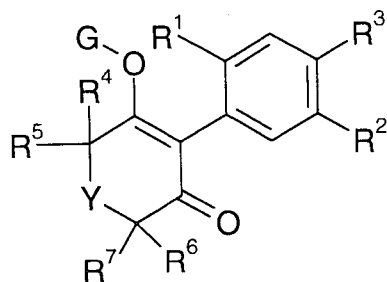


حيث Y هي S(=O)₂، R¹ هي methyl ، R⁴، methyl ، R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C هي

١٠

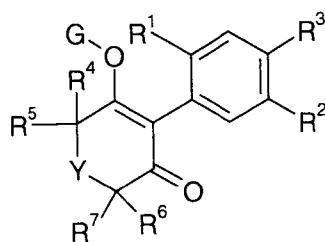
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 هي methyl، R^5 ، R^6 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

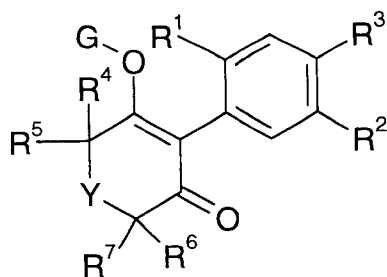
الجدول ٦٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

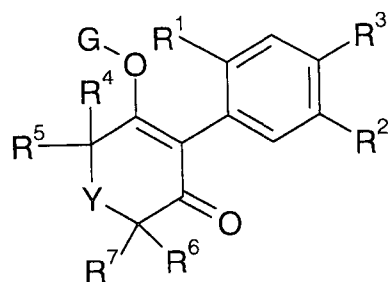
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^4 هي methyl، R^5 ، R^6 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



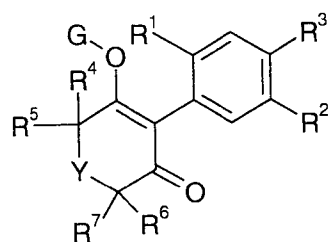
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١،

الجدول ٦٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



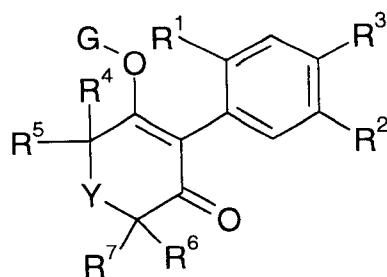
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، C،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



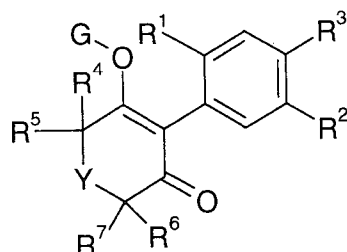
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen،
G، هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



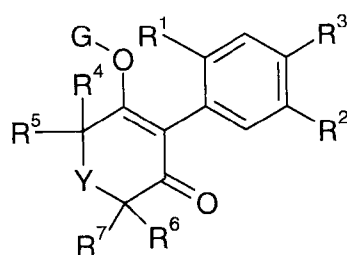
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٦٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

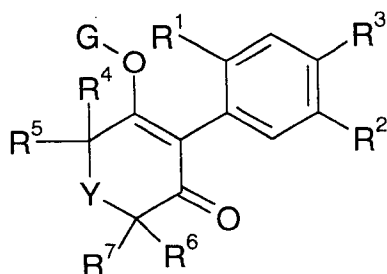
الجدول ٦٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

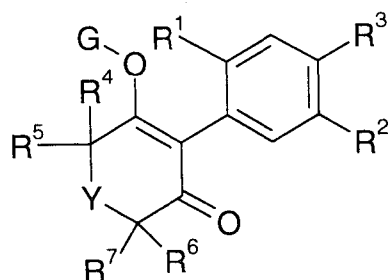
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



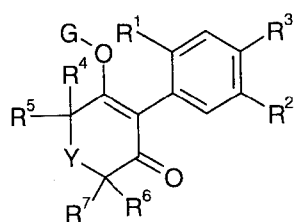
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



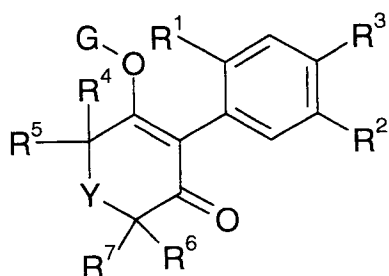
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



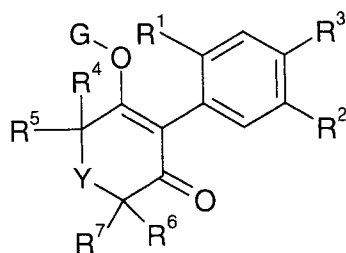
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



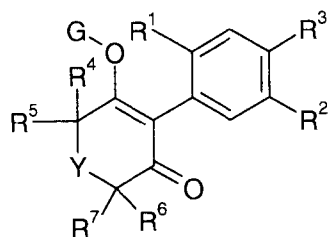
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي G، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث R^1 هي ethyl ، R^2 و R^3 هي hydrogen ، R^4 و R^5 و R^6 و R^7 هي methyl ، G هي $S(=O)_2$ ، N' is $S(=O)_2$ ، حيث R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

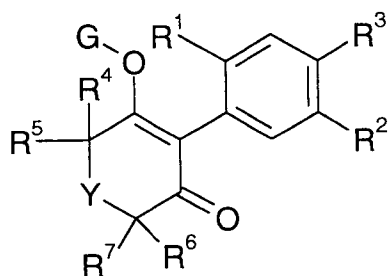
الجدول ٧٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

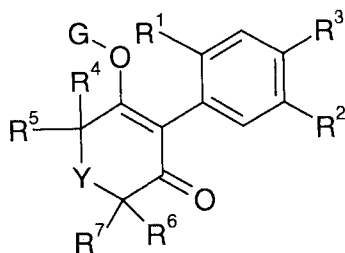
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine ، R^2 و R^3 هي hydrogen ، R^4 و R^5 و R^6 و R^7 هي methyl ، G هي $S(=O)_2$ ، حيث R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



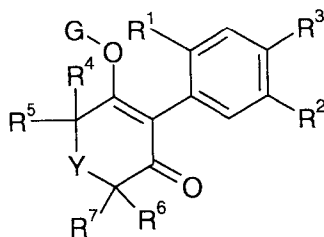
حيث Y هي $O=C$ ، R^1 هي methyl ، R^2 و R^3 هي hydrogen ، R^4 و R^5 و R^6 و R^7 هي methyl ، حيث R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



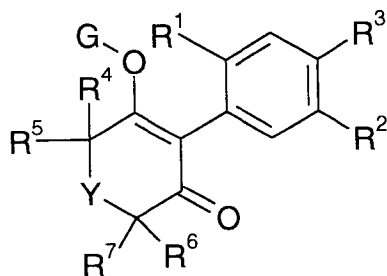
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، G،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



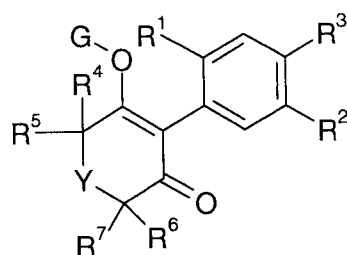
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، G،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٧٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



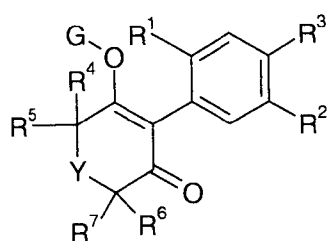
حيث Y هي $C=O$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، C،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٨٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي C=O ، R¹ هي ethyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

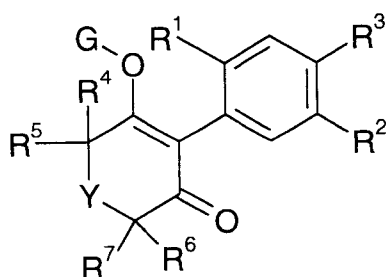
الجدول ٨١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي C=O ، R¹ هي chlorine ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

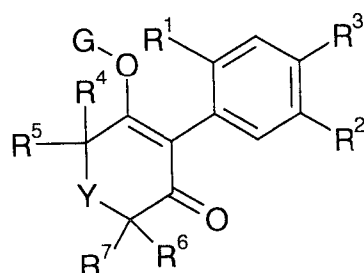
الجدول ٨٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي C=O ، R¹ هي methyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي C ، hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

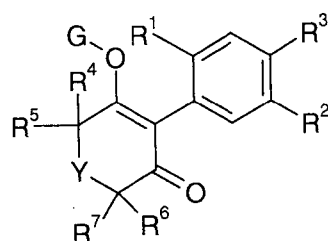
الجدول ٨٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :

- ٢٢٢ -



حيث Y هي C=O، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، C هي hydrogen، و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

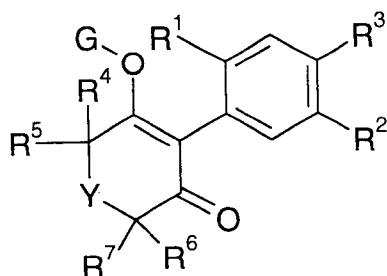
الجدول ٨٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

حيث Y هي O = C، R¹ هي chlorine، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen، و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٨٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



١٠ حيث Y هي O، R¹ هي methyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen، و R² و R³ تكون على النحو المحدد أدناه :

رقم المركب	R ²	R ³
٨٥.٠٠١	phenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٢	2-fluorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٣	3-fluorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٤	4-fluorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٥	2-chlorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٦	3-chlorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٧	4-chlorophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٨	2-bromophenyl	CH ₃
٨٥.٠٠٩	3-bromophenyl	CH ₃
٨٥.٠١٠	4-bromophenyl	CH ₃
٨٥.٠١١	4-tert-butyl	CH ₃
٨٥.٠١٢	2-iodophenyl	CH ₃
٨٥.٠١٣	3-iodophenyl	CH ₃
٨٥.٠١٤	4-iodophenyl	CH ₃
٨٥.٠١٥	2-methylphenyl	CH ₃
٨٥.٠١٦	3-methylphenyl	CH ₃
٨٥.٠١٧	4-methylphenyl	CH ₃
٨٥.٠١٨	2-cyanophenyl	CH ₃
٨٥.٠١٩	3-cyanophenyl	CH ₃
٨٥.٠٢٠	4-cyanophenyl	Ia-Cl
٨٥.٠٢١	2-methoxyphenyl	CH ₃
٨٥.٠٢٢	3-methoxyphenyl	CH
٨٥.٠٢٣	4-methoxyphenyl	CH ₃
٨٥.٠٢٤	2-difluoromethoxyphenyl	CH ₃
٨٥.٠٢٥	3-difluoromethoxyphenyl	CH ₃

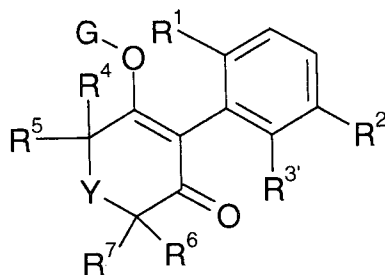
۸۵.۰۲۶	4-difluoromethoxyphenyl	CH ₃
۸۵.۰۲۷	2-difluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۲۸	3-difluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۲۹	4-difluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۰	2-trifluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۱	3-trifluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۲	4-trifluoromethylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۳	2-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۴	3-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۵	4-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۶	4-methylthiophenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۷	4-methylsulfinylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۸	4-methylsulfonylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۳۹	4-trifluoromethylthiophenyl	CH ₃
—۸۵.۰۴۰	4-trifluoromethylsulfinylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۱	4-trifluoromethylsulfonylphenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۲	2,3-difluorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۳	2,4-difluorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۴	2,5-difluorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۵	2,6-difluorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۶	3,4-difluorophenyl	CR ³
۸۵.۰۴۷	3,5-difluorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۸	2,3-dichlorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۴۹	2,4-dichlorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۵۰	2,5-dichlorophenyl	CH ₃
۸۵.۰۵۱	2,6-dichlorophenyl	CH ₃

१०.०५२	3,4-dichlorophenyl	CH ₃
१०.०५३	3,5-dichlorophenyl	CH ₃
१०.०५४	4-chloro-2-cyanophenyl	CH ₃
१०.०५५	4-chloro-3-cyanophenyl	CH ₃
—१०.०५६	4-chloro-2-fluorophenyl	CH ₃
१०.०५७	4-chloro-3-fluorophenyl	CH ₃
१०.०५८	4-chloro-2-methoxyphenyl	CH ₃
१०.०५९	4-chloro-3-methoxyphenyl	CH ₃
१०.०६०	4-chloro-2-methylphenyl	CH ₃
१०.०६१	4-chloro-3-methylphenyl	CH ₃
—१२Q.०१	4-chloro-2-difluoromethoxyphenyl	३I-CF
१०.०६३	4-chloro-3-difluoromethoxyphenyl	CH ₃
१०.०६४	4-chloro-2-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
१०.०६५	4-chloro-3-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
१०.०६६	4-chloro-2-difluoromethylphenyl	CH ₃
१०.०६७	4-chloro-3-difluoromethylphenyl	CH ₃
१०.०६८	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	CH ₃
१०.०६९	4-chloro-3-trifluoromethylphenyl	CH ₃
१०.०७०	4-chloro-2,3-difluorophenyl	CH ₃
१०.०७१	4-chloro-2,5-difluorophenyl	CH ₃
१०.०७२	4-chloro-2,6-difluorophenyl	CH ₃
१०.०७३	2,4-dichloro-3-fluorophenyl	CH ₃
१०.०७४	2,4-dichloro-5-fluorophenyl	CH ₃
१०.०७५	2,4-dichloro-6-fluorophenyl	CH ₃
०.७६.१०	2,3,4-trichlorophenyl	CH ₃
१०.०७७	2,3,5-trichlorophenyl	CH ₃

80.78	2,3,6-trichlorophenyl	CH3
80.79	2,4,5-trichlorophenyl	CH3
80.80	2,4,6-trichlorophenyl	CH3
80.81	2,3,4-trifluorophenyl	CH3
80.82	2,3,5-trifluorophenyl	CH3
80.83	2,3,6-trifluorophenyl	CH3
80.84	2,4,5-trifluorophenyl	CH3
80.85	2,4,6-trifluorophenyl	CtL
80.86	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	CH3
80.87	3-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	CH3
80.88	2-chloropyridin-5-yl	CH3
80.89	3-chloropyridinyl-5-yl	CH3
80.90	2-methylpyridin-5-yl	CH3
80.91	3-methylpyridinyl-5-yl	CH3
80.92	2-trifluoromethylpyridin-5-yl	CH3
80.93	3-trifluoromethylpyridin-5-yl	CH3
80.94	2-chloro-3-methylpyridin-5-yl	CH3
80.95	2-chloro-4-methylpyridin-5-yl	CH3
80.96	6-chloro-2-methylpyridin-3-yl	CH3
80.97	2,3-dichloropyridin-5-yl	CH3
80.98	2,4-dichloropyridin-5-yl	CH3
80.99	2,6-dichloropyridin-3-yl	CH3
80.100	pyrazin-2-yl	CH3
80.101	2-chloropyrazin-5-yl	CH3
80.102	2-bromopyrazin-5-yl	CH3
80.103	pyridazin-3-yl	CH3

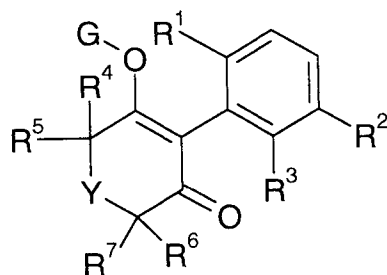
٨٥.١٠٤	6-bromopyridazin-3-yl	CH ₃
٨٥.١٠٥	6-chloropyridazin-3-yl	CH ₃
٨٥.١٠٦	pyrimidin-5-yl	CH ₃
٨٥.١٠٧	2-bromopyrimidin-5-yl	CH ₃
٨٥.١٠٨	5-bromopyrimidin-2-yl	CH ₃
٨٥.١٠٩	2-chloropyrimidin-5-yl	CH ₃
٨٥.١١٠	5-chloropyrimidin-2-yl	CH ₃
٨٥.١١١	2-furyl	CH ₃
٨٥.١١٢	3-furyl	CH ₃
٨٥.١١٣	2-thienyl	CH ₃
٨٥.١١٤	3-thienyl	CH ₃
٨٥.١١٥	4-bromothien-2-yl	CH ₃
٨٥.١١٦	5-bromothien-2-yl	CH ₃
٨٥.١١٧	4-chlorothien-2-yl	CH ₃
٨٥.١١٨	5-chlorothien-2-yl	CH ₃
٨٥.١١٩	pyrazol-1-yl	CH ₃
٨٥.١٢٠	3-chloropyrazol-1-yl	CR ³
٨٥.١٢١	4-chloropyrazol-1-yl	CH ₃
٨٥.١٢٢	1-methylpyrazol-4-yl	CH ₃
٨٥.١٢٣	1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-5-yl	CH ₃
—٨٥.١٢٤	2-thiazolyl	CH ₃
٨٥.١٢٥	4-methylthiazol-2-yl	CH ₃
٨٥.١٢٦	5-methylthiazol-2-yl	CH ₃

الجدول ٨٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



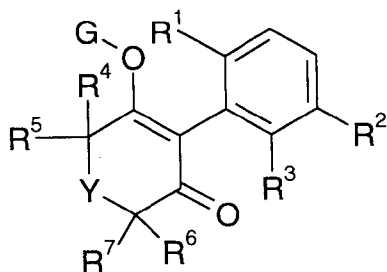
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٨٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



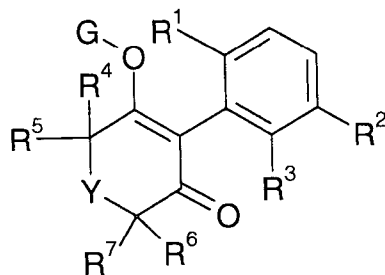
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٨٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



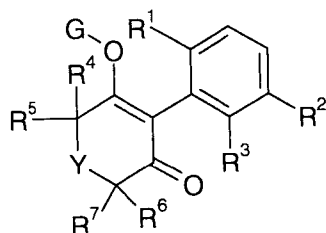
حيث Y هي O، R' هي ethyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٨٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



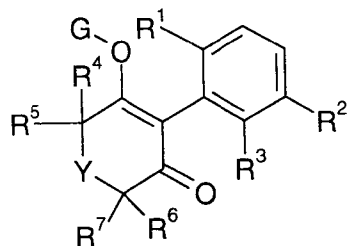
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



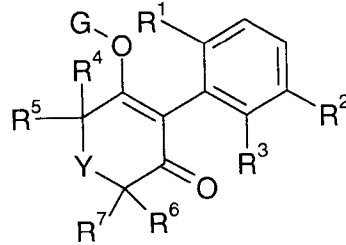
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :، ١



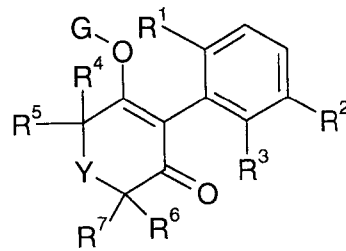
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



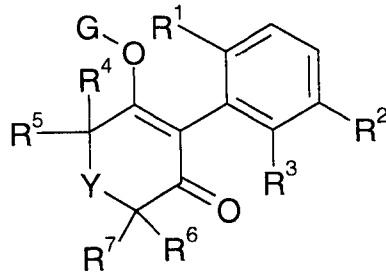
حيث Y هي O ، R' هي ethyl ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



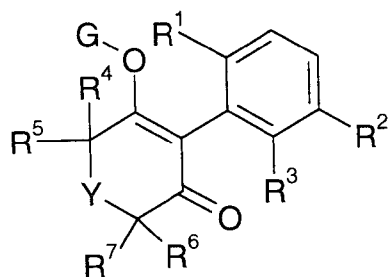
حيث Y هي O ، R¹ هي methyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، O هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



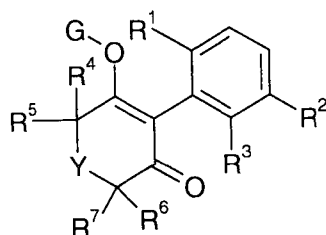
حيث Y هي O ، R¹ هي ethyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



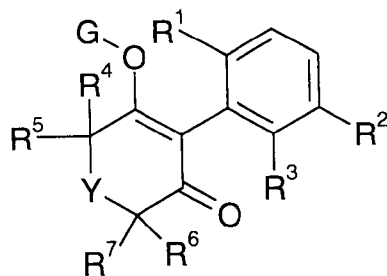
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



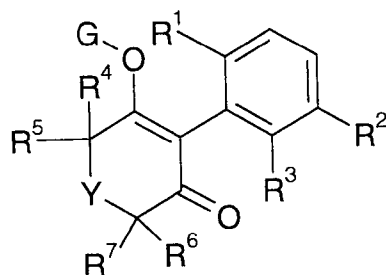
حيث Y هي O، R' هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



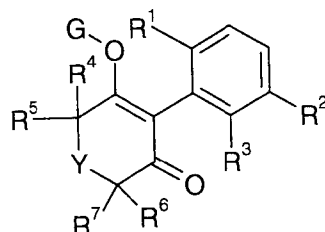
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ هي methyl، R⁷ هي ميثوكسي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



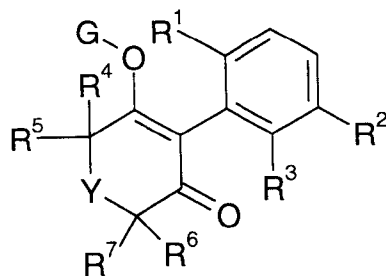
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵، R⁶ هي methyl، R⁷ هي ميثوكسي methyl، G، hydrogen هي R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٩٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



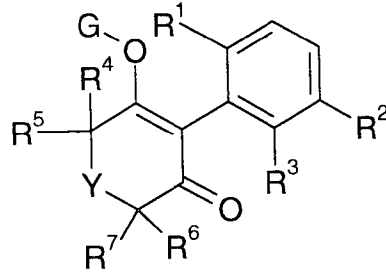
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen، R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



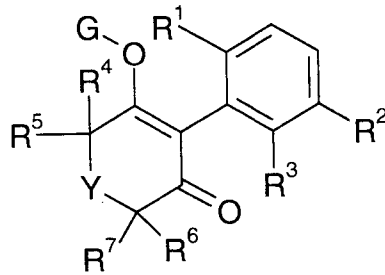
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen، R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي I: .



