

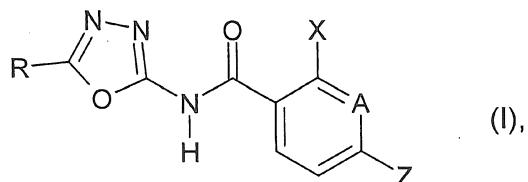


(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ 1-0022276
(51)⁷ C07D 413/04, 413/12, 413/14, 271/07, (13) B
A01N 43/82, C07F 9/653, C07D 271/113

(21) 1-2013-02947 (22) 21.03.2012
(86) PCT/EP2012/054965 21.03.2012 (87) WO2012/126932 27.09.2012
(30) 11159115.2 22.03.2011 EP
(45) 25.11.2019 380 (43) 25.12.2013 309
(73) BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH (DE)
Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, Germany
(72) KOHN, Arnim (DE), AHRENS, Hartmut (DE), BRAUN, Ralf (DE), DORNER-
RIEPING, Simon (DE), LEHR, Stefan (DE), HEINEMANN, Ines (DE), HAUSER-
HAHN, Isolde (DE), GATZWEILER, Elmar (DE), ROSINGER, Christoper, Hugh
(GB)
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT N-(1,3,4-OXADIAZOL-2-YL)ARYLCARBOXAMIT, CHẾ PHẨM
DIỆT CỎ CHÚA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRÙ THỰC VẬT
KHÔNG MONG MUỐN NHỜ SỬ DỤNG HỢP CHẤT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất N-(1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có
công thức chung (I):



trong đó, A là nitơ hoặc CY. Mỗi R, X, Y và z là các gốc như hydro, gốc hữu cơ
như alkyl và các gốc khác như halogen. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm diệt
cỏ chứa hợp chất này và phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn nhờ
sử dụng hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

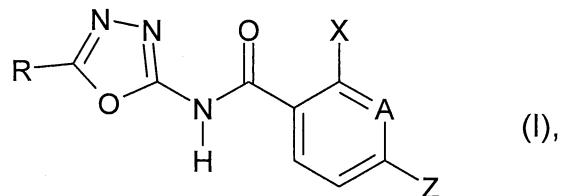
Sáng chế đề cập đến lĩnh vực kỹ thuật về thuốc diệt cỏ, cụ thể là đề cập đến thuốc diệt cỏ để phòng trừ chọn lọc cỏ dại lá rộng và cỏ dại trong tập hợp các thực vật có ích.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Theo CAS số 876870-49-4, 1024115-81-8, 920483-67-6, 1208906-74-4, 1178717-16-2 và 1178627-20-7, các hợp chất 2,4-diflo-N-(5-metyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)benzamit, 2,4-dimetyl-N-(5-phenyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)benzamit, 2,4-dimethoxy-N-(5-phenyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)benzamit, N-(5-benzyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-clo-4-flobenzamit, 2-brom-N-(5-xyclopropyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-4-flobenzamit và 4-brom-N-(5-xyclopropyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-flobenzamit là đã được biết đến. Án phẩm: Faming Zhanli Shenqing Gongkai Shuomingshu (1996), trang 17, bôc lô hợp chất 2,4-diclo-N-[5-(4-methoxyphenyl)-1,3,4-oxadiazol-2-yl]benzamit. Công bô đơn sáng chế quốc tế số WO 2010/132404 A1 bôc lô các hợp chất 2-hydroxy-4-methoxy-N-[5-(pentafloetyl)-1,3,4-oxadiazol-2-yl]benzamit và 2-axetoxy-4-metyl-N-[5-(triflometyl)-1,3,4-oxadiazol-2-yl]benzamit. Đơn yêu cầu cấp patent Mỹ số US 2009163545 A1 bôc lô N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)nicotinamit có các đặc tính dược lý. Án phẩm: Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry (1986), 25B(12), 1266-8 bôc lô 2-halo-N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)nicotinamit và 6-halo-N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)nicotinamit. Cho đến nay, không có tác dụng diệt cỏ nào của các hợp chất này được bôc lô. Patent châu Âu số EP 0 049 071 bôc lô tác dụng diệt cỏ của N-[5-(1-etyl-1-metylpropyl)-1,3,4-oxadiazol-2-yl]-2,6-dimethoxybenzamit. Công bô đơn sáng chế quốc tế số WO 2011/035674 A1 bôc lô N-(1,2,5-oxadiazol-3-yl)benzamit và sử dụng nó làm thuốc diệt cỏ.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Đặc biệt là, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng các hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit thích hợp hữu dụng làm thuốc diệt cỏ. Sáng chế đề xuất hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có công thức (I) hoặc muối của nó