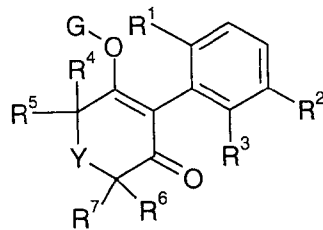
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، ٣ هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي : ٥



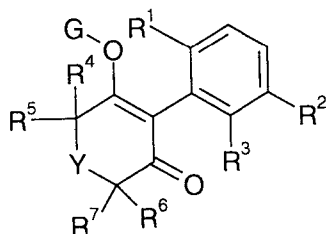
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁴ هي methyl، R⁵، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



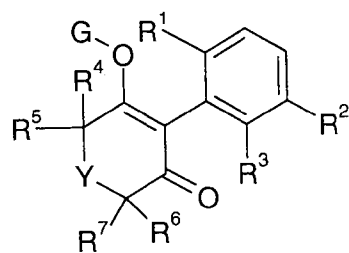
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴ و R⁵ هي methyl، R⁶ و R⁷ هي hydrogen، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



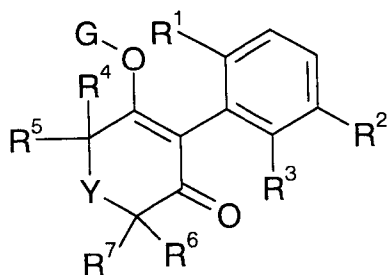
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



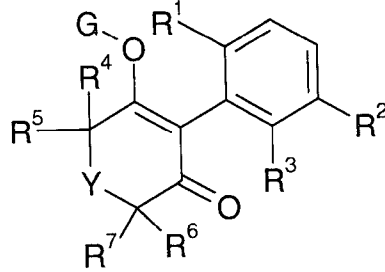
حيث Y هي S، R¹ هي methyl ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



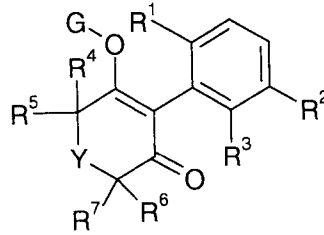
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



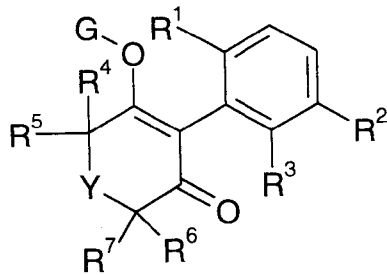
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



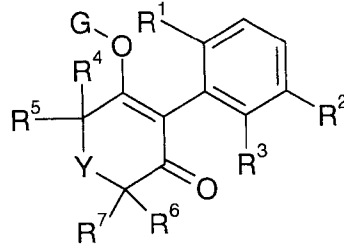
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٠٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



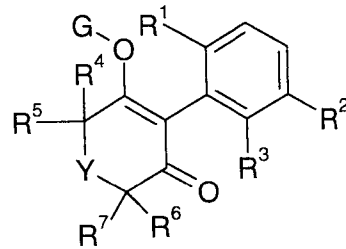
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵ و R⁶، R⁷ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي



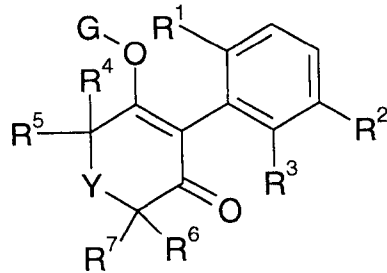
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، O هي hydrogen و R² و R³ على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١١١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



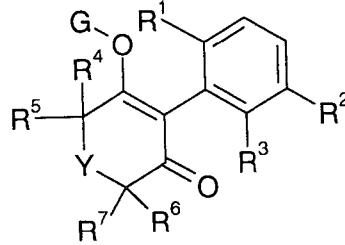
حيث Y هي O = S، R¹ هي methyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي : ...



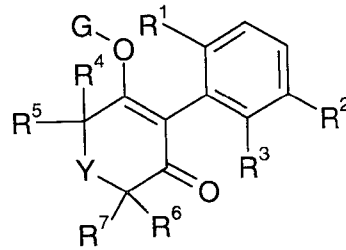
حيث Y هي O = S، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



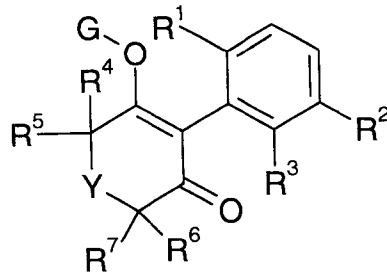
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁴ هي methyl ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

٥ الجدول ١١٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁴ هي methyl ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

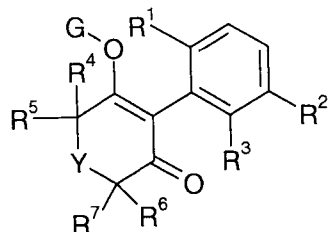
الجدول ١١٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



١٠

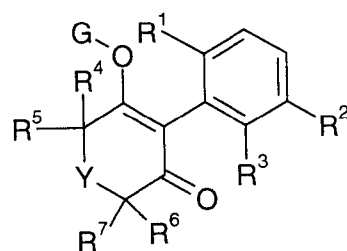
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، C ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



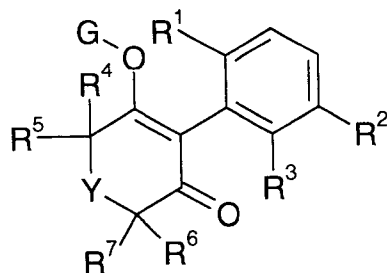
حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁴ و R⁵ هي methyl ، R⁶ و R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



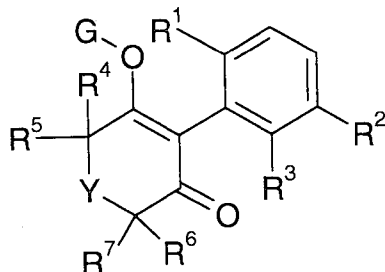
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



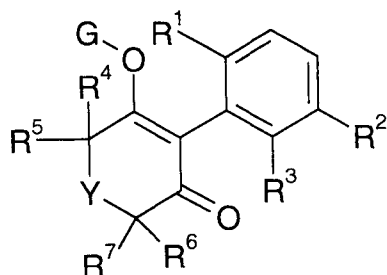
حيث Y هي O = S ، R' هي ethyl ، R⁴ و R⁶ هي methyl ، R⁵ و R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١١٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S=O، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، C، hydrogen هي R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :

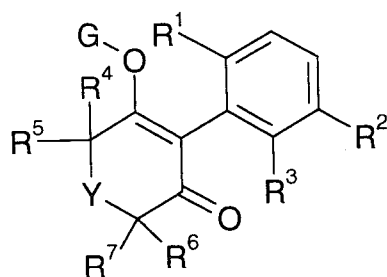


حيث Y هي S=O، R' هي ethyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، C، hydrogen هي R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :

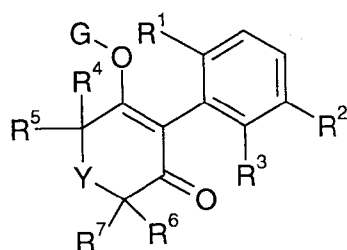
حيث Y هي S=O، R¹ هي methyl، R⁴، R⁵ و R⁶ هي methyl، R⁷ هي hydrogen، C، hydrogen هي R³ و R² هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S=O، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

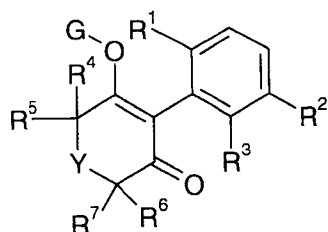
الجدول ١٢٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



٥

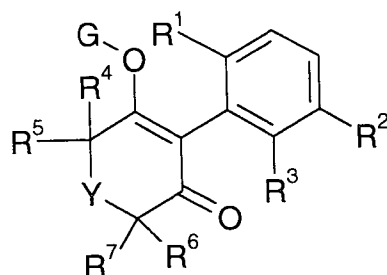
حيث Y هي S(=O)₂، R¹ هي methyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



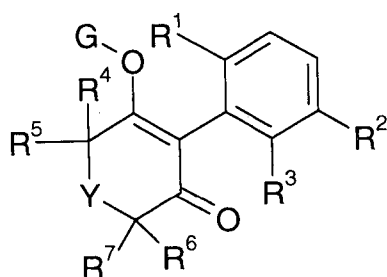
حيث Y هي S(=O)₂، R¹ هي ethyl، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 هي methyl، R^5 ، R^6 و R^7 هي hydrogen، G،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

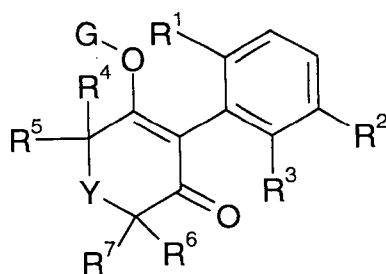
الجدول ١٢٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



٥

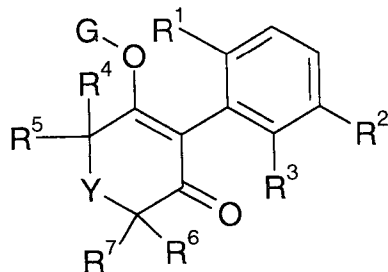
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 هي methyl، R^5 ، R^6 و R^7 هي hydrogen، G،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



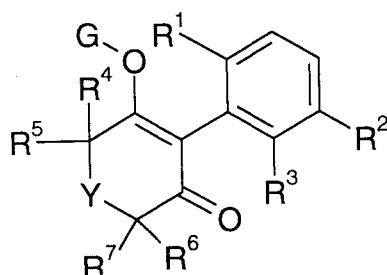
١٠ حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٢٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



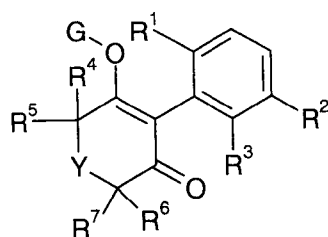
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

٥ الجدول ١٢٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



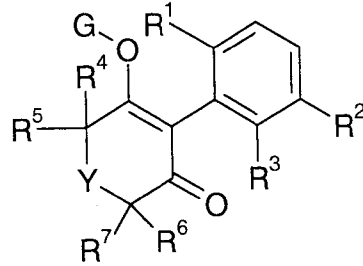
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^6 هي methyl، R^5 و R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :

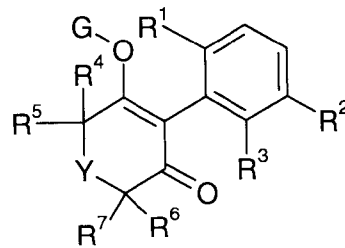


حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، R^7 هي hydrogen،
G هي hydrogen و $2F1$ و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :

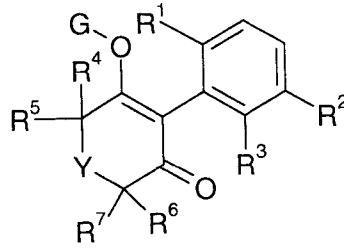
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^4 ، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



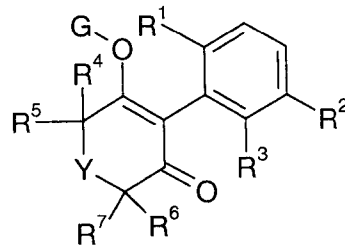
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، و R^4 ، R^5 و R^6 و R^7 هي methyl، G هي
hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



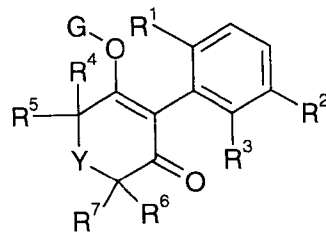
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، و R^4 ، R^5 ، و R^6 و R^7 هي methyl، O هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



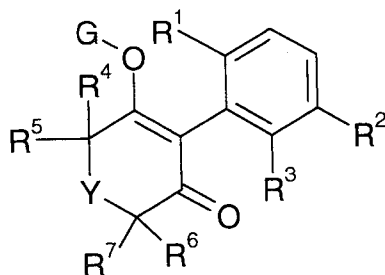
حيث Y هي $O=C$ ، R^1 هي methyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و R^7 هي hydrogen، O هي hydrogen و JR^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



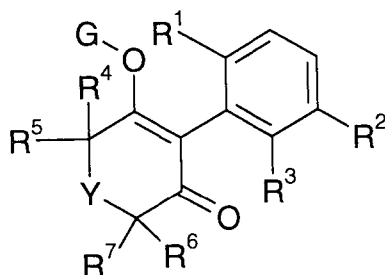
حيث Y هي $O=C$ ، R^1 هي ethyl، R^4 و R^5 هي methyl، R^6 و JR^7 هي hydrogen، G هي hydrogen و JR^2 و JR^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O = C ، R¹ هي methyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

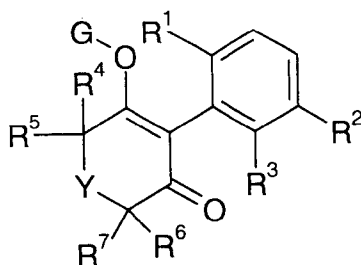
الجدول ١٣٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



٥

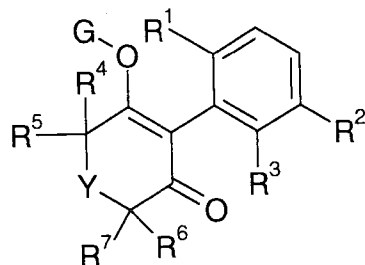
حيث Y هي Q = C ، R¹ هي ethyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي hydrogen ، G ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٣٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



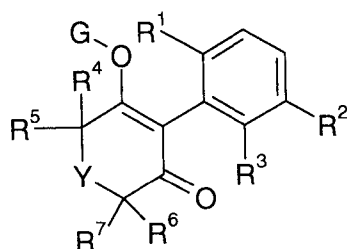
١٠ حيث Y هي Q = C ، R¹ هي methyl ، R⁴ ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، R⁷ هي C ،
هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



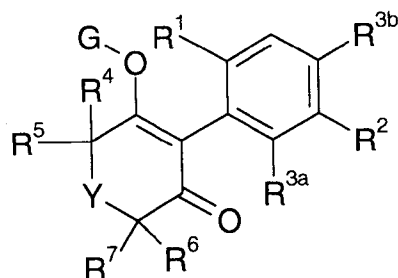
حيث Y هي O = C ، R¹ هي ethyl ، R⁴ ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي methyl ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



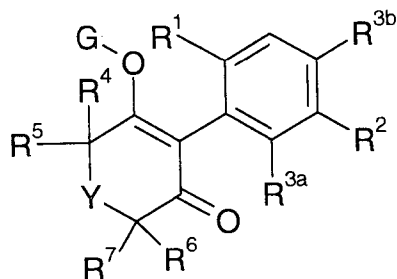
حيث Y هي O و R¹ و R هي methyl ، و R⁴ ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



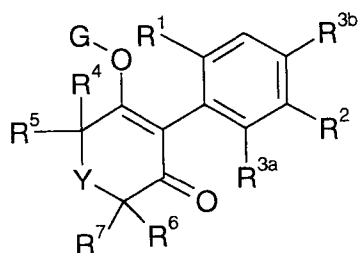
حيث Y هي S و R¹ و R هي methyl ، و R⁴ ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



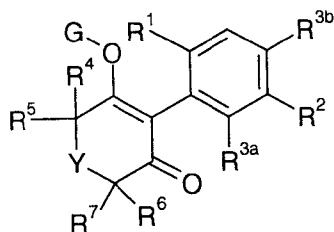
حيث Y هي S=O و R و R' هي methyl ، R⁴ ، R⁵ ، R⁶ و R⁷ هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

٥ الجدول ١٤٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



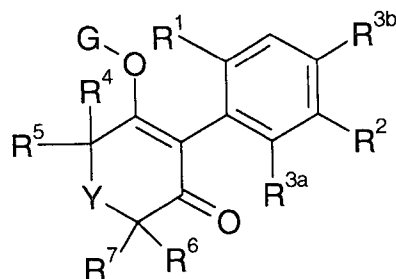
حيث Y هي S(=O)₂ و R¹ و R هي methyl ، و R⁴ ، R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



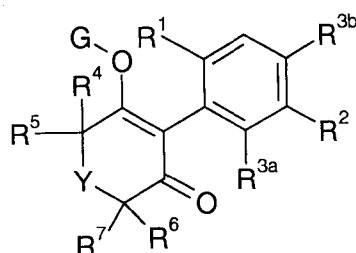
حيث Y هي C=O و R¹ و R هي methyl ، و R⁴ ، R⁵ ، و R⁶ و R⁷ هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



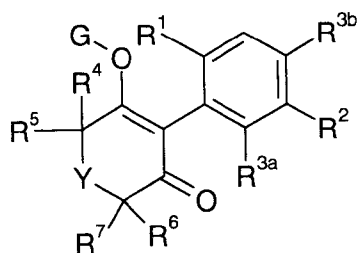
حيث Y هي O و R¹ هي ethyl و R^{3a} هي methyl ، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl ،
R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



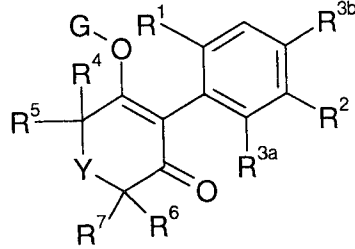
حيث Y هي S و R¹ هي ethyl و R هي methyl ، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl ،
R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٤٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي S=O و R¹ هي ethyl و R^{3a} هي methyl ، و R⁴، و R⁵، و R⁶ و R⁷ هي methyl ،
Rsb هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

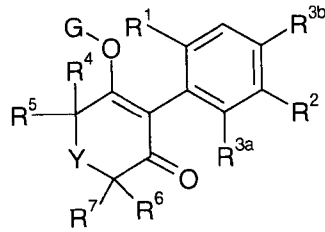
الجدول ١٤٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $S(=O)_2$ و R^1 هي ethyl و R هي methyl ، و R^4 ، و R^5 ، و R^6 و R^7 هي methyl ، methyl ، methyl هي Rab ، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول

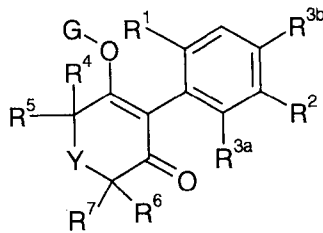
٨٥ ٥

الجدول ١٥٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $C=O$ و R^1 هي ethyl و R هي methyl ، و R^4 ، و R^5 ، و R^8 و R^7 هي methyl ، R^{3a} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

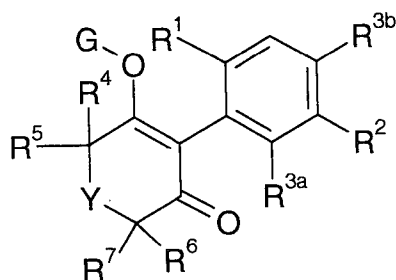
الجدول ١٥١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O و R و R^{3a} هي ethyl ، و R^4 ، و R^5 ، و R^6 و R^7 هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٥٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي : R^{3b} حيث Y هي S و R^1 و R هي ethyl ، و R^4 ، و R^5 ، و R^6 و R^7 هي methyl ، R^3D هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

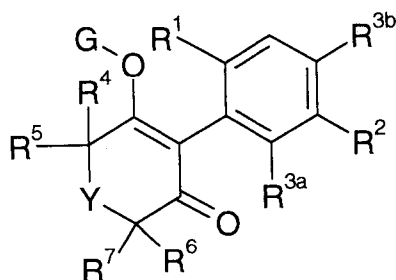
الجدول ١٥٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



٥

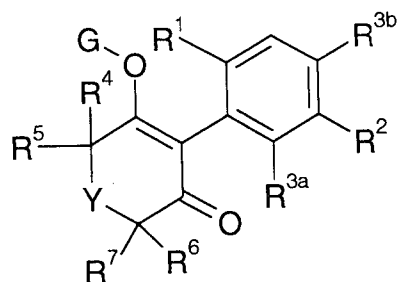
حيث Y هي $S=O$ و JR^1 و R هي ethyl ، R^4 ، R^5 ، R^6 و R^7 هي methyl ، R هي methyl ، و C هي hydrogen و JR^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٥٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي : $K - ٠٣' - b - I'$