trong đó, các phần tử thế được xác định như sau:

A là N hoặc CY,

R là hydro, (C₁-C₆)-alkyl, R¹O-(C₁-C₆)-alkyl, CH₂R⁶, (C₃-C₇)-xycloalkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, halo-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, halo-(C₂-C₆)-alkynyl, OR¹, NHR¹, metoxycarbonyl, etoxycarbonyl, metoxycarbonylmetyl, etoxycarbonylmetyl, methylcarbonyl, triflometylcarbonyl, dimethylamino, axethylamino, methylsulfenyl, methylsulfinyl, methylsulfonyl hoặc mỗi heteroaryl, heteroxycycl, benzyl hoặc phenyl được thế bằng s gốc từ nhóm gồm halogen, nitro, xyano, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, halo-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl,

X là nitro, halogen, xyano, formyl, thioxyanato, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, halo-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, halo-(C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-alkylheteroaryl, (C₁-C₆)-alkylheteroxycycl, trong đó mỗi gốc trong số hai gốc sau cùng

được thê bằng s gốc halogen, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, halo-(C₁-C₆)-alkoxy và trong đó heteroxcycl mang n nhóm oxo,

Y là hydro, nitro, halogen, xyano, thioxyanato, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, halo-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, halo-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkenyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-alkyl-CN, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-alkylphenyl, (C₁-C₆)-alkylheteraryl, (C₁-C₆)-alkylheteroxcycl, phenyl, heteraryl hoặc heteroxcycl, trong đó mỗi gốc trong số 6 gốc sau cùng được thê bằng s gốc từ nhóm gồm halogen, nitro, xyano, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, halo-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl và xyanometyl và trong đó heteroxcycl mang n nhóm oxo,

Z là halogen, xyano, thioxyanato, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, halo-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, halo-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, heteraryl, heteroxcycl hoặc phenyl, trong đó mỗi gốc trong số ba gốc sau cùng được thê bằng s gốc từ nhóm gồm halogen, nitro, xyano, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy hoặc halo-(C₁-C₆)-alkoxy và trong đó heteroxcycl mang n nhóm oxo hoặc

Z cũng có thể là hydro nếu Y là gốc S(O)_nR²,

R^1 là hydro, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -haloalkenyl, (C_2-C_6) -alkynyl, (C_2-C_6) -haloalkynyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_3-C_6) -xycloalkenyl, (C_3-C_6) -haloxycloalkyl, (C_1-C_6) -alkyl-O-(C_1-C_6)-alkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl-(C_1-C_6)-alkyl, phenyl, phenyl-(C_1-C_6)-alkyl, heteroaryl, (C_1-C_6) -alkylheteroaryl, heteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkylheteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkyl-O-heteroaryl, (C_1-C_6)-alkyl-O-heteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkyl-NR³-heteroaryl, (C_1-C_6)-alkyl-NR³-heteroxcyclyl, trong đó 21 gốc sau cùng được thê bằng s gốc từ nhóm bao gồm xyano, halogen, nitro, thioxyanato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ và (C_1-C_4)-alkoxy-(C_2-C_6)-alkoxycarbonyl và trong đó heteroxcyclyl mang n nhóm oxo,