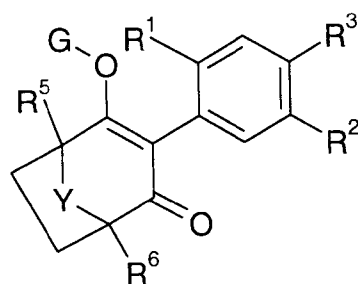
١٠ حيث Y هي $S(=O)_2$ و R^1 و R^{3a} هي ethyl ، و R^4 ، و R^5 ، و R^6 و R^7 هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٥٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



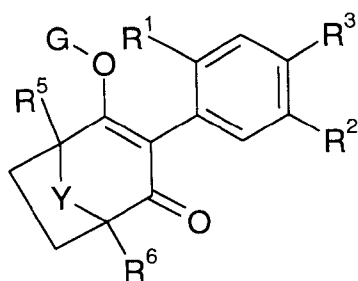
حيث Y هي C=O و R^1 و R^{3a} هي ethyl ، R^4 ، R^5 ، R^6 و R^7 هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٥٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



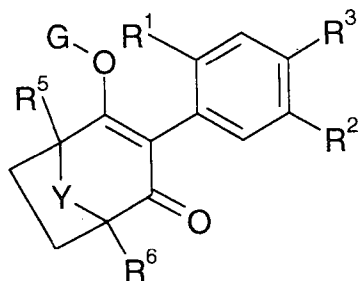
حيث Y هي O ، R^1 هي methyl ، R^5 و R^6 هي hydrogen ، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٥٧ يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



١٠ حيث Y هي O ، R^1 هي ethyl ، R^5 و R^6 هي hydrogen ، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

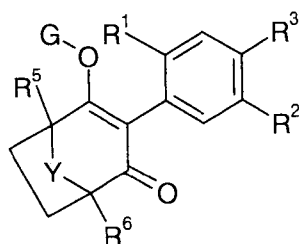
الجدول ١٥٨ يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و

R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

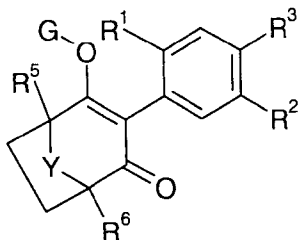
الجدول ١٥٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و

R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

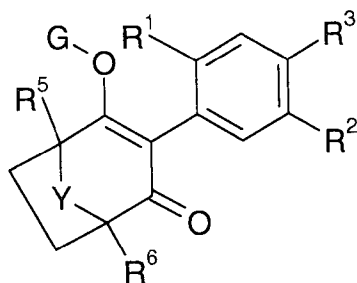
الجدول ١٦٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي ethyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و

R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

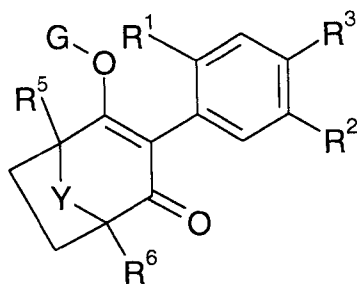
الجدول ١٦١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R^1 هي chlorine ، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl ، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

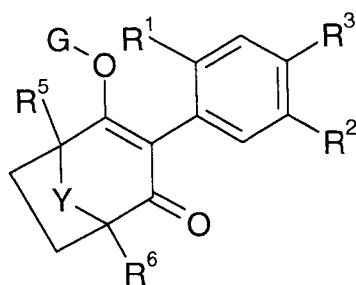
الجدول ١٦٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ من النوع التالي :حيث Y هي O ، R^1 هي methyl ، R^5 و R^6 هي methyl ، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



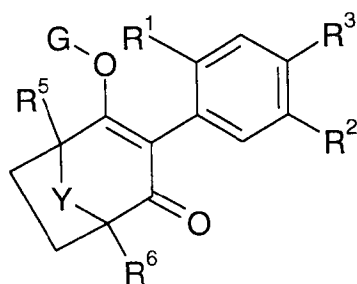
حيث Y هي O ، R^1 هي ethyl ، R^5 و R^8 هي methyl ، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

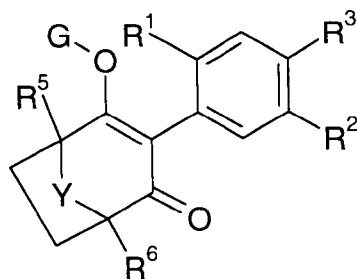
الجدول ١٦٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



٥

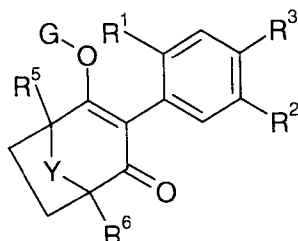
حيث Y هي O، R^1 هي methyl، R^6 هي hydrogen و R^6 هي ميثوكسي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



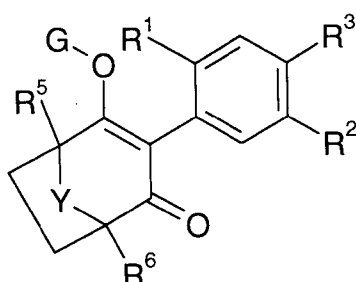
١٠ حيث Y هي O، R^1 هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي ميثوكسي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



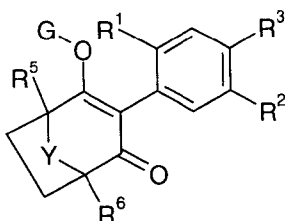
حيث Y هي O، R¹ هي chlorine، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي ميثوكسي methyl، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



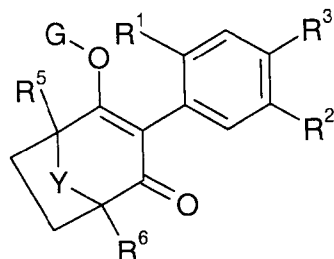
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي إيثوكسي methyl، G هي
hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٦٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



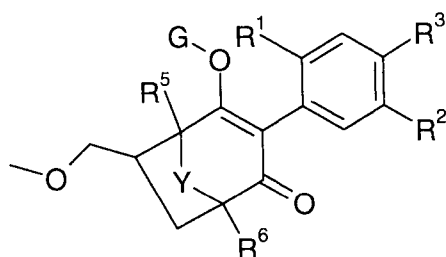
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي إيثوكسي methyl، G هي
hydrogen و R² هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٧٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



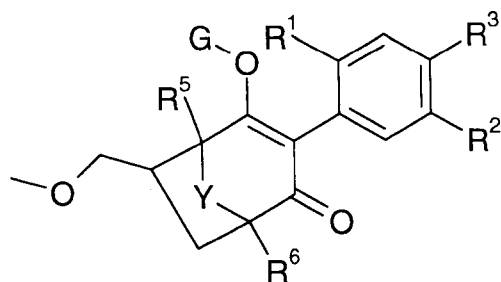
حيث Y هي O، R^1 هي chlorine، R^5 هي hydrogen، و R^6 هي إيثوكسي methyl، G،
هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٧١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



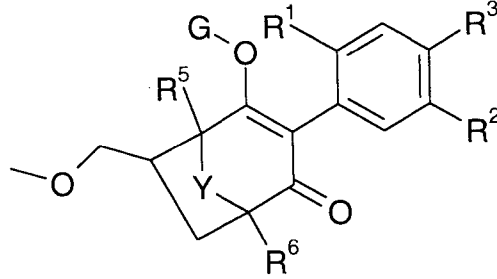
حيث Y هي O، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3
هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٧٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



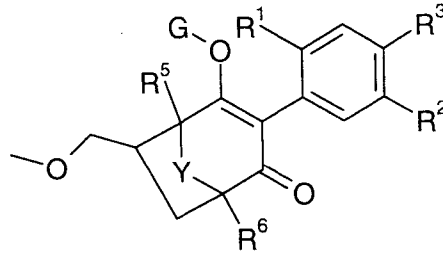
حيث Y هي O، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3
على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ١٧٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



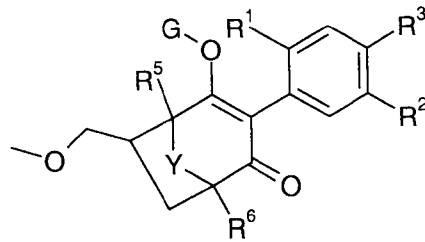
حيث Y هي O ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ١٧٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



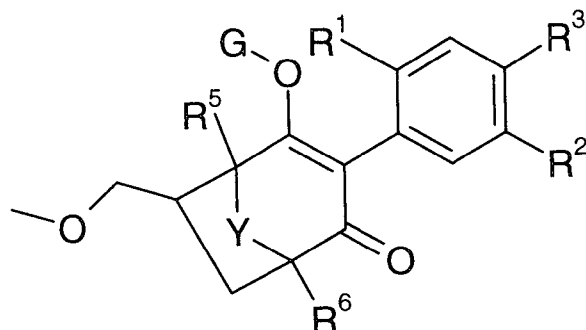
حيث Y هي O ، R¹ هي methyl ، R⁵ هي methyl ، R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٧٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي ethyl ، R⁵ هي methyl ، R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ على النحو المحدد في الجدول ١.

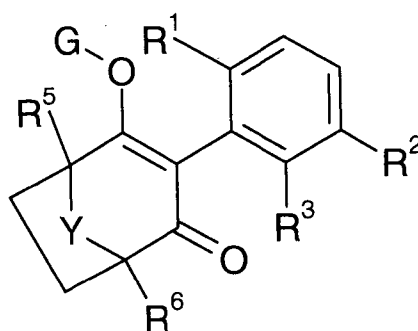
الجدول ١٧٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي chlorine ، R⁵ هي methyl ، R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen
و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٧٧: ٥

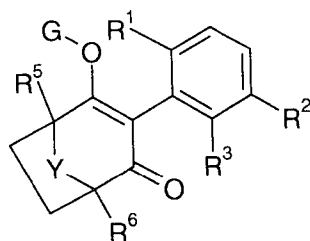
يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen ، R² و R³ هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

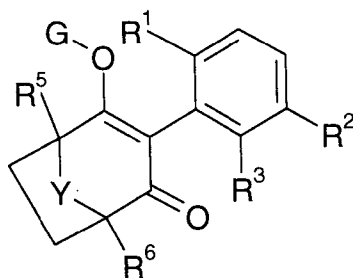
١٠

الجدول ١٧٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



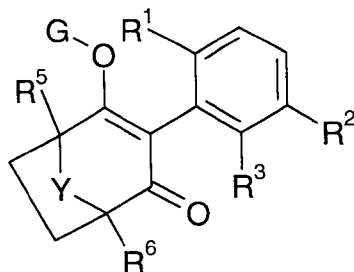
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي hydrogen، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٧٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



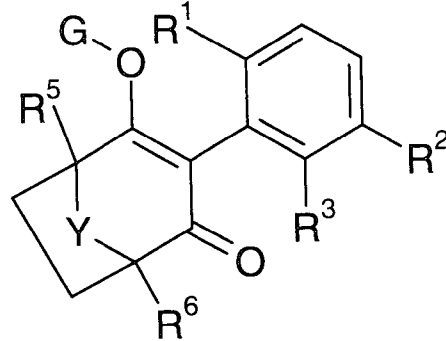
حيث Y هي O، R¹ هي methyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



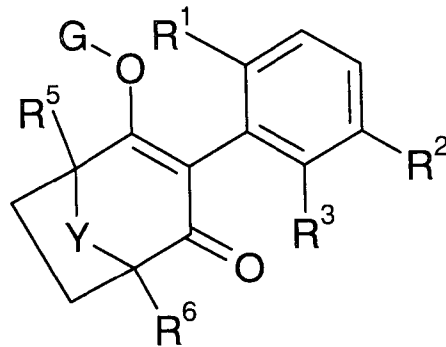
١٠ حيث Y هي O، R¹ هي ethyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



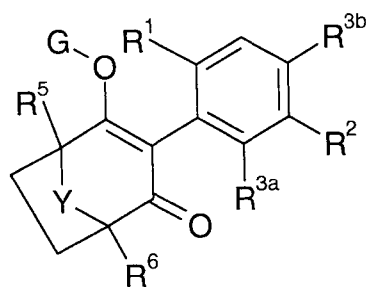
حيث Y هي O، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



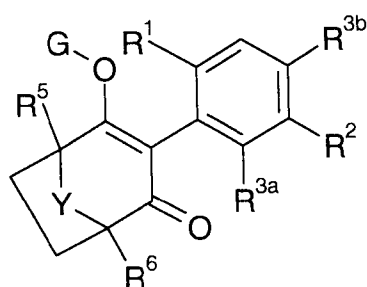
حيث Y هي O، R^1 هي ethyl، R^5 و R^8 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R^1 و R^{3a} هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، Rab هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

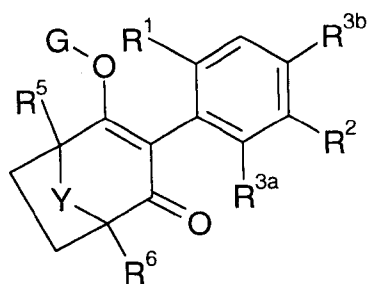
الجدول ١٨٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



٥

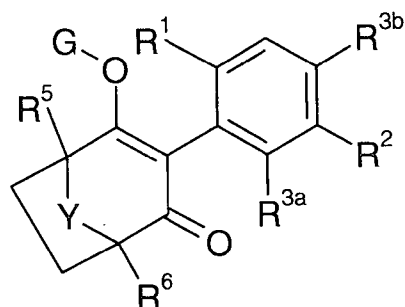
حيث Y هي O، R^1 هي ethyl و R^{3a} هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



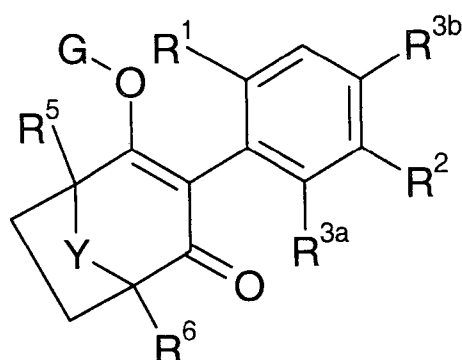
١٠ حيث Y هي O، R^1 و R هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R' هي methyl، و C هي hydrogen و R2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R¹ و R هي methyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، R³ᵇ هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

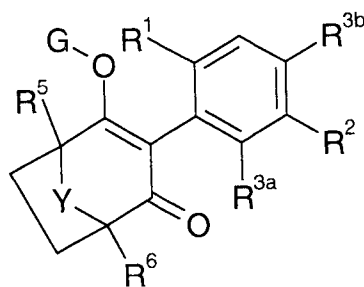
الجدول ١٨٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي O، R¹ هي ethyl و R هي methyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، R هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

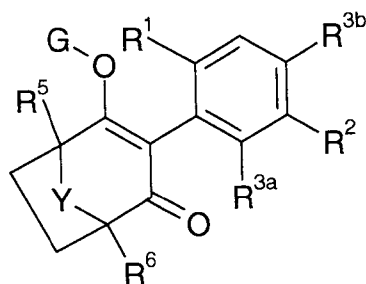
الجدول ١٨٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :

- ٢٦٣ -



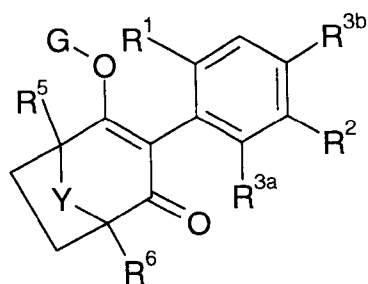
حيث Y هي O، R¹ و R^{3a} هي ethyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٨٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



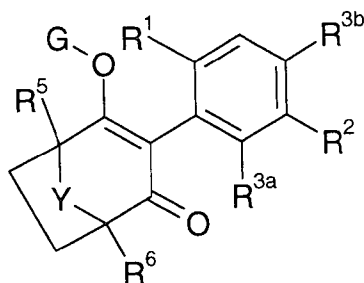
حيث Y هي O، R¹ و R^{3a} هي methyl، R⁵ و R⁶ هما methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٩٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



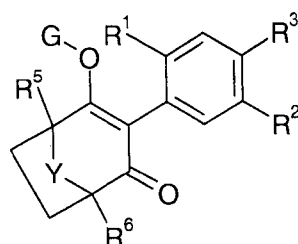
حيث Y هي O، R¹ هي ethyl و R^{3a} هي methyl، و R⁵ و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٩١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



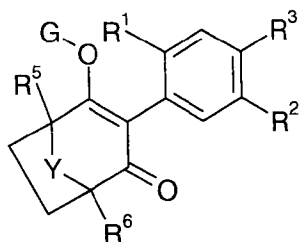
حيث Y هي O، R^1 و R^{3a} هي ethyl، R^5 و R^6 methyl، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ١٩٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



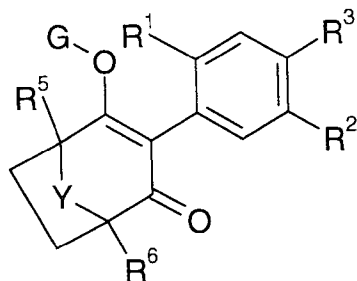
حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



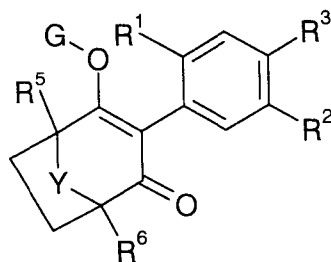
حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



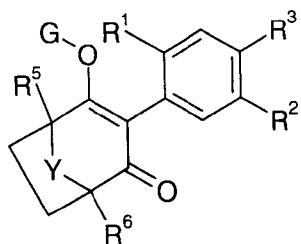
حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



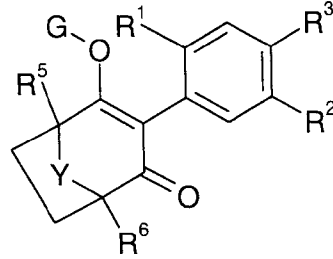
حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



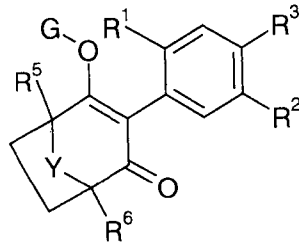
حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 تكون على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ١٩٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



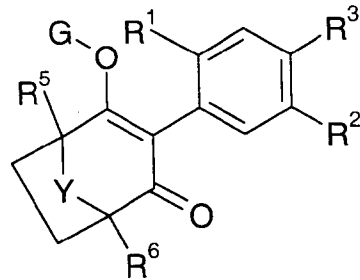
حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، R^5 هي hydrogen، R^6 هي methyl، C هي hydrogen
و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



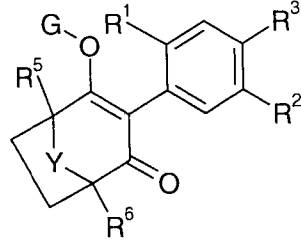
حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen، R^2 و R^3 هي
على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ١٩٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



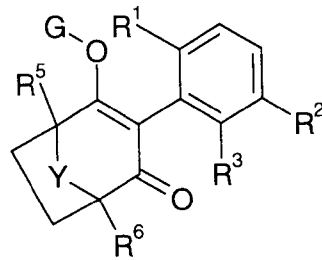
حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen، R^2 و R^3 هي
النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٠٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



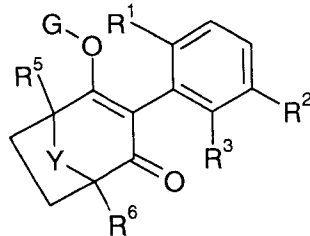
حيث Y هي S، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٠١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



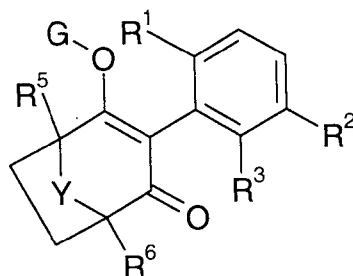
حيث Y هي S، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



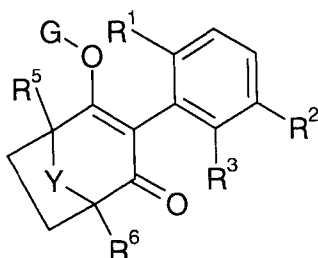
حيث Y هي S، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



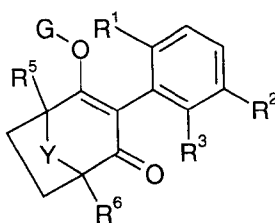
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁵ هي hydrogen، R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



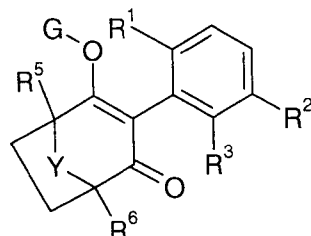
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁵ هي hydrogen، R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



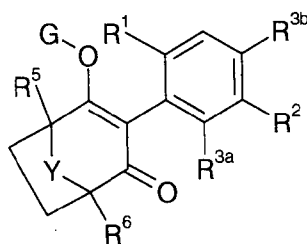
حيث Y هي S، R¹ هي methyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي : %٤ n



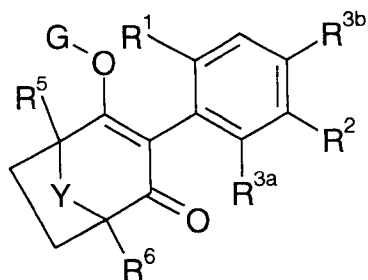
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



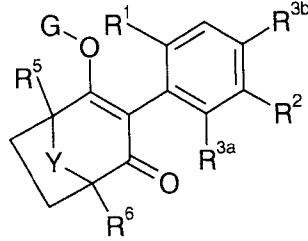
حيث Y هي S، R¹ و R هي methyl، R⁵ و R⁶ هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



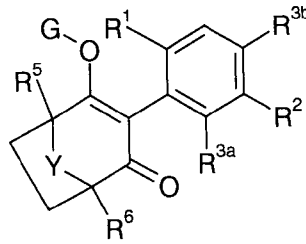
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl و R هي methyl، R⁵ و R⁸ هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٠٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



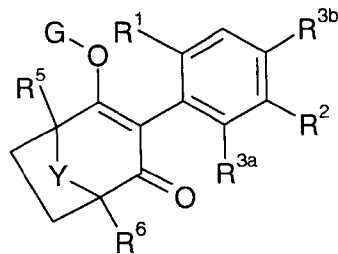
حيث Y هي S، R¹ و R هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، R³ᵇ هي methyl ، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



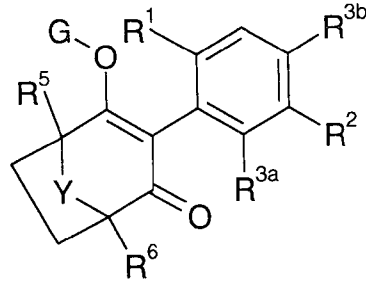
حيث Y هي S، R¹ و R هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، Rab هي methyl و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



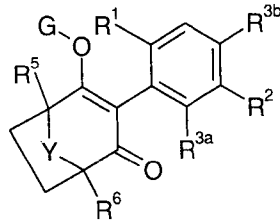
حيث Y هي S، R¹ هي ethyl و R هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، Rab هي methyl و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



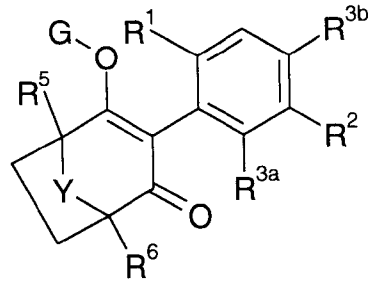
حيث Y هي S، R' و R هي ethyl، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



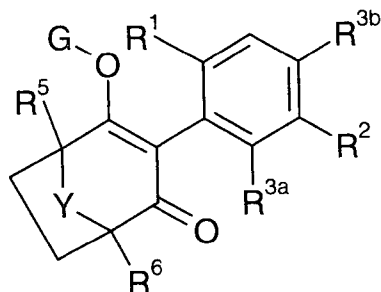
حيث Y هي S، R¹ و R^{3a} هي methyl، و R⁵ و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي:



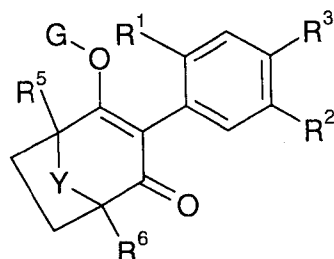
حيث Y هي S، R' هي ethyl و R³ هي methyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، Rab هي methyl، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



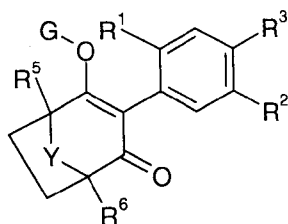
حيث Y هي S، R¹ و R هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، R³ᵇ هي methyl، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢١٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



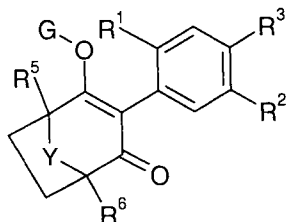
حيث Y هي S=O، R¹ هي methyl، R⁵ و R⁶ هي hydrogen، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢١٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



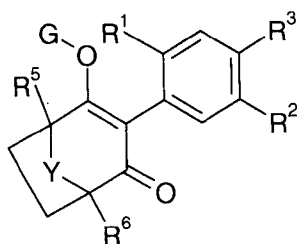
حيث Y هي O=S، R¹ هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي hydrogen، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢١٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



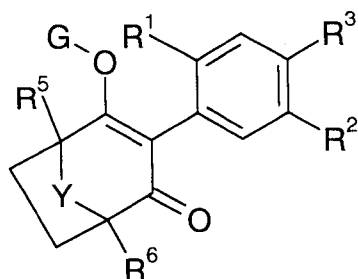
حيث Y هي S = O ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢١٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



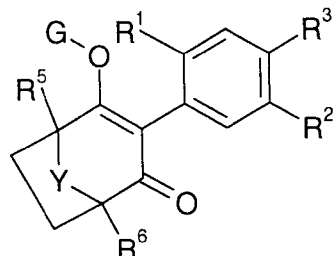
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



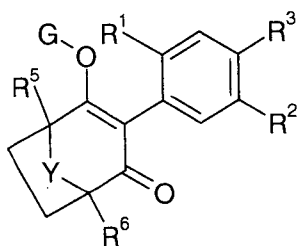
حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، G هي methyl و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ من النوع التالي :



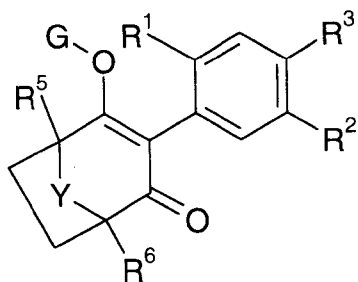
حيث Y هي S=O، R¹ هي chlorine، R⁵ هي hydrogen، و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



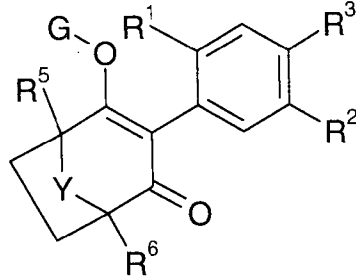
حيث Y هي O = S، R¹ هي methyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ من النوع التالي :



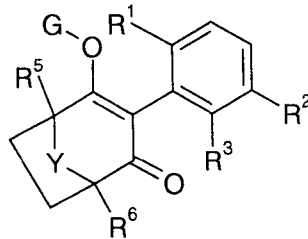
حيث Y هي O = S، R¹ هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



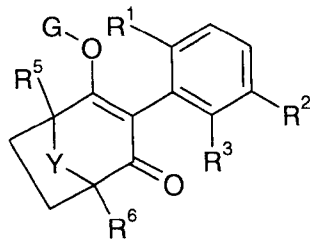
حيث Y هي S = O ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٢٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



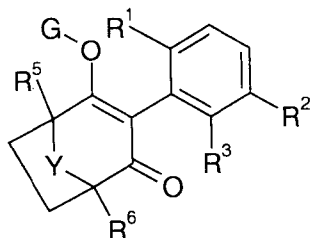
حيث Y هي S ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٢٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



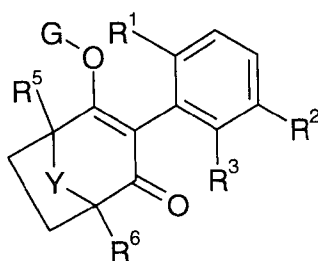
حيث Y هي S=O ، R¹ هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٢٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



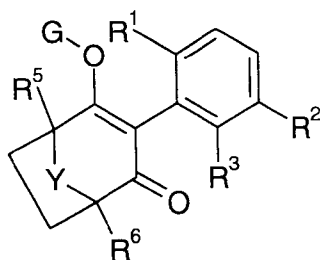
حيث Y هي O = S ، R' هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و R² على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٢٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



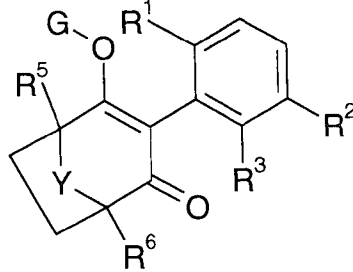
حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و R² و R³ على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٢٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



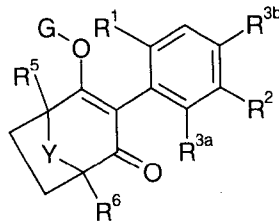
حيث Y هي O = S ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



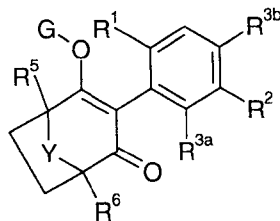
حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



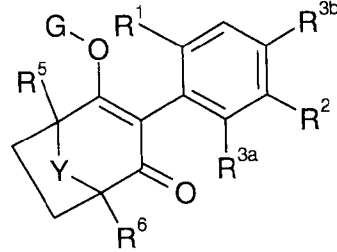
حيث Y هي O = S ، R¹ و R هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، Rab هي methyl ، و R² هي hydrogen و R^{3a} هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



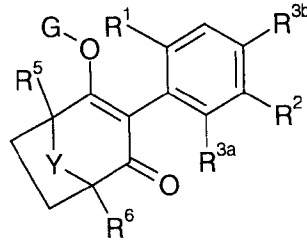
حيث Y هي O = S ، R¹ هي ethyl و R هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



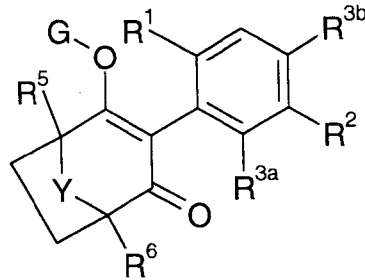
حيث Y هي S=O، R^1 و R^3 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



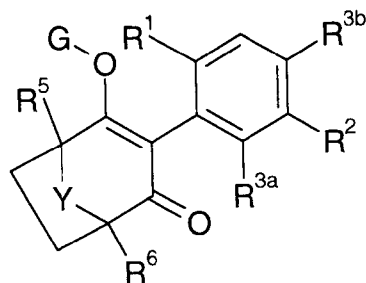
حيث Y هي O = S، R^1 و R^3 هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، Rsb هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



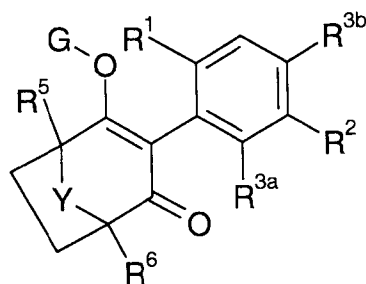
حيث Y هي O = S، R^1 هي ethyl و R^3 هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



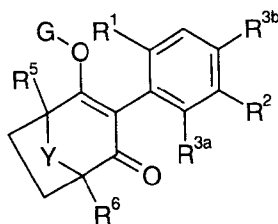
حيث Y هي O = S، R¹ و R³ هي ethyl، R⁵ هي hydrogen، و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen، و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



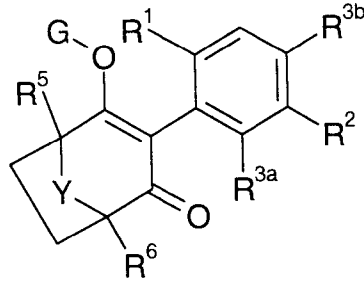
حيث Y هي O = S، R¹ و R^{3a} هي methyl، و R⁵ و R⁶ هي methyl، و Rab هي methyl، و C هي hydrogen، و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



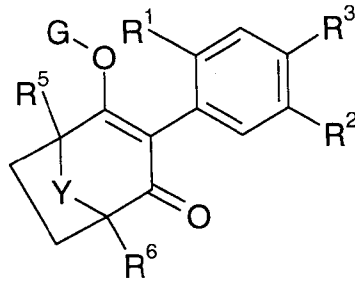
حيث Y هي O = S، R¹ هي ethyl، و R^{3A} هي methyl، و R⁵ و R⁶ هي methyl، و R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen، و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٣٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



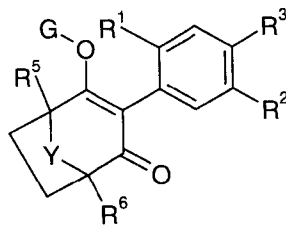
حيث Y هي O = S ، R' و R هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، Rab هي methyl ، و C هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٤٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



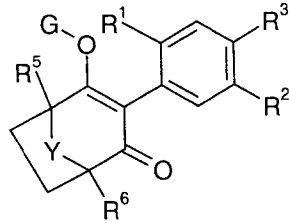
حيث Y هي S(=O)₂ ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤١: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



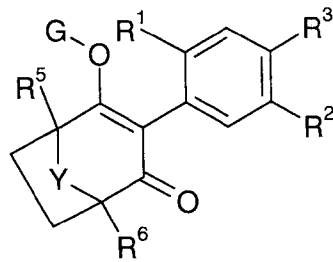
حيث Y هي S(=O)₂ ، R¹ هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



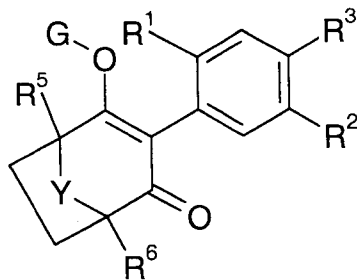
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٣ يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



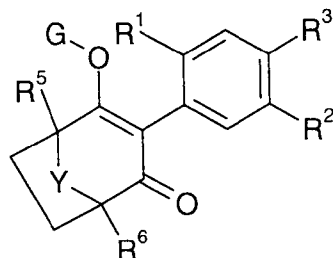
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



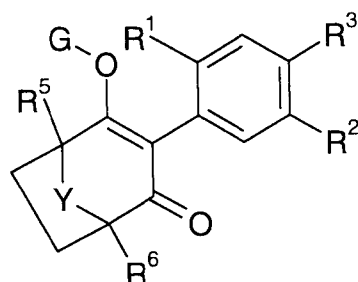
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



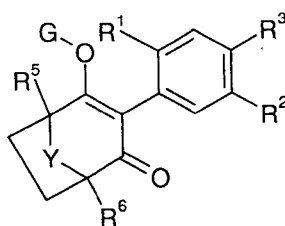
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^5 هي hydrogen، و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



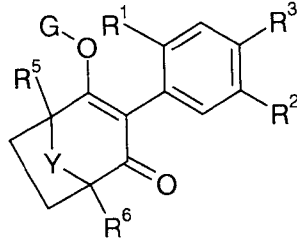
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



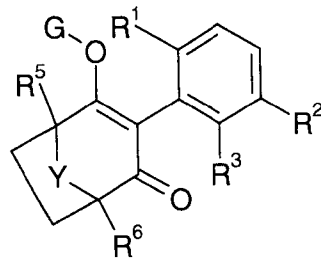
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



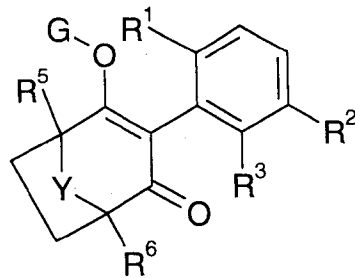
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٤٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



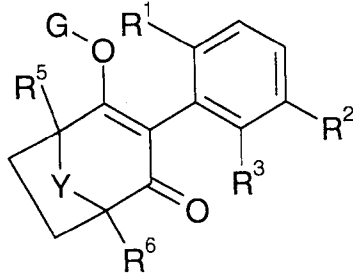
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



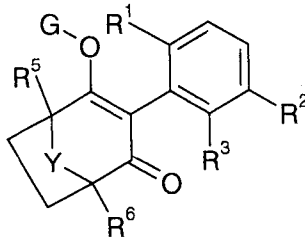
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



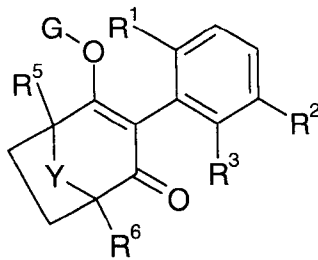
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



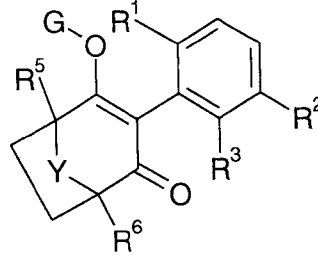
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



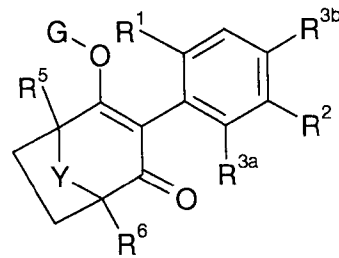
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



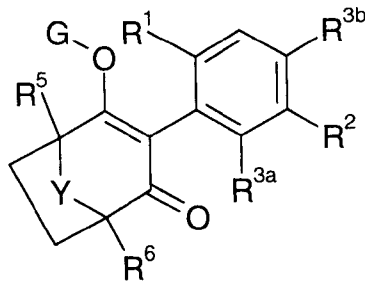
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



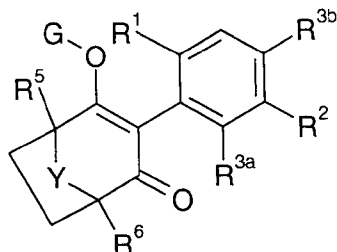
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 و R^3 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، Rsb هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



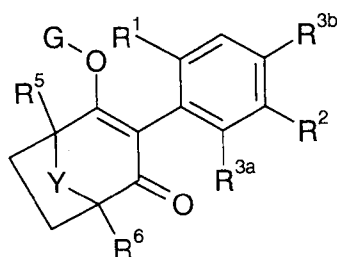
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl و R^6 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



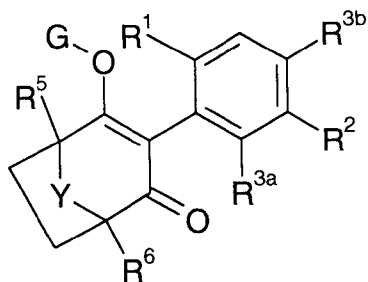
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R¹ و R هي ethyl، R⁵ و R⁶ هي methyl، R^{3b} هي hydrogen، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



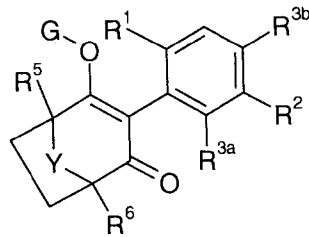
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R¹ و R هي methyl، R⁵ هي hydrogen، و R⁶ هي methyl، R هي methyl، و G هي hydrogen و R² هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٥٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



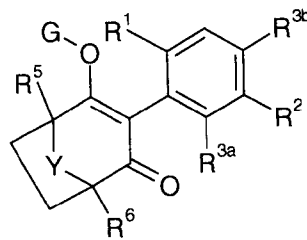
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl و R هي methyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٦٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



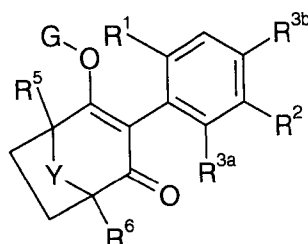
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 و R هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٦١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



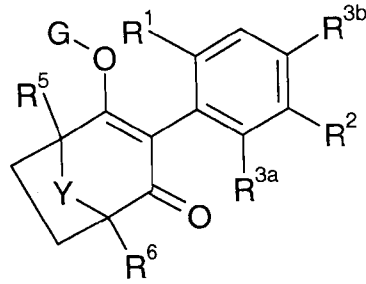
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 و R هما methyl، R^5 و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٦٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



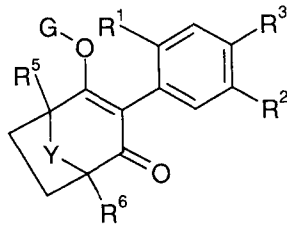
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 هي ethyl و R^{3a} هي methyl، و R^5 و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي methyl، و R^2 هي hydrogen على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٦٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



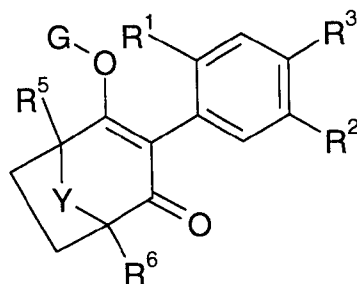
حيث Y هي $S(=O)_2$ ، R^1 و R هي ethyl، و R^5 و R^6 هي methyl، و RSb هي methyl، و G هي methyl، و R^2 هي hydrogen على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٦٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



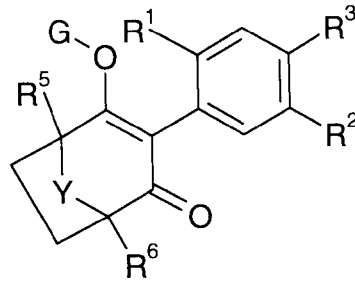
حيث Y هي $O=C$ ، R^1 هي methyl، و R^5 و R^6 هي hydrogen، و G هي hydrogen، و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١٠.