R^2 là (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -haloalkenyl, (C_2-C_6) -alkynyl, (C_2-C_6) -haloalkynyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_3-C_6) -xycloalkenyl, (C_3-C_6) -haloxycloalkyl, (C_1-C_6) -alkyl-O-(C_1-C_6)-alkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl-(C_1-C_6)-alkyl, phenyl, phenyl-(C_1-C_6)-alkyl, heteroaryl, (C_1-C_6)-alkylheteroaryl, heteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkylheteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkyl-O-heteroaryl, (C_1-C_6)-alkyl-O-heteroxcyclyl, (C_1-C_6)-alkyl-NR³-heteroaryl, (C_1-C_6)-alkyl-NR³-heteroxcyclyl, trong đó 21 gốc sau cùng được thê bằng s gốc từ nhóm bao gồm xyano, halogen, nitro, thioxyanato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ và (C_1-C_4)-alkoxy-(C_2-C_6)-alkoxycarbonyl và trong đó heteroxcyclyl mang n nhóm oxo,

R^3 là hydro, (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -alkynyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl hoặc (C_3-C_6) -xycloalkyl-(C_1-C_6)-alkyl,

R^4 là (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl hoặc (C_2-C_6) -alkynyl,

R^5 là methyl hoặc etyl,

R^6 là axetoxy, acetamido, N-metylacetamido, benzyloxy, benzamido, N-methylbenzamido, metoxycarbonyl, etoxycarbonyl, benzoyl, methylcarbonyl, piperidinylcarbonyl, morpholinylcarbonyl, trifluoromethylcarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, (C_1-C_6)-alkoxy, (C_3-C_6)-xycloalkyl hoặc

mỗi heteroaryl, heteroxcycll hoặc phenyl được thể bằng s gốc từ nhóm gồm methyl, etyl, metoxy, triflometyl và halogen,

n là 0, 1 hoặc 2;

s là 0, 1, 2 hoặc 3,

với điều kiện rằng

- a) X và Z không cùng là gốc giống nhau từ nhóm gồm clo, flo, metoxy và methyl khi Y là hydro,
- b) X không phải là hydroxy khi Y là hydro và Z là metoxy,
- c) X không phải là clo hoặc brom khi Y là hydro và Z là flo,
- d) X không phải là flo khi Y là hydro và Z là brom,
- e) X hoặc Z không phải là hydro khi A là nitơ,
- f) R không phải là triflometyl khi X là axetoxy và Z là methyl.

Trong công thức (I) và tất cả các công thức sau đây, các gốc alkyl có nhiều hơn hai nguyên tử cacbon có thể là mạch thẳng hoặc mạch nhánh. Ví dụ, các gốc alkyl là methyl, etyl, n- hoặc isopropyl, n-, iso-, tert- hoặc 2-butyl, pentyl, hexyl như n-hexyl, isohexyl và 1,3,-dimethylbutyl. Halogen là flo, clo, brom hoặc iot.

Heteroxcycll là gốc vòng bão hòa, bán bão hòa hoặc không bão hòa hoàn toàn chứa từ 3 đến 6 nguyên tử vòng, trong đó từ 1 đến 4 là từ nhóm gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh và ngoài ra, gốc này có thể được dung hợp bởi vòng benzo. Ví dụ, heteroxcycll là piperidinyl, pyrrolidinyl, tetrahydrofuranyl, dihydrofuranyl và oxetanyl,

Heteroaryl là gốc vòng thơm chứa từ 3 đến 6 nguyên tử vòng, trong đó từ 1 đến 4 là từ nhóm gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh và ngoài ra, gốc này có thể được dung hợp bởi vòng benzo. Ví dụ, heteroaryl là benzimidazol-2-yl, furanyl, imidazolyl, isoxazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, pyrazinyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyridinyl, benzisoxazolyl, thiazolyl, pyrrolyl, pyrazolyl, thiophenyl, 1,2,3-oxadiazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,2,5-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,3-triazolyl, 1,2,5-

triazolyl, 1,3,4-triazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,5-thiadiazolyl, 2H-1,2,3,4-tetrazolyl, 1H-1,2,3,4-tetrazolyl, 1,2,3,4-oxatriazolyl, 1,2,3,5-oxatriazolyl, 1,2,3,4-thiatriazolyl và 1,2,3,5-thiatriazolyl.