الجدول ٢٦٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



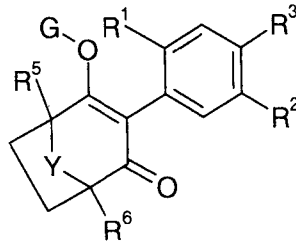
حيث Y هي O = C ، R¹ هي ethyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٦٦: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



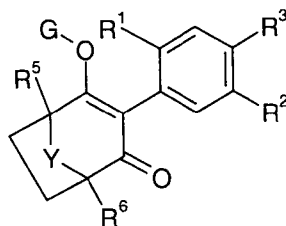
حيث Y هي O = C ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٦٧: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



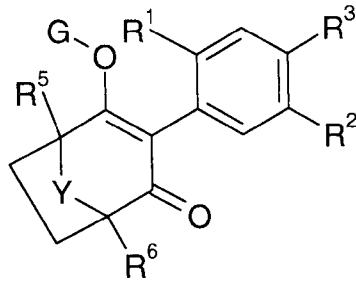
حيث Y هي O = C ، R¹ هي methyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٦٨: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



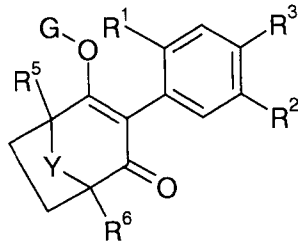
حيث Y هي O = C ، R¹ هي ethyl ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٦٩: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



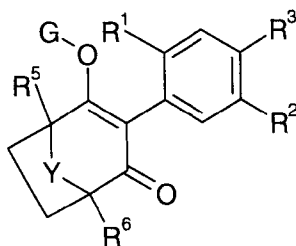
حيث Y هي Q = C ، R¹ هي chlorine ، R⁵ هي hydrogen و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² وهي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٧٠: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



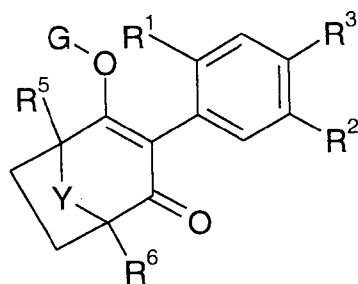
حيث Y هي Q = C ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁸ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٧٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



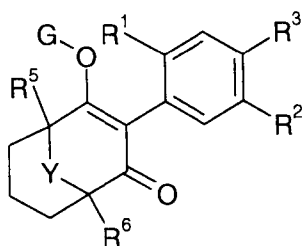
حيث Y هي O = C ، R¹ هي ethyl ، R⁶ و R⁶ هي methyl ، C هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٧٢: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



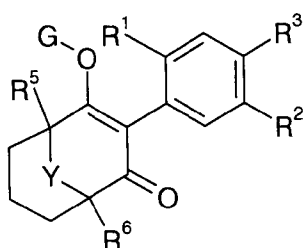
حيث Y هي O = C ، R¹ هي chlorine ، R⁵ و R⁶ هي methyl ، G هي hydrogen و R² و R³ هي على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٧٣: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



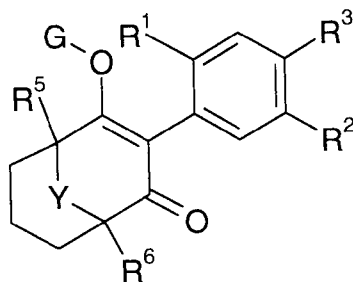
حيث Y هي O = C ، R¹ هي methyl ، R⁵ و R⁶ هي hydrogen ، G هي hydrogen و R² و R³ تكون على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٧٤: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



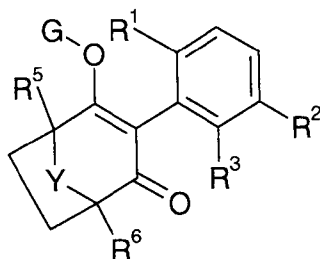
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ١.

الجدول ٢٧٥: يغطي هذا الجدول ٣٧٨ مركبا من النوع التالي :



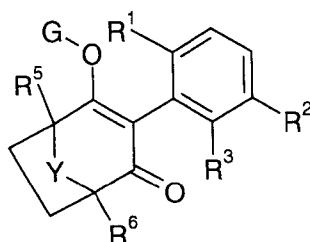
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي chlorine، R^5 و R^6 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 تكون على النحو المحدد في الجدول ١.

الجدول ٢٧٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



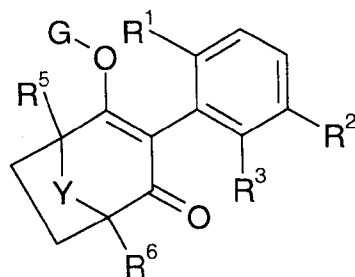
حيث Y هي $C=O$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، G هي hydrogen و R^2 و R^3 تكون على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٧٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



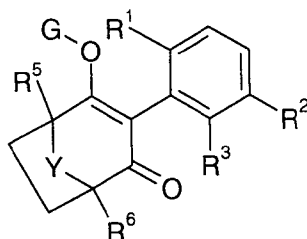
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٧٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



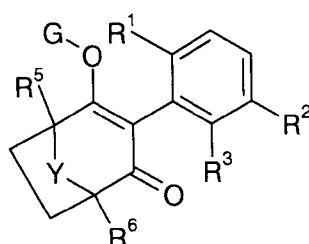
حيث Y هي $Q = C$ ، R^1 هي methyl، R^5 هي hydrogen، R^6 هي methyl، C هي hydrogen و R^2 و hydrogen هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٧٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



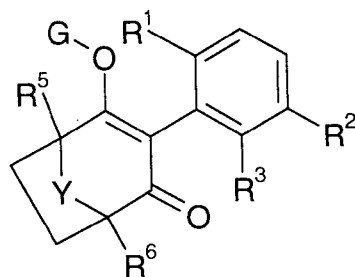
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^5 هي hydrogen، R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



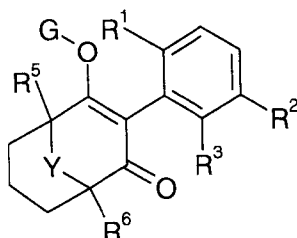
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



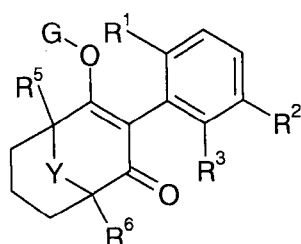
حيث Y هي $O = C$ ، R' هي ethyl، R^5 و R^6 هي methyl، G هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٢: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



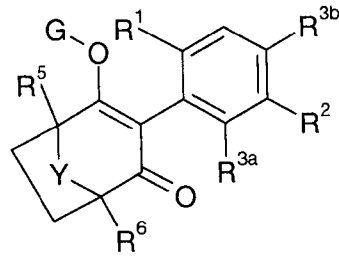
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



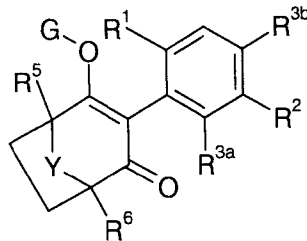
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، C هي hydrogen و R^2 و R^3 هي على النحو الموضح في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ من النوع التالي :



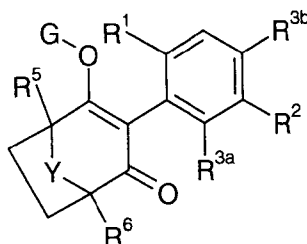
حيث Y هي $C=O$ ، R^1 و R^3 هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٥: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



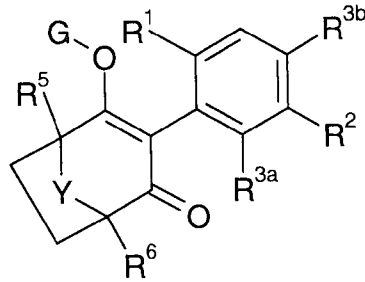
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl و R هي methyl، R^5 و R^6 هي hydrogen، R^{3b} هي methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٦: يغطي هذا الجدول ١٢٦ من النوع التالي :



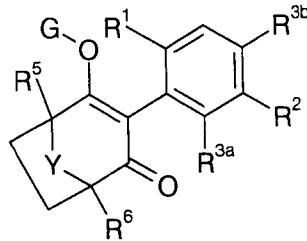
حيث Y هي O = C ، R^1 و R هي ethyl ، R^5 و R^6 هي hydrogen ، R^{3b} هي methyl ، و O هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٧: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



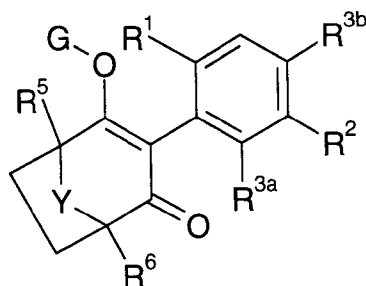
حيث Y هي O = C ، R^1 و R هي methyl ، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و O هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٨٨: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي C=O ، R^1 هي ethyl و R^{3a} هي methyl ، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl ، R^{3b} هي methyl ، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

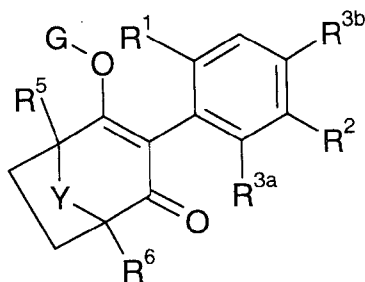
الجدول ٢٨٩: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $O = C$ ، R^1 و R^3 هي ethyl، R^5 هي hydrogen و R^6 هي methyl، R هي

methyl، و G هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

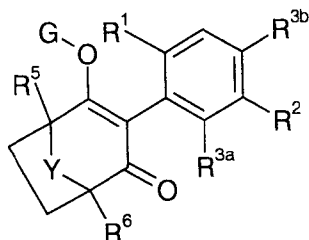
الجدول ٢٩٠: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $C = Q$ ، R^1 و R^{3A} هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، R^{3b} هي methyl، و G هي

hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

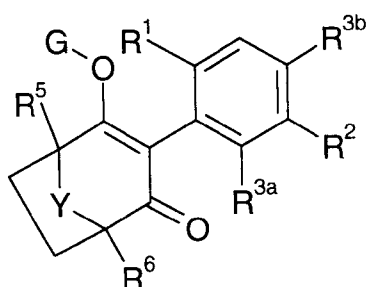
الجدول ٢٩١: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $C=O$ ، R^1 هي ethyl و R^3 هي methyl، R^5 و R^6 هي methyl، RSb هي methyl

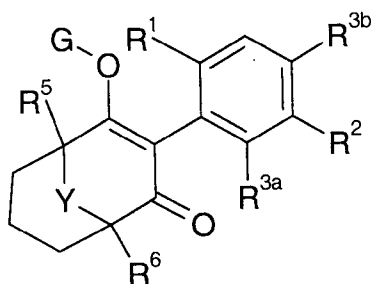
، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥. ١٠

الجدول ٢٩٢: يغطي هذا الجدول ١٢٨ مركبا من النوع التالي :



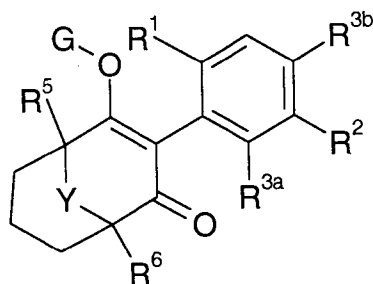
حيث Y هي $O = C$ ، R^1 و R^{3a} هي ethyl ، R^5 و R^6 methyl ، R^{sb} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

الجدول ٢٩٣: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



حيث Y هي $O = C$ ، R' و R هي methyl ، R^5 و R^6 هي hydrogen ، R^{ab} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

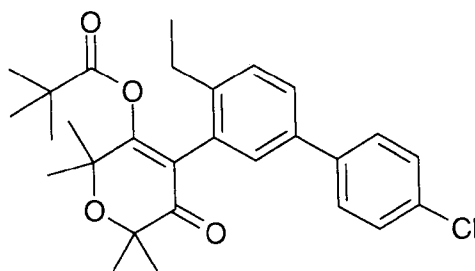
الجدول ٢٩٤: يغطي هذا الجدول ١٢٦ مركبا من النوع التالي :



Y هي $O = C$ ، R^1 هي ethyl و R هي methyl ، R^5 و R^6 هي hydrogen ، R^{3b} هي methyl ، و C هي hydrogen و R^2 هي على النحو المحدد في الجدول ٨٥.

مثال ٣٠: تحضير :

2,2-dimethylpropionic acid 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-5,6-dihydro-2H-pyran-3-yl ester



إلى محلول من :

٠٠٠٧٧) 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione جـرام،

٠٠٢ ملي مول) مذاب في dichloromethane لا مائي (٣ مل) تمت إضافة triethylamine

٠٠٣١ مل، ٠٠٢٢ ملي مول) ثم pivaloyl chloride (٠٠٢٧ مل، ٠٠٢٢ ملي مول) . وتم ٥

تقليب هذا الخليط عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٣ ساعات ، ثم تم التخفيف باستخدام

dichloromethane (١٥ مل) وتم الغسل باستخدام ماء مقطر (٢ X ١٠ مل). تم تجميع

الأجزاء العضوية ، وتم تجفيفها على magnesium sulphate ، ثم تم تركيزها لتوفير زيت خام

حيث تمت التنقية باستخدام كروماتوجراف وميضي (١٠٠٪ hexane إلى ethyl / hexane

١٠ acetate بنسبة ٩ : ١) لتوفير :

2,2-dimethylpropionic acid 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-

5,6-dihydro-2H-pyran-3-yl ester

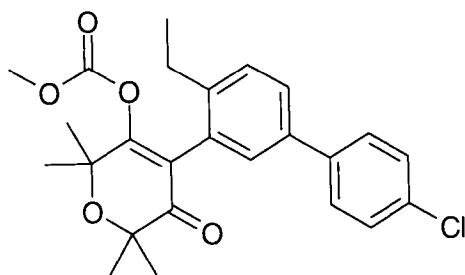
(٠٠٠٩٠ جرام) كمادة صمغية لا لون لها .

مثال ٣١:

١٥ carbonic acid 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-5,6-dihydro-

2H-pyran-3-yl ester methyl ester

- ٣٠٠ -



إلى محلول من :

٥ (٠.٣٦٦ مل مول) في chloroform جاف (٣ مل) تمت إضافة triethylamine (٠.١٥٢ مل ، ٠.١٤١ جرام) 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

١٠ (١.٠٠٩ مل مول) ، و methyl chloroformate (٠.٠٨٤ مل ، ١.٠٠٩ ملي مول) وتم تقليب

التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعتين . تمت إزالة المذيبات، و تمت تنقية الكمية الباقية

بكروماتوجراف العمود (ethyl acetate/ hexane بنسبة ٥ : ١) لتوفير :

carbonic acid 4-(4'-chloro-4-ethylbiphenyl-3-yl)-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-5,6-dihydro-

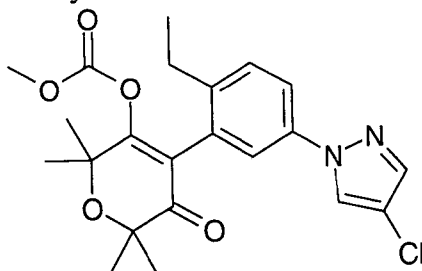
2H-pyran-3-yl ester methyl ester

(٠.١٥٠ جرام) كمادة صلبة بيضاء .

مثال ٣٢: تحضير

carbonic acid 4-[5-(4-chloropyrazol-1-yl)-2-ethylphenyl]-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-5,6-

dihydro-2H-pyran-3-yl ester methyl ester



إلى خليط من : 4-(5-bromo-2-ethylphenyl)-2,2,6,6-tetramethylpyran-3,5-dione

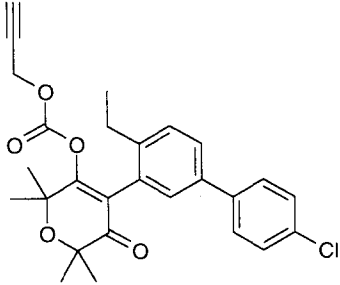
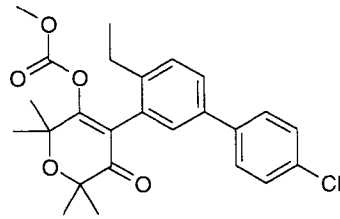
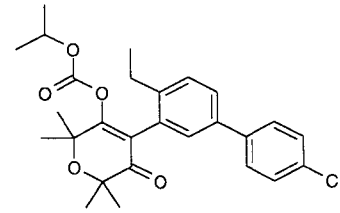
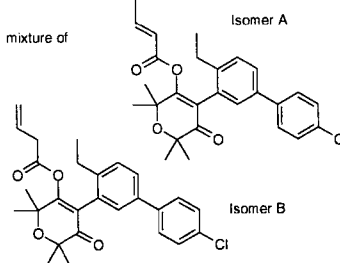
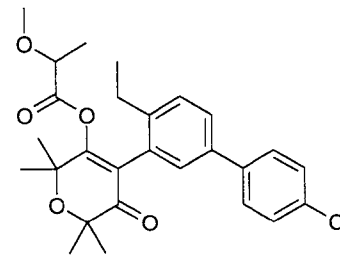
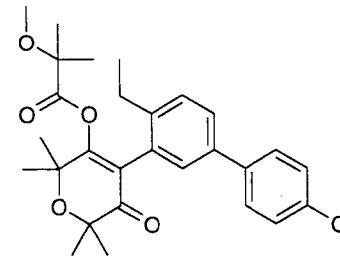
(٠.١ ٥ جرام، ٠.٤٢ ملي مول)، 4-chloropyrazole (٠.٠٦٥ جرام، ٠.٦٣ ملي مول)، L-
 proline (٠.٠٤٩ جرام . ٠.٤٢ ملي مول)، copper(I) iodide (٠.٠٨٠ جرام . ٠.٤٢ ملي مول
 و potassium phosphate لامائي مسحوق (٠.٣٦ جرام، ١.٦٨ ملي مول) تمت إضافة المركب
 المنزوع الماء من dimethylsulfoxide لامائي (١.٥ مل) . تم بعد ذلك تسخين هذا الخليط عند
 ١٦٠°م تحت إشعاع من الميكروويف لمدة ٣٠ دقيقة ، ثم تبع ذلك التبريد إلى درجة حرارة الغرفة،
 أدى التخفيف باستخدام dichloromethane (٥٠ مل) و تم الغسل ١ مولار hydrochloric acid
 المائي (٢ x ٥٠ مل) . تم تجميع الأجزاء العضوية ، وتم تجفيفها على magnesium sulphate
 اللامائية ، ثم تم تركيزها في وسط مفرغ diethyl ether تمت إضافته إلى الزيت الخام لترسيب
 المنتج الخام، حيث يكون وتم الترشيح وتم إعادة الذوبان في dichloromethane (٢٠ مل) .
 إلى هذا المحلول تمت بعد ذلك إضافة triethylamine (٦٠.١ مل ، ١.١ ملي مول) ثم تبع ذلك
 methyl chloroformate (٠.٠٩ مل، ١.١٦ ملي مول) و تم التقليب عند درجة حرارة الغرفة
 لمدة ٣ ساعات. تمت إزالة المذيبات تحت ضغط منخفض ، و تمت تنقية الكمية الباقية بشكل
 بكروماتوجراف العمود على silica gel (ethyl acetate / hexane بنسبة ٣ : ١) لتوفير :
 carbonic acid 4-[5-(4-chloropyrazol-1-yl)-2-ethylphenyl]-2,2,6,6-tetramethyl-5-oxo-5,6-
 dihydro-2H-pyran-3-yl ester methyl ester
 (٠.٠٧٥ جرام) كزيت لا لون له .

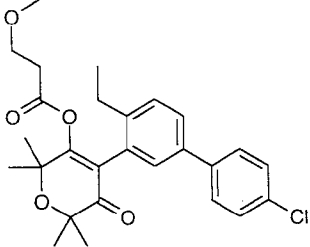
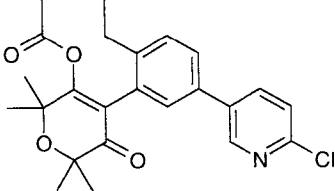
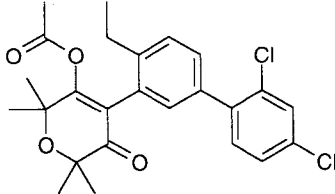
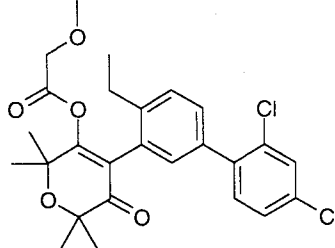
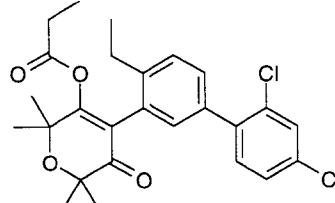
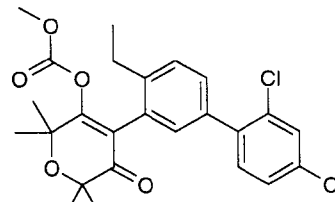
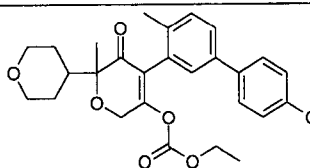
تم تحضير المركبات الإضافية في الجدول د أدناه بطرق مشابهة باستخدام مواد البدء المناسبة

الجدول د

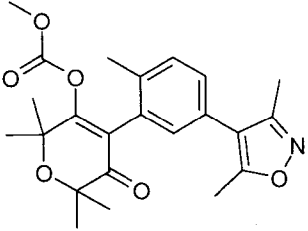
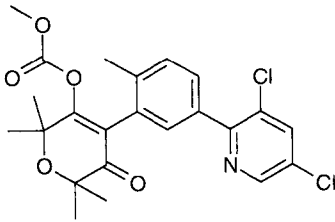
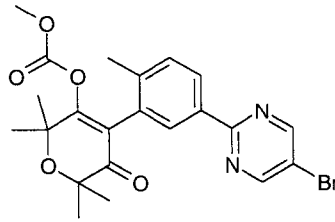
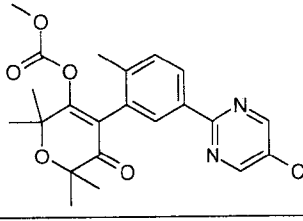
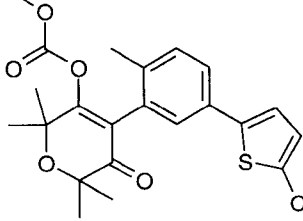
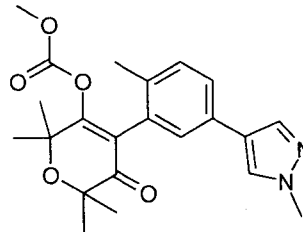
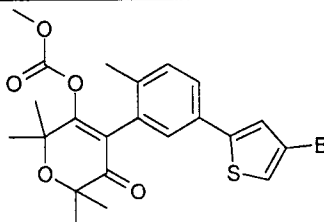
رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-1		δ 7.49 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.20 (t, 3H), 0.85 (s, 9H).
D-2		δ 7.49 (m, 2H), 7.47 (dd, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 2.49 (m, 2H), 2.05 (t, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.20 (t, 3H), 1.18 (m, 2H), 0.92 (m, 2H), 0.69 (t, 3H).
D-3		δ 7.46 (m, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 4.58 (s, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.50 (s, 3H), 0.89 (s, 9H).
D-4		Oil, LC-MS (ES+): 429, 427 (M+H) ⁺
D-5		Foam, LC-MS (ES+): 403, 401 (M+H) ⁺
D-6		δ 7.45 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 4.59 (s, 2H), 3.90 (m, 2H), 3.79 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.97 (m, 1H), 1.85 (m, 1H), 0.90 (s, 9H).
D-7		δ 7.50-7.45 (m, 3H), 7.37 (dd, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.16 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.53 (s, 6H), 1.56 (s, 6H), 1.19 (t, 3H)

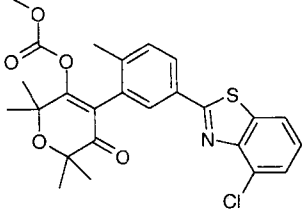
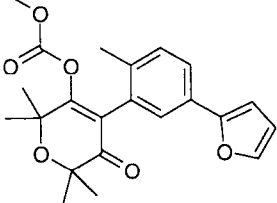
رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-8		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 2.02 (m, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.18 (t, 3H), 0.72 (t, 3H).
D-9		δ 7.49-7.42 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 2.32 (m, 1H), 1.53 (s, 12H), 1.18 (t, 3H), 0.78 (d, 3H), 0.73 (d, 3H).
D-10		δ 7.49-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 2.45 (q, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.38 (m, 1H), 1.18 (t, 3H), 0.65-0.60 (m, 2H), 0.60-0.47 (m, 2H).
D-11		δ 7.47-7.43 (m, 3H), 7.38-7.36 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.15 (m, 1H), 2.51-2.45 (m, 2H), 2.18-2.10 (m, 1H), 1.55-1.53 (m, 12H), 1.41-1.28 (m, 1H), 1.22-1.10 (m, 4H), 0.72 (app. dd, 3H), 0.58 (q, 3H).
D-12		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.67 (dd, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.48 (q, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.56 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-13		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.86 (q, 2H), 2.48 (q, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H), 0.88 (t, 3H).
D-14		δ 7.49-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 3.61 (m, 2H), 2.48 (q, 2H), 1.61-1.51 (m, 13H), 1.19 (t, 3H), 0.62 (d, 6H).

رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3) ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-15		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 4.38 (s, 2H), 2.47 (q, 2H), 2.29 (s, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.18 (t, 3H).
D-16		δ 7.50-7.45 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.46 (s, 3H), 2.47 (q, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-17		δ 7.48-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 4.49 (m, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.19 (t, 3H), 0.91 (app. dd, 6H).
D-18		δ 7.48-7.13 (m, 7H, isomers A and B), 6.83-6.74 (m, 0.66H, isomer A), 5.58 (dd, 0.66H, isomer A), 5.42-5.32 (m, 0.33H, isomer B), 4.95-4.86 (m, 0.66H, isomer B), 2.77 (dd, 0.66H, isomer B), 2.50-2.43 (m, 2H, isomers A and B), 1.74 (ddd, 2H, isomer A), 1.57-1.53 (m, 12H, isomers A and B), 1.2 (m, 3H, isomers A and B)
D-19		δ 7.48-7.42 (m, 3H), 7.39-7.36 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.59 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 2.48 (m, 2H), 1.55 (m, 12H), 1.19 (m, 3H), 0.96 (app. dd, 3H).
D-20		δ 7.47-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.17 (s, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.49 (q, 2H), 1.59-1.52 (m, 12H), 1.07 (app. d. 6H).

رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-21		δ 7.49-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.27 (t, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.48 (q, 2H), 2.27 (m, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.18 (t, 3H).
D-22		δ 8.57 (s, 1H), 7.81 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.16 (s, 1H), 2.49 (q, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.66 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-23		δ 7.46 (s, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 6.98 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.55 (app. d, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.21 (t, 3H).
D-24		δ 7.46 (s, 1H), 7.35 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.0 (d, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 1.54 (m, 12H), 1.21 (t, 3H).
D-25		δ 7.46 (s, 1H), 7.32 (m, 2H), 7.26 (m, 2H), 6.98 (d, 1H), 2.49 (q, 2H), 2.07 (q, 2H), 1.53 (m, 12H), 1.20 (t, 3H), 0.80 (t, 3H).
D-26		δ 7.46 (s, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.0 (d, 1H), 3.50 (s, 3H), 2.50 (q, 2H), 1.58 (app. d, 6H), 1.52 (app. d, 6H), 1.20 (3H).
D-27		δ 7.50-7.15 (m, 7H), 4.73 (app. dd, 1H), 4.58 (app. dd, 1H), 4.06 (q, 2H), 4.03 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.27 (m, 1H), 2.16 and 2.14 (s each, 3H together), 1.80 (m, 1H), 1.59 (m, 3H), 1.44 and 1.41 (s each, 3H together), 1.10 (t, 3H).

رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-28		Methanol- d_4 δ 8.58 (1H, m), 7.90-7.80 (3H, m), 7.62 (1H, m), 7.32 (1H, d), 2.15 (3H, s), 1.75 (3H, s), 1.58 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.47 (3H, s).
D-29		δ 7.88 (s, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-30		δ 8.40 (s, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 2.60 (s, 6H), 2.53 (app. d, 6H), 1.20 (t, 3H).
D-31		δ 7.65 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.49 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.20 (m, 3H).
D-32		δ 7.51 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.0 (d, 1H), 3.52 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.58 (m, 6H), 1.51 (m, 6H), 1.20 (t, 3H).
D-33		δ 7.47 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 4.67 (s, 2H), 4.05 (q, 2H), 3.89 (m, 2H), 3.79 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.95 (m, 1H), 1.83 (m, 1H), 1.09 (t, 3H).
D-34		DMSO- d_6 δ 7.81 (m, 1H), 7.63 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 3.43 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).

رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-35		DMSO- d_6 δ 7.34 (d, 1H), 7.28 (dd, 1H), 6.97 (d, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.53 (app. d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.41 (s, 3H).
D-36		DMSO- d_6 δ 8.70 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 3.47 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.52 (app. d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.41 (s, 3H).
D-37		DMSO- d_6 δ 9.02 (s, 2H), 8.20 (dd, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.40 (s, 3H).
D-38		DMSO- d_6 δ 9.00 (s, 2H), 8.26 (dd, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.42 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.53 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.44 (s, 3H).
D-39		DMSO- d_6 δ 7.52 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 3.45 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.51 (s, 3H), 1.46 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
D-40		(DMSO- d_6 δ 8.05 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.39 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.51 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.38 (3H, s).
D-41		DMSO- d_6 δ 7.62 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.25 (m, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.38 (s, 3H).

رقم المركب	البنية	^1H nmr (CDCl_3 ما لم يتم التحديد) أو البيانات الفيزيائية الأخرى
D-42		DMSO- d_6 δ 8.10 (dd, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.44 (m, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.50 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
D-43		DMSO- d_6 δ 7.69 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.25 (app. d, 2H), 6.86 (d, 1H), 6.54 (m, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.51 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.38 (s, 3H).

أمثلة حيوية

المثال أ

تم نشر مجموعة من بذور الأنواع المراد عمل اختبار لها في تربة قياسية في أواني. وبعد الزراعة لمدة يوم واحد (قبل النشوء) أو بعد ١٠ أيام من الزراعة (بعد النشوء) في الظروف التي يتم التحكم فيها في صوبا زجاجية، تم رش النباتات باستخدام محلول رش مائي مشتق من صيغة من المكون الفعال الفني في ٠.٦ مل acetone و ٤٥ مل من محلول الصيغة المحتوي على ١٠.٦ ٪ من Emulsogen EL (رقم التسجيل 61791-12-6)، ٤٢.٢ ٪ من N-methyl pyrrolidone، ٤٢.٢ ٪ dipropylene glycol monomethyl ether (رقم التسجيل ٨-٩٤-٣٤٥٩٠) و ٠.٢ ٪ X-77 (رقم التسجيل ٨-٦٦-١١٠٩٧). ونباتات الاختبار تم بعد ذلك إنمائها في الصوبا الزجاجية في الظروف التقليدية، ١٥ يوم بعد النشوء و ٢٠ يوما في مرحلة ما قبل النشوء، وتم تقييم الاختبار (١٠٠ = الإتلاف التام للنبات؛ وصفر = لا يوجد أي تلف للنبات)

نباتات الاختبار

Lolium perenne و Avena fatua (AVEFA) و Alopecurus myosuroides (ALOMY)

Echmochloa crus- و Digitaria San guinalis (DIGSA) و Setaria faberi (SETFA) و (LOLPE)

galli (ECHCG)

نشاط ما قبل النشوء

رقم المركب	المعدل جرام / هكتار	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETEA	DIGSA	ECHCG
١-A	٥٠٠	٤٠	١٠	١٠	٧٠	٧٠	٥٠
٢-A	٥٠٠	٥٠	٥٠	٦٠	٧٠	١٠	١٠٠
٣-A	٥٠٠	٣٠	٢٠	٢٠	٥٠	٧٠	٧٠
٨-A	٥٠٠	٦٠	٥٠	٥٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٩-A	٥٠٠	٢٠	٣٠	٢٠	٦٠	٥٠	٥٠
١٠-A	٢٥٠	٤٠	٥٠	٦٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٣٤-A	٢٥٠	٦٠	٥٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٣٥-A	٢٥٠	٧٠	٧٠	٨٠	١٠٠	٨٠	١٠٠
٣٦-A	٢٥٠	٦٠	٦٠	٨٠	٩٠	١٠٠	١٠٠
٣٨-A	٢٥٠	٥٠	١٠	٦٠	٩٠	٣٠	٧٠
٤٠-A	٢٥٠	٣٠	١٠	٢٠	٧٠	٧٠	٧٠
٤٢-A	٢٥٠	١٠٠	٣٠	٥٠	١٠٠	١٠٠	٨٠
٤٣-A	٢٥٠	٨٠	٩٠	٨٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٤٤-A	٢٥٠	٦٠	٢٠	٨٠	٥٠	١٠٠	٧٠
٤٥-A	٢٥٠	٥٠	٥٠	٨٠	٩٠	١٠٠	٧٠
٤٧-A	٢٥٠	٣٠	٢٠	٣٠	٦٠	٧٠	٧٠
٤٨-A	٢٥٠	٣٠	١٠	٠	٦٠	٦٠	١٠٠
٤٩-A	٢٥٠	٠	٢٠	٢٠	٥٠	٥٠	١٠٠
Si-A	٢٥٠	٠	٠	٤٠	١٠	٥٠	٥٠
٥٢-A	٢٥٠	٠	٠	١٠	٨٠	١٠٠	٧٠
٥٣-A	٢٥٠	١٠	٠	٠	١٠	٦٠	١٠
١-B	٥٠٠	٤٠	٦٠	٦٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
١-C	٥٠٠	٢٠	٢٠	٣٠	٣٠	٣٠	٥٠
٢-C	٢٥٠	١٠	١٠	١٠	٧٠	١٠٠	١٠٠
٣-C	٢٥٠	٦٠	٨٠	١٠	٦٠	٩٠	٧٠
٢-D	٥٠٠	٣٠	٦٠	٨٠	١٠٠	١٠٠	٨٠
٥-D	٥٠٠	٠	٢٠	٠	٢٠	٦٠	٥٠

نشاط ما بعد النشوء

رقم المركب	المعدل جرام / هكتار	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
i-A	١٢٥	١٠	٠	٨٠	٥٠	٠	٧٠
٢-A	١٢٥	٢٠	٢٠	٠	٨٠	٥٠	٨٠
٣-A	١٢٥	٠	٠	٠	٦٠	٤٠	٧٠
٥-A	١٢٥	٧٠	٧٠	٧٠	٨٠	١٠٠	١٠٠
٩-A	١٢٥	٥٠	٠	٣٠	٨٠	٨٠	٨٠
١٠-A	١٢٥	٣٠	٢٠	٠	٥٠	١٠٠	١٠٠
٣٤-A	١٢٥	٧٠	٢٠	٨٠	٩٠	٩٠	١٠٠
٣٥-A	١٢٥	٨٠	٥٠	٧٠	٨٠	٨٠	١٠٠
٣٦-A	١٢٥	٤٠	٠	٧٠	٦٠	٧٠	٧٠
٣٨-A	١٢٥	٥٠	٦٠	٠	٨٠	٧٠	٩٠
٤٠-A	١٢٥	٧٠	٦٠	٦٠	٧٠	٧٠	١٠٠
٤٢-A	١٢٥	٨٠	٩٠	٧٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٤٣-A	١٢٥	٨٠	٩٠	٨٠	١٠٠	١٠٠	١٠٠
٤٤A	١٢٥	٤٠	٦٠	٦٠	٣٠	٧٠	١٠٠
٤٥-A	١٢٥	٢٠	٧٠	٧٠	٨٠	١٠٠	١٠٠
٤٧-A	١٢٥	٩٠	٩٠	٧٠	٥٠	٨٠	١٠٠
٤٨-A	١٢٥	٧٠	٤٠	٠	٤٠	٤٠	٤٠
٤٩-A	١٢٥	٥٠	٧٠	٨٠	٥٠	٧٠	٨٠
٥١-A	١٢٥	١٠	٢٠	٠	٤٠	٦٠	٨٠
٥٢-A	١٢٥	٩٠	٧٠	٣٠	٦٠	٧٠	٩٠
٥٣-A	١٢٥	٣٠	١٠	١٠	٠	٥٠	٩٠
١-B	١٢٥	٣٠	٣٠	٨٠	٩٠	١٠٠	١٠٠
١-C	١٢٥	٥٠	٧٠	٣٠	٨٠	١٠٠	١٠٠
٢-C	١٢٥	٧٠	٧٠	٦٠	٩٠	٩٠	١٠٠
٣-C	١٢٥	٧٠	٨٠	٥٠	٩٠	١٠٠	١٠٠
٢-٠	١٢٥	٢٠	١٠	٢٠	٩٠	٩٠	٩٠
٥-٠	١٢٥	١٠	٤٠	٤٠	٧٠	٢٠	٦٠

المثال ب

تم نثر مجموعة من بذور الأنواع المراد عمل اختبار لها في تربة قياسية في أواني. وبعد الزراعة لمدة يوم واحد (قبل النشوء) أو بعد ٨ أيام من الزراعة (بعد النشوء) في الظروف التي يتم التحكم فيها في بيت من الزجاج (عند ١٦/٢٤ درجة مئوية، في اليوم والليلة، ١٤ ساعة من الضوء، و ٦٥ % رطوبة)، تم رش النباتات باستخدام محلول رش مائي مشتق من صيغة من المكون النشط الفني ٥ في acetone / ماء (٥٠: ٥٠) يحتوي على ٠.٥ % من Tween 20 (polyoxyethelyene sorbitan monolaurate ، CAS RN 9005-64-5). تم بعد ذلك إنماء نباتات الاختبار في صوبا زجاجية في ظروف يتم التحكم فيها (عند ١٦/٢٤ درجة مئوية، في اليوم والليلة، ١٤ ساعة من النهار، و ٦٥ % رطوبة) وتم سقيها بالماء مرتين في اليوم. بعد ١٣ يوما بعد النشوء وقبل النشوء، ١٠ تم تقييم هذا الاختبار (١٠٠ = تلف تام للنبات، وصفر = عدم حدوث أي تلف للنبات).

نباتات الاختبار

Alopecurus myosuroides (ALOMY), Avena fatua (AVEFA), Setaria faberi (SETFA), Echinochloa crus-galli (ECHCG), Solanum nigrum (SOLNI) and Amaranthus retroflexus (AMARE)

١٥ نشاط ما قبل النشوء

رقم المركب	المعدل جرام / هكتار	SOL NI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	AVEFA
٤-A	٢٥٠	-	٢٠	١٠٠	٧٠	١٠٠	٧٠
١٥-A	١٠٠٠	١٠٠	١٠٠	٥٠	٥٠	١٠٠	٥٠
١٦-A	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٣٠	١٠٠	٢٠
٢٠-A	١٠٠٠	٤٠	٠	١٠٠	٩٠	١٠٠	٦٠

۲۱-Α	۱۰۰۰	۵۰	۶۰	۱۰۰	۱۰۰	۹۰	۵۰
۲۲-Α	۱۰۰۰	۶۰	۳۰	۴۰	۴۰	۹۰	۲۰
۲۴-Α	۱۰۰۰	۲۰	۲۰	۹۰	۸۰	۱۰۰	۶۰
۲۵-Α	۱۰۰۰	.	.	۲۰	۷۰	۸۰	۳۰
۲۶-Α	۱۰۰۰	.	.	۱۰۰	۸۰	۱۰۰	۸۰
۲۷-Α	۱۰۰۰	۲۰	۱۰	۹۰	۸۰	۱۰۰	۶۰
۲۹-Α	۱۰۰۰	.	.	۱۰۰	۹۰	۱۰۰	۸۰
۳۰-Α	۱۰۰۰	.	.	۱۰۰	۸۰	۱۰۰	۷۰
۳۱-Α	۱۰۰۰	.	.	۱۰۰	۵۰	۱۰۰	.
۳۷-Α	۱۰۰۰	.	.	۲۰	۴۰	۳۰	۲۰
۵۴-Α	۱۰۰۰	.	۲۰	۹۰	۷۰	۱۰۰	۸۰
۵۶-Α	۱۰۰۰	۲۰	.	.	۱۰	۳۰	۴۰
۵۸-Α	۱۰۰۰	۲۰	۲۰	۱۰۰	۸۰	۱۰۰	۶۰
۵۹-Α	۲۵۰	-	.	۴۰	۳۰	۹۰	۴۰
۶۰-Α	۲۵۰	-	.	۲۰	.	۲۰	.
۶۲-Α	۲۵۰	-	.	۶۰	۲۰	.	۲۰
۶۳-Α	۲۵۰	-	.	۳۰	.	.	.
۶۴-Α	۲۵۰	-	.	۴۰	.	۴۰	۲۰
۶۵-Α	۲۵۰	-	.	.	.	۹۰	.
۶۶-Α	۲۵۰	-	.	۵۰	.	۶۰	۴۰
۶۷-Α	۲۵۰	-	.	۹۰	۴۰	۶۰	.
۶۹-Α	۲۵۰	-	.	۸۰	.	۶۰	.
۷۱-Α	۲۵۰	-	.	۱۰۰	۴۰	۸۰	۲۰
۷۲-Α	۲۵۰	-	.	.	.	۴۰	.
۷۳-Α	۲۵۰	-	.	۲۰	.	۱۰	.
۷۴-Α	۲۵۰	-	۱۰	۵۰	۲۰	۸۰	.
۷۵-Α	۲۵۰	-	.	۹۰	۳۰	۹۰	۳۰
۷۶-Α	۲۵۰	-	.	۱۰۰	۶۰	۷۰	۵۰
۷۷-Α	۲۵۰	-	.	۲۰	۱۰	.	.
۷۹-Α	۲۵۰	-	.	۱۰۰	۴۰	۸۰	۴۰
۸۰-Α	۲۵۰	-	.	۷۰	۳۰	۴۰	.
۸۱-Α	۲۵۰	-	.	۱۰۰	۸۰	۱۰۰	۹۰
۸۲-Α	۲۵۰	-	۲۰	۹۰	۸۰	۱۰۰	۹۰

۸۳-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۵.	۹.	۴.
۸۷-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۸۸-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	۱.
۸۹-Α	۲۵.	-	.	۵.	.	.	.
۹۰-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۹۲-Α	۲۵.	-	.	۶.	۱.	۵.	.
۹۶-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۹۷-Α	۲۵.	-	.	۶.	.	۵.	.
۹۸-Α	۲۵.	-	۵.	۹.	.	۹.	.
۹۹-Α	۲۵.	-	۲.	۱۰۰	۸.	۱۰۰	۵.
۱۰۰-Α	۲۵.	-	۶.	۱۰۰	۲.	۸.	۹.
۱۰۱-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۷.	۱۰۰	۱۰۰
۱۰۲-Α	۲۵.	-	.	۹.	۳.	۹.	.
۱۰۳-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۱۰۴-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۱۰۵-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۱۲۲-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۴.	۹.	۱۰۰
۱۲۳-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۵.	۷.	۸.
۱۲۴-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۵.	۷.	۶.
۱۲۵-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۷.	۹.	۸.
۱۲۶-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۳.	۸.	۹.
۱۲۷-Α	۲۵.	-	.	۹.	۳.	۵.	۷.
۱۲۸-Α	۲۵.	-	.	۹.	۴.	۷.	۸.
۱۲۹-Α	۲۵.	-	.	۹.	۲.	۴.	۳.
۱۳۰-Α	۲۵.	-	.	۹.	۲.	۴.	۲.
۱۳۲-Α	۲۵.	-	.	.	.	.	.
۱۳۳-Α	۲۵.	-	.	۸.	۱.	.	۷.
۱۳۵-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۸.	۱۰۰	۱۰۰
۱۳۶-Α	۲۵.	-	.	۳.	۲.	۹.	۸.
۱۳۷-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰	۷.	۱۰۰	۹.
۱۳۸-Α	۲۵.	-	۲.	۱۰۰	۹.	۱۰۰	۹.
۱۳۹-Α	۲۵.	-	.	۷.	.	۳.	.
۱۴۱-Α	۲۵.	-	.	۸.	۲.	۱۰۰	۳.