Khi nhóm được thể nhiều lần bằng các gốc, điều này có nghĩa là nhóm này được thể bằng một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau từ các gốc đã nêu.

Theo bản chất và sự liên kết của các phần tử thể, các hợp chất có công thức chung (I) có thể có mặt dưới dạng chất đồng phân lập thể. Ví dụ, khi một hoặc nhiều nguyên tử cacbon không đối xứng có mặt, các chất đồng phân đối ảnh và chất đồng phân không đối quang có thể xuất hiện. Các chất đồng phân lập thể cũng xuất hiện khi n là 1 (sulfoxit). Các chất đồng phân lập thể có thể thu được từ hỗn hợp thu được trong điều chế theo các phương pháp tách thông thường, ví dụ các quy trình tách bằng sắc ký. Hơn nữa, cũng có thể điều chế các chất đồng phân lập thể một cách chọn lọc bằng cách sử dụng các phản ứng chọn lọc lập thể bằng cách sử dụng các nguyên liệu khởi đầu và/hoặc các chất bổ trợ có hoạt tính quang học. Sáng chế cũng đề cập đến tất cả các chất đồng phân lập thể và hỗn hợp của chúng mà được bao gồm bởi công thức chung (I) nhưng không được xác định một cách cụ thể.

Được ưu tiên một cách đặc biệt là các hợp chất có công thức chung (I), trong đó

A là N hoặc CY,

R là hydro, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₇)-xycloalkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₇)-xycloalkylmetyl, metoxycarbonylmetyl, etoxycarbonylmetyl, axethylmetyl, metoxymetyl, methoxyethyl, benzyl, pyrazin-2-yl, furan-2-yl, tetrahydrofuran-2-yl, morpholine, dimethylamino hoặc phenyl được thể bằng s gốc từ nhóm gồm methyl, methoxy, triflometyl và halogen;

X là nitro, halogen, xyano, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, OR¹, S(O)_nR², (C₁-C₆)-alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-alkyl-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-alkylheteroaryl, (C₁-C₆)-alkylheteroxycycl, trong đó mỗi gốc trong số hai gốc sau cùng được thể bằng s gốc halogen, (C₁-C₆)-alkyl, halo-(C₁-C₆)-alkyl,

$S(O)_n-(C_1-C_6)$ -alkyl, (C_1-C_6) -alkoxy, halo- (C_1-C_6) -alkoxy và trong đó heteroxcycll mang n nhóm oxo,

Y là hydro, nitro, halogen, xyano, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl, OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, $N(R^1)_2$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -alkyl- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -alkyl- OR^1 , (C_1-C_6) -alkyl- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) -alkyl- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -alkyl- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -alkyl- $NR^1SO_2R^2$, (C_1-C_6) -alkylphenyl, (C_1-C_6) -alkylheteraryl, (C_1-C_6) -alkylheteroxcycll, phenyl, heteraryl hoặc heteroxcycll, trong đó mỗi gốc trong số 6 gốc sau cùng được thế bằng s gốc từ nhóm gồm halogen, nitro, xyano, (C_1-C_6) -alkyl, halo- (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, $S(O)_n-(C_1-C_6)$ -alkyl, (C_1-C_6) -alkoxy, halo- (C_1-C_6) -alkoxy, (C_1-C_6) -alkoxy- (C_1-C_4) -alkyl và xyanometyl và trong đó heteroxcycll mang n nhóm oxo,

Z là halogen, xyano, nitro, methyl, halo- (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, $S(O)_nR^2$, 1,2,4-triazol-1-yl, pyrazol-1-yl hoặc