142-A	20.	-	.	100	7.	7.	7.
143-A	20.	-	.	7.	2.	.	.
1U-A	20.	-	3.	100	100	9.	8.
147-A	20.	-	.	7.	100	100	7.
2-B	1000	3.	9.	.	.	7.	2
A-149	20.	-	.	9.	7.	100	3.
A-150	20.	-	.	100	9.	100	4.
A-151	20.	-	.	100	100	100	100
A-152	20.	-	.	100	7.	100	9.
A-153	20.	-	.	100	7.	100	0.
A-154	20.	-	.	9.	0.	100	2.
A-155	20.	-	.	100	0.	100	.
A-149	20.	-	.	9.	7.	100	3.
B-2	100	3.	9.	.	.	7.	2.
4-B	1000	.	.	.	.	3.	.
7-B	1000	9.	100	.	.	.	.
7-B	1000	2.	.	7.	.	0.	.
9-B	20.	.	.	.	.	.	.
10-A	20.	2.	.	0.	.	3.	.
12-B	20.	.	.	0.	.	3.	.
13-B	20.	.	.	2.	.	3.	2.
18-B	20.	.	.	2.	4.	.	.
23-B	20.	.	.	.	.	1.	.
20-B	20.	.	.	.	.	.	.
27-B	20.	.	.	.	.	.	.
28-B	20.	.	.	.	.	.	.
29-B	20.	.	.	3.	.	2.	.
30-B	20.	.	.	.	.	.	.
31-B	20.	.	.	0.	.	0.	2.
4-C	20.	-	.	.	.	.	.
0-C	20.	-	.	.	.	.	.
7-c	20.	-	.	.	.	.	.
7-C	20.	-	.	.	.	.	.
8-C	20.	-	.	.	.	.	.

٩-C	٢٥٠	-	٠	٠	٠	٠	٠
١٠-c	٢٥٠	-	٠	٠	٢٠	٤٠	٢٠
١١-c	٢٥٠	-	٠	٠	٠	٠	٨٠
١٢-C	٢٥٠	-	٠	٩٠	٠	٢٠	٩٠
١٣-C	٢٥٠	-	٠	٨٠	٢٠	٣٠	٩٠
٧-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٦٠	٩٠	٣٠
٨-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٤٠	٩٠	٠
٩-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٢٠	٧٠	٠
١٠-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٥٠	١٠٠	٠
١١-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٢٠	٢٠	٠
١٢-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٩٠	١٠٠	٦٠
١٣-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٥٠	٩٠	٢٠
١٤-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٥٠	٦٠	٢٠
١٥-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٨٠	١٠٠	٦٠
١٦-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٥٠	٩٠	٠
١٧-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٢٠	٨٠	٠
١٨-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٧٠	١٠٠	٥٠
١٩-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٧٠	١٠٠	٢٠
٢٠-D	١٠٠٠	٠	٠	٩٠	٣٠	٦٠	٠
٢١-D	١٠٠٠	٠	٠	١٠٠	٩٠	١٠٠	٥٠
٢٢-D	٢٥٠	-	٠	١٠٠	٦٠	١٠٠	٥٠
٢٣-D	٢٥٠	-	٠	٩٠	٠	١٠٠	٠
٢٤-D	٢٥٠	-	٢٠	٩٠	٠	١٠٠	٠
٢٥-D	٢٥٠	-	٠	٩٠	٢٠	٩٠	٠
٢٨-D	٢٥٠	-	٠	٨٠	٣٠	٢٠	٤٠
٣٢-D	٢٥٠	-	٠	٨٠	٢٠	٦٠	٨٠

نشاط ما بعد النشوء

رقم المركب	المعدل جرام / هكتار	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	AVEFA
٤-A	٢٥٠	-	٢٠	١٠٠	٩٠	١٠٠	٨٠
١٥-A	١٠٠٠	١٠	٩٠	١٠	١٠	٥٠	٢٠
١٦-A	١٠٠٠	١٠	٤٠	١٠٠	٣٠	١٠٠	٣٠
٢٠-A	١٠٠٠	٨٠	٢٠	١٠٠	٩٠	١٠٠	٩٠
٢١-A	١٠٠٠	٢٠	٢٠	٦٠	٤٠	٩٠	٦٠

22-A	1...	9.	.	2.	3.	8.	.
24-A	1...	7.	9.	1..	1..	1..	8.
25-A	1...	7.	1..	7.	7.	9.	.
26-A	1...	0.	1..	1..	1..	1..	1..
27-A	1...	0.	1..	1..	8.	1..	8.
29-A	1...	7.	4.	1..	1..	1..	1..
3.-A	1...	7.	7.	1..	9.	1..	1..
31-A	1...	7.	.	1..	1..	1..	9.
37-A	1...	7.	.	8.	7.	9.	3.
04-A	1...	.	.	8.	8.	9.	0.
06-A	1...	2.	2.	8.	8.	8.	0.
08-A	1...	3.	7.	9.	9.	1..	9.
09-A	20.	-	.	9.	3.	1..	0.
7.-A	20.	-	7.	8.	2.	8.	.
72-A	20.	-	.	1..	7.	1..	7.
73-A	20.	-	.	1..	9.	1..	7.
74-A	20.	-	2.	9.	2.	1..	.
75-A	20.	-	1.	7.	2.	9.	.
77-A	20.	-	1.	1..	2.	1..	3.
77-A	20.	-	1..	3.	8.	1..	8.
79-A	20.	-	9.	1..	7.	1..	9.
71-A	20.	-	1..	1..	3.	1..	3.
72-A	20.	-	7.	8.	2.	8.	.
73-A	20.	-	.	9.	2.	9.	.
74-A	20.	-	7.	9.	.	9.	.
75-A	20.	-	.	1..	9.	1..	9.
76-A	20.	-	.	1..	9.	1..	7.
77-A	20.	-	.	9.	7.	1..	7.
79-A	20.	-	.	1..	8.	1..	0.
8.-A	20.	-	.	9.	3.	1..	.
81-A	20.	-	.	1..	1..	1..	1..
82-A	20.	-	.	1..	1..	1..	1..
83-A	20.	-	.	1..	8.	1..	8.

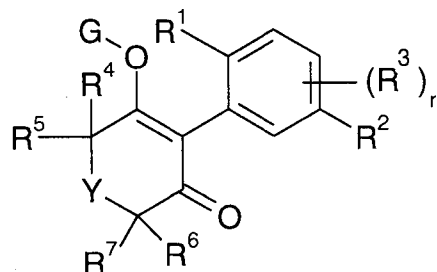
۸۷-Α	۲۵.	-	.	۸.	۱.	۸.	.
۸۸-Α	۲۵.	-	.	۹.	۵.	۹.	۱.
۸۹-Α	۲۵.	-	.	۸.	۸.	۹.	۵.
۹۰-Α	۲۵.	-	.	۹.	۴.	۹.	۲.
۹۲-Α	۲۵.	-	.	۹.	۵.	۱۰۰.	.
۹۶-Α	۲۵.	-	.	۹.	۵.	۱۰۰.	۳.
۹۷-Α	۲۵.	-	.	۷.	۴.	۹.	۳.
۹۸-Α	۲۵.	-	۳.	۱۰۰.	۵.	۱۰۰.	۷.
۹۹-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۹.	۱۰۰.	۹.
۱۰۰-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۹.	۱۰۰.	۹.
۱۰۱-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.
۱۰۲-Α	۲۵.	-	.	۳.	۲.	۷.	.
۱۰۳-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۱.	۱۰۰.	.
۱۲۲-Α	۲۵.	-	۴.	۱۰۰.	۸.	۱۰۰.	۵.
۱۲۳-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۹.	۱۰۰.	۷.
۱۲۴-Α	۲۵.	-	۲.	۱۰۰.	۸.	۱۰۰.	۹.
۱۲۵-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.	۹.
۱۲۶-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۷.	۱۰۰.	۹.
۱۲۷-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۸.	۱۰۰.	۴.
۱۲۸-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۸.	۱۰۰.	۹.
۱۲۹-Α	۲۵.	-	.	۸.	۷.	۹.	۸.
۱۳۰-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۴.	۱۰۰.	۴.
۱۳۲-Α	۲۵.	-	.	۹.	۲.	۷.	۳.
۱۳۳-Α	۲۵.	-	۷.	۱۰۰.	۲.	۱۰۰.	۸.
۱۳۵-Α	۲۵.	-	.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.
۱۳۶-Α	۲۵.	-	.	۷.	۸.	۱۰۰.	۱۰۰.
۱۳۷-Α	۲۵.	-	۳.	۱۰۰.	۹.	۱۰۰.	۹.
۱۳۸-Α	۲۵.	-	۶.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.
۱۳۹-Α	۲۵.	-	۵.	۸.	۳.	۱۰۰.	۵.
۱۴۱-Α	۲۵.	-	.	۸.	۵.	۱۰۰.	۵.
۱۴۲-Α	۲۵.	-	.	۸.	۱۰۰.	۱۰۰.	۸.
۱۴۳-Α	۲۵.	-	.	۹.	۹.	۱۰۰.	۸.
۱۴۴-Α	۲۵.	-	۴.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.	۱۰۰.

147-A	20.	-	.	7.	100	100	9.
A-149	250	-	2.	100	9.	100	7.
A-150	250	-	.	100	9.	100	8.
A-151	250	-	.	100	100	100	100
A-152	250	-	.	100	100	100	100
A-153	250	-	3.	100	100	100	100
A-154	250	-	.	100	100	100	7.
A-155	250	-	4.	100	100	100	9.
2-B	1000	4.	7.	2.	.	8.	.
4B	1000	4.	7.	9.	8.	9.	3.
6-B	1000	.	.	3.	2.	0.	.
7-B	1000	7.	7.	7.	2.	6.	2.
9-B	20.	2.	4.	7.	4.	8.	.
10-B	20.	.	4.	8.	4.	9.	2.
12-B	20.	.	3.	9.	6.	100	.
13-B	20.	.	2.	9.	.	8.	3.
18-B	20.	.	.	7.	1.	6.	.
23-B	20.	.	.	7.	3.	6.	.
20-B	20.	.	.	2.	2.	7.	.
27-B	20.	.	.	6.	7.	8.	.
28-B	20.	.	.	7.	.	7.	.
29-B	20.	3.	2.	8.	3.	100	.
30-B	20.	1.	.	7.	2.	7.	.
31-B	20.	.	.	9.	1.	9.	.
4-C	20.	-	2.	7.	6.	7.	3.
0-C	20.	-	.	9.	7.	100	7.
6-C	20.	-	4.	3.	2.	6.	.
7-C	20.	-	.	3.	2.	6.	.
B-C	20.	-	.	4.	2.	6.	.
9-C	20.	-	.	1.	0.	7.	4.
iC-C	20.	0	.	2.	2.	7.	0.
il-C	20.	-	2.	3.	7.	8.	6.
12-C	20.	-	.	9.	8.	9.	9.

13-C	20.	-	2.	100	8.	100	9.
7-D	1000	.	.	100	9.	100	7.
8-D	1000	.	.	100	7.	100	1.
9-D	1000	.	.	9.	3.	100	.
10-D	1000	.	2.	100	9.	100	2.
11-D	1000	.	.	9.	4.	100	.
12-D	1000	.	.	100	9.	100	9.
13-D	1000	.	.	100	7.	100	.
14-D	1000	.	.	100	2.	100	1.
15-D	1000	.	.	100	8.	100	7.
16-D	1000	.	.	100	9.	100	2.
17-D	1000	.	1.	100	7.	100	2.
18-D	1000	.	2.	100	100	100	9.
19-D	1000	.	.	100	9.	100	8.
D2-D	1000	.	2.	100	100	100	9.
21-D	1000	3.	1.	100	100	100	9.
22-D	20.	-	.	100	9.	100	100
23-D	20.	-	.	9.	.	100	.
24-D	20.	-	.	100	.	100	2.
25-D	20.	-	.	9.	.	9.	2.
28-D	20.	-	.	8.	8.	9.	5.
32-D	20.	-	.	8.	5.	9.	7.

عناصر الحماية

١ - مركبات لها الصيغة I



(I),

٣ حيث

٤ R^1 عبارة عن :

٥ halogen, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 -

٦ C_4 haloalkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 -

٧ C_4 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, nitro or cyano;

٨ R^2 عبارة عن aryl بها استبدال اختياري أو aryl غير متجانس بها استبدال اختياري ؛

٩ r عبارة عن صفر أو ١ أو ٢ أو ٣؛

١٠ R^3 ، عندما تكون قيمة r هي ١، تكون عبارة عن :

١١ halogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_2 - C_6 alkenyl,

١٢ C_2 - C_6 alkynyl, C_1 - C_6 alkylthio, C_1 - C_6 alkylsulfinyl, C_1 - C_6 alkylsulfonyl, cyano or

١٣ nitro

١٤ أو تكون مجموعات الاستبدال R^3 ، إذا كانت r عبارة عن ٢ أو ٣، كل منها على حدة

١٥ عبارة عن :

١٦ halogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_2 - C_6 alkenyl,

- ١٧ C₂-C₆alkynyl, C₁-C₆alkylthio, C₁-C₆alkylsulfinyl, C₁-C₆alkylsulfonyl, cyano or
- ١٨ nitro;
- ١٩ تكون R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷، كل منهما على حدة، عبارة عن :
- ٢٠ hydrogen, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkoxyC₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylthioC₁-
- ٢١ C₄alkyl, C₁-C₄alkylsulfinylC₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylsulfonylC₁-C₄alkyl, cyclopropyl
- ٢٢ or cyclopropyl
- ٢٣ بها استبدال بواسطة :
- ٢٤ C₁- or C₂alkyl, C₁- or C₂haloalkyl or halogen; cyclobutyl or cyclobutyl
- ٢٥ بواسطة C₁- or C₂alkyl; oxetanyl or oxetanyl بها استبدال بواسطة C₁- or C₂alkyl;
- ٢٦ C₅-C₇cycloalkyl or C₅-C₇cycloalkyl بها استبدال بواسطة :
- ٢٧ methylene، حيث C₁- or C₂alkyl or C₁- or C₂haloalkyl، تكون عبارة عن مجموعة
- ٢٨ موجودة في جزء cycloalkyl والتي تم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت
- ٢٩ sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ C₄-C₇ cycloalkenyl أو C₄-C₇
- ٣٠ cycloalkenyl به استبدال بواسطة C₁- أو C₂alkyl أو C₁- أو C₂haloalkyl ، حيث
- ٣١ methylene عبارة عن مجموعة من جزء cycloalkenyl والتي تم استبدالها بشكل اختياري
- ٣٢ بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ cyclopropyl
- ٣٣ alkyl C₁-C₅ أو cyclopropyl alkyl C₁-C₅ بها استبدال بواسطة C₁- أو C₂alkyl أو
- ٣٤ C₁- أو C₂haloalkyl أو halogen ؛ cyclobutyl alkyl C₁-C₅ أو cyclobutyl C₁-
- ٣٥ alkyl C₅ بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₂ ؛ oxetanyl alkyl C₁-C₅ أو oxetanyl
- ٣٦ alkyl C₁-C₅ بها استبدال بواسطة C₁- أو C₂alkyl ؛ C₅-C₇ cycloalkyl alkyl C₁-C₅

- ٣٧ أو alkyl C₁-C₅ cycloalkyl C₁-C₇ بها استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو
- ٣٨ haloalkyl C₂ ، حيث أن مجموعة methylene من جزء cycloalkyl يتم استبدالها بشكل
- ٣٩ اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ C₄-C₇
- ٤٠ alkyl C₁-C₅ cycloalkenyl أو alkyl C₁-C₅ cycloalkenyl حيث يكون بها
- ٤١ استبدال بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ أو -C₁ أو haloalkyl C₂ ، حيث أن مجموعة
- ٤٢ methylene هي من جزء cycloalkenyl التي يتم استبدالها بشكل اختياري بذرة oxygen أو
- ٤٣ ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة sulfonyl ؛ phenyl أو phenyl بها استبدال
- ٤٤ بواسطة alkyl C₁-C₄ alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو halogen أو nitro
- ٤٥ أو cyano أو alkylthio C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو sulfinyl أو alkyl C₁-C₄
- ٤٦ sulfonyl أو alkylcarbonyl C₁-C₄ ؛ benzyl أو benzyl بها استبدال بواسطة C₁-C₄
- ٤٧ alkyl أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو halogen أو nitro أو cyano
- ٤٨ أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو sulfonyl أو C₁-C₄
- ٤٩ alkylcarbonyl ؛ aryl غير متجانس أو aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة C₁-C₄
- ٥٠ alkyl أو alkoxy C₁-C₄ أو haloalkyl C₁-C₄ أو halogen أو nitro أو cyano
- ٥١ أو alkylthio C₁-C₄ أو alkylsulfinyl C₁-C₄ أو alkyl C₁-C₄ أو sulfonyl أو C₁-
- ٥٢ alkylcarbonyl ؛ أو
- ٥٣ R⁴ و R⁵ ، أو R⁶ و R⁷ ، تم ربطهما معاً لتكوين حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى
- ٥٤ ٧ ذرات والتي تم فيها استبدال مجموعة methylene بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة
- ٥٥ كبريت sulfur أو حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى ٧ ذرات وبها استبدال
- ٥٦ بواسطة -C₁ أو alkyl C₂ ، حيث أن مجموعة methylene من الحلقة يتم استبدالها

- ٥٧ بشكل اختياري بذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur ؛ أو
- ٥٨ R^4 و R^7 تم ربطهما لتشكيل حلقة مشبعة أو غير مشبعة بها من ٥ إلى ٧ ذرات ليس بها
- ٥٩ استبدال أو بها استبدال بواسطة $-C_1$ أو alkyl C_2 ، $-C_1$ أو alkoxy C_2 ، C_1-C_2
- ٦٠ alkoxy C_1-C_2 ، alkyl ، hydroxy ، halogen ، phenyl أو phenyl بها استبدال
- ٦١ بواسطة alkyl C_1-C_4 ، alkoxy C_1-C_4 ، haloalkyl C_1-C_4 ، halogen ، nitro ،
- ٦٢ cyano ، alkylthio C_1-C_4 ، sulfinyl alkyl C_1-C_4 ، sulfonyl alkyl C_1-C_4 أو C_1-
- ٦٣ C_4 alkylcarbonyl ؛ aryl غير متجانس أو aryl غير متجانس بها استبدال بواسطة
- ٦٤ C_1-C_4 alkyl ، C_1-C_4 alkoxy ، haloalkyl C_1-C_4 ، halogen ، nitro ، cyano ، C_1-
- ٦٥ C_4 alkylthio ، alkyl C_1-C_4 ، sulfinyl alkyl C_1-C_4 ، sulfonyl alkyl C_1-C_4 أو C_1-C_4
- ٦٦ ؛ alkylcarbonyl
- ٦٧ Y عبارة عن O أو $C=O$ أو $S(O)_m$ أو $=S(O)_nNR^8$ بشرط أنه عندما تكون Y هي $C=O$
- ٦٨ ، تكون R^6 و R^7 مختلفتين عن hydrogen عندما تكون واحدة من R^4 أو R^5 عبارة عن
- ٦٩ hydrogen ، و R^4 و R^5 تكونان مختلفتين عن hydrogen عندما تكون واحدة من R^6 أو R^7
- ٧٠ عبارة عن hydrogen ؛
- ٧١ m عبارة عن صفر أو ١ أو ٢ و n عبارة عن صفر أو ١ ؛
- ٧٢ R^8 عبارة عن :
- ٧٣ hydrogen, C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_6 alkoxycarbonyl, tri(C_1-C_6 alkyl)silyl-
- ٧٤ ethyloxycarbonyl, C_1-C_6 haloalkoxycarbonyl, cyano, C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6-
- ٧٥ hydroxyalkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_1-C_6 alkylcarbonyl,
- ٧٦ C_1-C_6 haloalkylcarbonyl, C_1-C_6 cycloalkylcarbonyl, phenylcarbonyl or