Z cũng có thể là hydro nếu Y là gốc $S(O)_nR^2$,

R^1 là hydro, (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -alkynyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl- (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -alkyl-O- (C_1-C_6) -alkyl, phenyl, phenyl- (C_1-C_6) -alkyl, heteraryl, (C_1-C_6) -alkylheteraryl, heteroxcycll, (C_1-C_6) -alkylheteroxcycll, (C_1-C_6) -alkyl-O-heteraryl, (C_1-C_6) -alkyl-O-heteroxcycll, (C_1-C_6) -alkyl-NR³-heteraryl hoặc (C_1-C_6) -alkyl-NR³-heteroxcycll, trong đó 16 gốc sau cùng được thế bằng s gốc từ nhóm bao gồm xyano, halogen, nitro, OR^3 , $S(O)_nR^4$, $N(R^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , $OCOR^3$, NR^3COR^3 , $NR^3SO_2R^4$, CO_2R^3 , $CON(R^3)_2$ và (C_1-C_4) -alkoxy- (C_2-C_6) -alkoxycarbonyl và trong đó heteroxcycll mang n nhóm oxo,

R^2 là (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl hoặc (C_3-C_6) -xycloalkyl- (C_1-C_6) -alkyl, trong đó mỗi gốc trong số ba gốc này được thế bằng s gốc từ nhóm bao gồm halogen và OR^3 ,

R^3 là hydro hoặc (C_1-C_6) -alkyl,

R^4 là (C_1-C_6) -alkyl,

n là 0, 1 hoặc 2;

s là 0, 1, 2 hoặc 3,

với điều kiện rằng

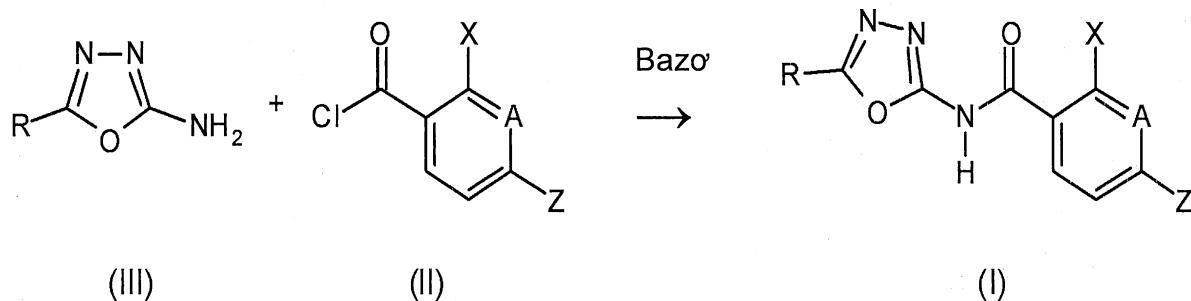
- a) X và Z không cùng là gốc giống nhau từ nhóm gồm clo, flo, metoxy và methyl khi Y là hydro,
- b) X không phải là hydroxyl khi Y là hydro và Z là metoxy,
- c) X không phải là clo hoặc brom khi Y là hydro và Z là flo,
- d) X không phải là flo khi Y là hydro và Z là brom,
- e) X hoặc Z không phải là hydro khi A là nitơ,
- f) R không phải là triflometyl khi X là axetoxy và Z là methyl.

Trong tất cả các công thức được nêu dưới đây, các phần tử thế và các ký hiệu có định nghĩa tương tự như trong công thức (I), trừ phi được xác định khác.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế, ví dụ, bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 1, bằng phản ứng có xúc tác bazơ của benzoyl hoặc nicotinyl clorua (II) với 2-amino-1,3,4-oxadiazol (III):