- phenylcarbonyl ٧٧
- ٧٨ بها استبدال بواسطة R^9 ؛ pyridylcarbonyl أو pyridylcarbonyl بها استبدال بواسطة
- ٧٩ R^9 ؛ phenoxycarbonyl أو phenoxycarbonyl بها استبدال بواسطة R^9 ؛
- ٨٠ benzyloxycarbonyl or benzyloxycarbonyl بها استبدال بواسطة R^9 ؛ R^9 عبارة عن C_1-
- ٨١ haloalkyl C_6 أو alkoxycarbonyl C_1-C_6 أو nitro أو cyano أو formyl أو
- ٨٢ carboxyl أو halogen ،
- ٨٣ و G عبارة عن hydrogen ، أو cation مقبول زراعياً أو مجموعة مؤخره للمفعول.
- ١ ٢- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١ ، حيث R^1 هي halogen أو alkyl C_1-C_4 أو
- ٢ haloalkyl C_1-C_4 أو alkenyl C_2-C_4 أو alkynyl C_2-C_4 .
- ١ ٣- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١ ، حيث R^2 عبارة عن aryl أو aryl غير
- ٢ متجانس؛ أو aryl أو aryl غير متجانس وكل منهما بها استبدال بواسطة :
- ٣ halogen, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-
- ٤ C_4 alkynyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, phenoxy, C_1-C_4 alkylthio, C_1-
- ٥ C_4 alkylsulfinyl, C_1-C_4 alkylsulfonyl, C_1-C_4 haloalkylthio, C_1-C_4 haloalkylsulfinyl,
- ٦ C_1-C_4 haloalkylsulfonyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_4 alkylsulfonyloxy, C_1-
- ٧ C_4 haloalkylsulfonyloxy, C_1-C_4 alkoxy C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 alkylthio C_1-C_4 alkyl, C_1-
- ٨ C_4 alkylsulfinyl C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 alkylsulfonyl C_1-C_4 alkyl, nitro, cyano, thiocyano,
- ٩ hydroxy, amino, C_1-C_6 alkylamino, C_1-C_6 dialkylamino, C_3-C_6 cycloalkylamino,

morpholino, thiomorpholino, C ₁ -C ₆ alkylcarbonylamino, C ₁ -	١٠
C ₆ alkoxycarbonylamino, C ₃ -C ₆ alkenyloxy carbonylamino, C ₃ -	١١
C ₆ alkynyloxy carbonylamino, C ₁ -C ₆ alkylaminocarbonylamino, di(C ₁ -	١٢
C ₆ alkyl)aminocarbonylamino, formyl, C ₁ -C ₆ alkylcarbonyl, C ₂ -C ₆ alkenylcarbonyl,	١٣
C ₂ -C ₆ alkynylcarbonyl, carboxy, C ₁ -C ₆ alkoxycarbonyl, C ₃ -C ₆ alkenyloxy carbonyl,	١٤
C ₃ -C ₆ alkynyloxy carbonyl, carboxamido, C ₁ -C ₆ alkylaminocarbonyl, di(C ₁ -	١٥
C ₆ alkyl)aminocarbonyl, C ₁ -C ₆ alkylcarbonyloxy, C ₁ -C ₆ alkylaminocarbonyloxy,	١٦
di(C ₁ -C ₆ alkyl)aminocarbonyloxy or C ₁ -C ₆ alkylthiocarbonylamino.	١٧

١ -٤- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١، حيث R² عبارة عن aryl أو aryl غير

٢ متجانس أو aryl أو aryl غير متجانس كل منها بها استبدال بواسطة :

halogen, C ₁ -C ₄ alkyl, C ₁ -C ₄ haloalkyl, phenoxy, C ₂ -C ₄ alkenyl, C ₂ -C ₄ haloalkenyl,	٣
C ₂ -C ₄ alkynyl, C ₁ -C ₄ alkoxy, C ₁ -C ₄ haloalkoxy, C ₁ -C ₄ alkylthio, C ₁ -C ₄ alkylsulfinyl,	٤
C ₁ -C ₄ alkylsulfonyl, C ₁ -C ₄ haloalkylthio, C ₁ -C ₄ haloalkylsulfinyl, C ₁ -	٥
C ₄ haloalkylsulfonyl, nitro or cyano.	٦

١ -٥- مركبات طبقاً لعنصر الحماية ٤، حيث R² عبارة عن :

phenyl, thienyl, furyl, pyrrolyl, isoxazolyl, oxazolyl, isothiazolyl, thiazolyl,	٢
pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl,	٣
triazinyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl and pyridazinyl, and N-oxides	٤

- ٥ و أملاح منها، حيث أن هذه الحلقات لا يكون بها استبدال أو بها استبدال بواسطة :
- ٦ halogen, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₂-C₄alkenyl, C₂-C₄haloalkenyl, C₂-
- ٧ C₄alkynyl, C₁-C₄alkoxy, C₁-C₄haloalkoxy, C₁-C₄alkylthio, C₁-C₄alkylsulfinyl,
- ٨ C₁-C₄alkylsulfonyl, C₁-C₄haloalkylthio, C₁-C₄haloalkylsulfinyl, C₁-
- ٩ C₄haloalkylsulfonyl, nitro or cyano
- ١ ٦- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١، حيث R² عبارة عن phenyl أو pyridyl ؛ أو
- ٢ phenyl أو pyridyl وكل منهما بها استبدال بواسطة halogen أو nitro أو cyano أو
- ٣ C₁-C₂ alkyl أو haloalkyl C₁-C₂ أو alkoxy C₁-C₂ أو haloalkoxy C₁-C₂ .
- ١ ٧- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١، حيث R³ عبارة عن hydrogen أو halogen أو
- ٢ . alkyl C₁-C₆
- ١ ٨- مركبات طبقاً لعنصر الحماية رقم ١، حيث R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷، كل منها على حدة
- ٢ تكون :
- ٣ hydrogen, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkoxyC₁-C₄ alkyl, C₁-
- ٤ C₄alkylthioC₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylsulfinylC₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylsulfonylC₁-
- ٥ C₄alkyl; C₅-C₇cycloalkyl or C₅-C₇cycloalkyl
- ٦ بها استبدال بواسطة :
- ٧ methylene مجموعة استبدال والتي فيها يتم استبدال C₁- or C₂alkyl or C₁- or C₂haloalkyl

- ٨ بشكل اختياري بواسطة ذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl أو مجموعة
- ٩ sulfonyl ؛ alkyl C₁-C₅ cycloalkyl C₁-C₇ أو alkyl C₁-C₅ cycloalkyl C₇-C₅
- ١٠ بها استبدال بواسطة alkyl C₁-C₂ أو C₁- أو haloalkyl C₂ والتي يتم فيها استبدال
- ١١ مجموعة methylene اختياريًا بواسطة ذرة oxygen أو ذرة كبريت sulfur أو sulfinyl
- ١٢ أو مجموعة sulfonyl .

- ١ -٩ مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷، كل منها على حدة،
- ٢ تكون hydrogen أو alkyl C₁-C₂ أو haloalkyl C₁-C₂ أو alkoxy C₁-C₂-
- ٣ alkyl .

- ١ -١٠ مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث Y عبارة عن O أو S أو C=O.

- ١ -١١ مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث أن المجموعة المؤخرة للمفعول G تكون عبارة
- ٢ عن C(X^a)-R^a أو C(X^b)-X^c-R^b، حيث X^a و X^b و X^c عبارة عن oxygen و R^a عبارة عن
- ٣ alkyl C₁-C₃ أو alkenyl C₂-C₆ أو alkynyl C₂-C₆ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو C₁-C₄
- ٤ alkoxy alkyl C₁-C₄ و R^b عبارة عن alkyl C₁-C₆ أو alkenyl C₃-C₆ أو alkenyl C₃-C₆
- ٥ أو cycloalkyl C₃-C₆ أو alkoxy C₁-C₄ alkyl C₁-C₄ .

- ١ -١٢ مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث G عبارة عن هيدروجين أو فلز قلوي alkali
- ٢ metal أو فلز أرضي قلوي.

١ ١٣- مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١٢، حيث G عبارة عن hydrogen.

١ ١٤- مركبات طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث R^1 عبارة عن alkyl C_1-C_4 و R^2 عبارة عن

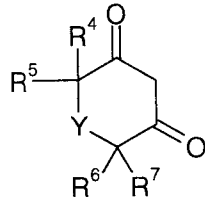
٢ phenyl أو مجموعة phenyl بها استبدال بواسطة halogen أو alkyl C_1-C_4 و R^3

٣ عبارة عن hydrogen ، R^4 و R^5 و R^6 و R^7 ، كل منهما على عبارة عن تكون C_1-C_2

٤ alkyl و Y عبارة عن O و G عبارة عن hydrogen.

١ ١٥- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث

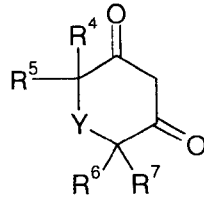
٢ G هي hydrogen ، حيث تشتمل على تفاعل مركب له الصيغة (J)



formula (J)

٤ حيث R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y لها نفس المعنى المذكور في عنصر الحماية ١، مع

٥ تراي أسيتات aryl الرصاص لها الصيغة (K)



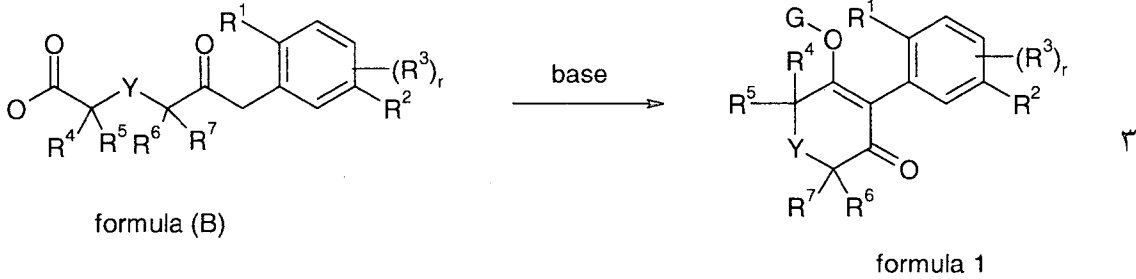
formula (J)

٧ حيث R^1 و R^2 و R^3 لها نفس المعنى المذكور في عنصر الحماية رقم ١، في وجود

٨ مركب ترابطي يشتمل على nitrogen .

١ -١٦- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث:

٢ G هي hydrogen ، حيث تتضمن جعل مركب له الصيغة (B) في صورة حلقية

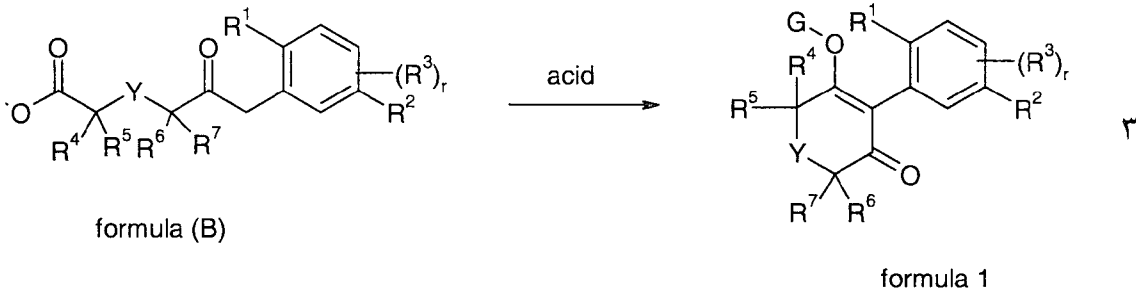


٤ حيث R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y لها نفس المعنى المذكور في عنصر

٥ الحماية رقم ١ و R عبارة عن alkyl ، في ظروف حمضية أو قاعدية.

١ -١٧- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث:

٢ G هي hydrogen ، حيث تتضمن جعل مركب له الصيغة (B) في صورة حلقية

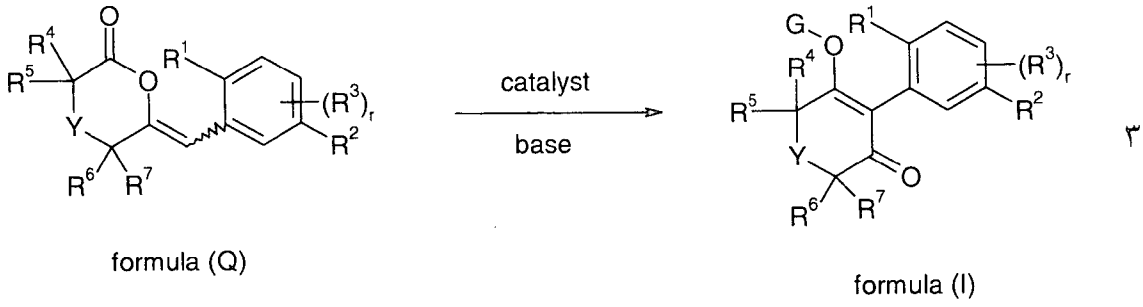


٤ حيث R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y لها نفس المعنى المذكور في عنصر

٥ الحماية رقم ١ و R عبارة عن hydrogen في ظروف حمضية.

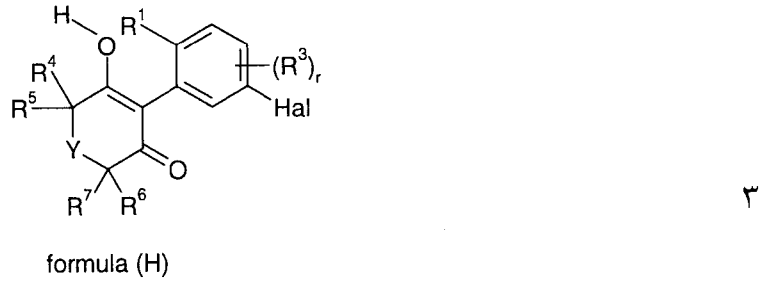
١ -١٨- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث:

٢ G هي hydrogen ، حيث تتضمن إعادة تنظيم مركب له الصيغة (Q)



- ٤ حيث R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y لها نفس المعنى المذكور في عنصر
٥ الحماية رقم ١، في وجود قاعدة وفي وجود أو في غياب محفز.

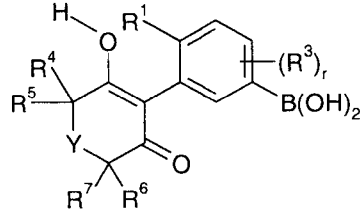
- ١ ١٩- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، والتي تشمل على
٢ تفاعل مركب له الصيغة (H)



- ٤ حيث R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y و r لها نفس المعنى المذكور في
٥ عنصر الحماية رقم ١، و Hal عبارة عن :
٦ chlorine, bromine, iodine or trifluoromethanesulfonyloxy, with an aryl- or
٧ heteroaryl boronic acid of formula $R^2B(OH)_2$,
٨ حيث يكون لـ R^2 نفس المعنى المحدد لها في عنصر الحماية ١، أو ملح أو إستر منه،
٩ في وجود محفز palladium مناسب ومركب ترابطي وقاعدة وفي مذيب مناسب.

١ -٢٠- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث تشتمل على

٢ تفاعل aryl boronic acid له الصيغة (X)



formula (X)

٤ حيث R^1 و R^2 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y و r لها نفس المعني المحدد لهم في

٥ عنصر الحماية ١، أو ملح أو إستر منها، مع مركب له الصيغة و R^2-Hal ، حيث R^2 لها

٦ نفس المعني المحدد لها في عنصر الحماية ١، و Hal عبارة عن :

٧ chlorine, bromine, iodine or trifluoromethanesulfonyloxy في وجود محفز

٨ palladium مناسب ومركب ترابطي وقاعدة وفي مذيب مناسب.

١ -٢١- عملية لتحضير مركب له الصيغة I طبقاً لعنصر الحماية ١، حيث تكون عبارة

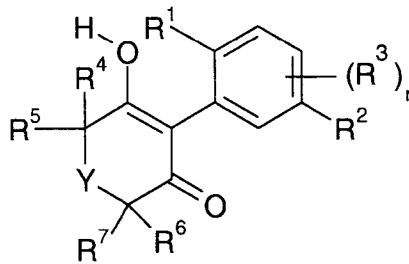
٢ عن $C(X^a)-R^a$ أو $C(X^b)-X^c-R^b$ ، حيث X^a و X^b و X^c عبارة عن oxygen و R^a عبارة عن

٣ alkyl C_1-C_3 أو alkenyl C_2-C_6 أو alkynyl C_2-C_6 أو cycloalkyl C_3-C_6 أو C_1-C_4

٤ alkoxy و alkyl C_1-C_4 و R^b عبارة عن alkyl C_1-C_6 أو alkenyl C_3-C_6 أو alkenyl C_3-C_6

٥ أو cycloalkyl C_3-C_6 أو alkoxy C_1-C_4 و alkyl C_1-C_4 ، حيث تشتمل على معالجة مركب

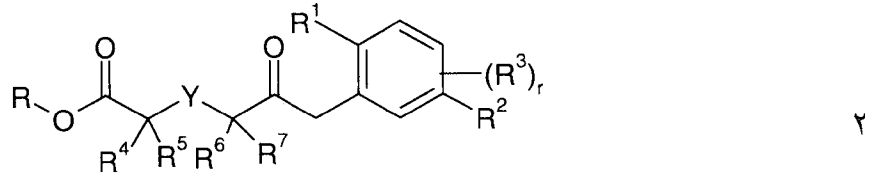
٦ له الصيغة (A)



formula (A)

٨ باستخدام عامل أسيلة في وجود أو غياب مكافئ واحد على الأقل من قاعدة.

١ ٢٢- مركبات لها الصيغة (B)



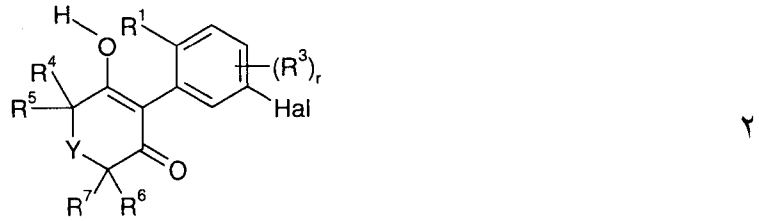
formula (B)

٣ حيث R و R¹ و R² و R³ و R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷ و Y لها نفس المعني المحدد لها في

٤ عنصر الحماية ١ حيث أن R عبارة عن hydrogen أو alkyl كما هو مذكور في عنصري

٥ الحماية ١٦ و ١٧.

١ ٢٣- مركبات لها الصيغة (H)



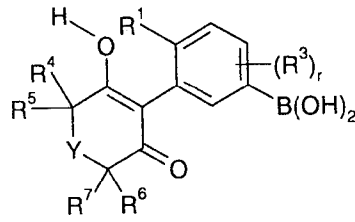
formula (H)

٣ حيث R¹ و R³ و R⁴ و R⁵ و R⁶ و R⁷ و Y لها نفس المعني المحدد لها في عنصر

٤ الحماية ١ و Hal عبارة عن :

٥ chlorine, bromine, iodine or trifluoromethanesulfonyloxy

١ -٢٤- مركب له الصيغة (X)



formula (X)

- ٣ حيث R^1 و R^3 و R^4 و R^5 و R^6 و R^7 و Y و r لها نفس المعنى المحدد لها في عنصر الحماية ١، أو ملح أو إستر منه، مع مركب له الصيغة R^2 -Hal ، حيث R^2 لها نفس المعنى المحدد لها في عنصر الحماية ١، و Hal عبارة عن chlorine أو bromine أو iodine أو trifluoromethanesulfonyloxy ،

- ١ -٢٥- طريقة لمكافحة الحشائش والأعشاب الضارة في محاصيل النباتات النافعة، حيث
٢ تشتمل على وضع كمية فعالة لإبادة الأعشاب من مركب له الصيغة I، أو من تركيبة
٣ تشتمل على مثل هذا المركب، على النباتات أو في مكانها.

- ١ -٢٦- تركيبة مبيدة للأعشاب تشتمل على، بالإضافة إلى إشتمالها على مواد للصبغة،
٢ كمية فعالة مبيدة للأعشاب من مركب له الصيغة I.

- ١ -٢٧- تركيبة طبقاً لعنصر الحماية ٢٦، حيث تشتمل على، بالإضافة إلى إشتمالها على
٢ مركب له الصيغة I، مادة أخرى مبيدة للأعشاب تخط في نفس الوقت معه.

- ١ -٢٨- تركيبة طبقاً لعنصر الحماية ٢٦، حيث تشتمل على، بالإضافة إلى إشتمالها مركب
٢ له الصيغة I، على مادة حماية.

- ١ -٢٩- تركيبة طبقاً لعنصر الحماية ٢٦، حيث تشتمل على، بالإضافة إلى إشتمالها على
٢ مركب له الصيغة I، مادة مبيدة للأعشاب تخط في نفس الوقت معه، ومادة حماية.