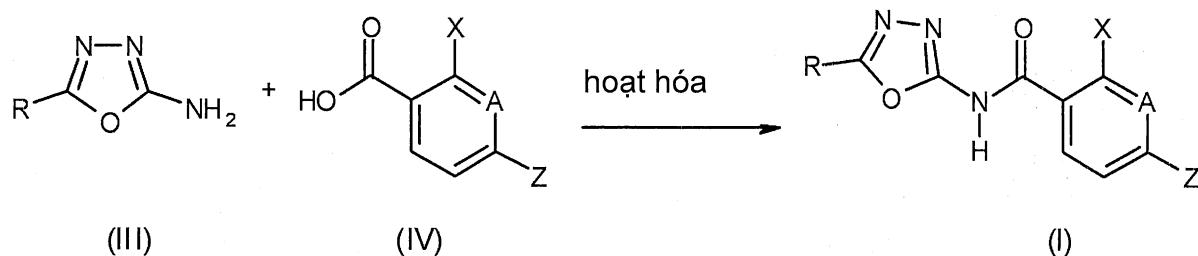
Sơ đồ 1



Benzoyl clorua có công thức (II) hoặc axit benzoic gốc của nó đã được biết đến nói chung và có thể được điều chế, ví dụ, bằng các phương pháp được mô tả trong patent Mỹ số US 6,376,429 B1, đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EP 1 585 742 A1 và EP 1 202 978 A1.

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được điều chế bằng phương pháp được mô tả trong sơ đồ 2, bằng cách cho axit benzoic hoặc nicotinic có công thức (IV) phản ứng với 2-amino-1,3,4-oxadiazol (III):

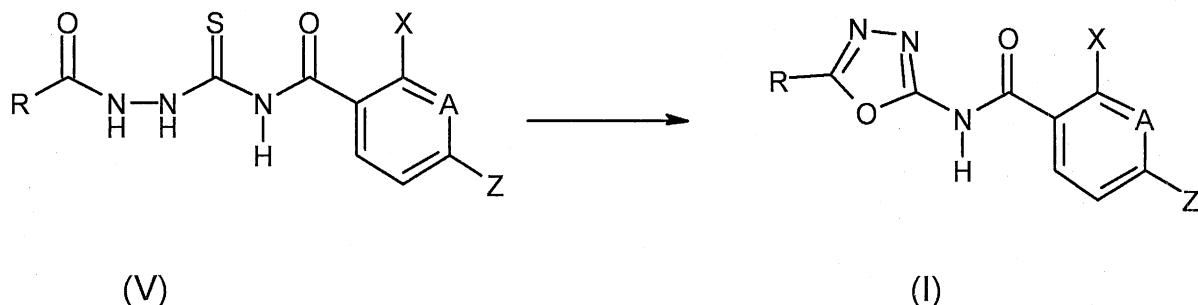
Sơ đồ 2



Để hoạt hóa, có thể sử dụng chất phản ứng khử nước mà thường được sử dụng cho phản ứng amin hóa, ví dụ 1,1'-carbonyldiimidazol (CDI), dixyclohexylcarbodiimide (DCC), 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinan 2,4,6-trioxit (T3P) v.v.

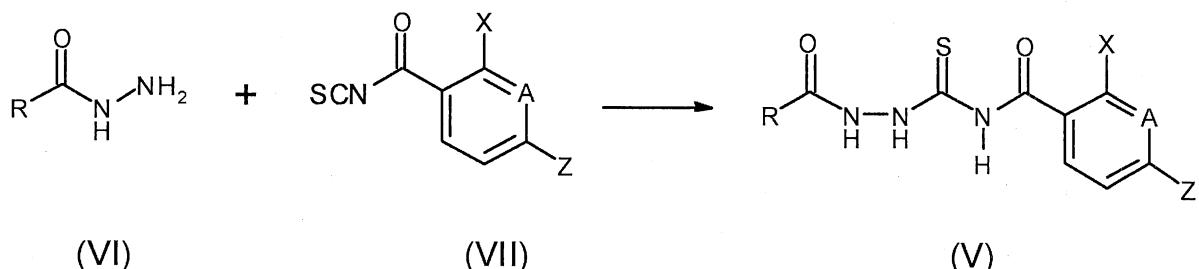
Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được điều chế bằng phương pháp được mô tả trong sơ đồ 3, bằng cách đóng vòng hợp chất có công thức V:

Sơ đồ 3



Sự đóng vòng được thực hiện bằng các phương pháp được mô tả trong án phẩm: Synth. Commun. 31 (12), 1907-1912 (2001) hoặc trong án phẩm: Indian J. Chem., Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry; Tập 43 (10), 2170-2174 (2004).

Sơ đồ 4



Hợp chất có công thức V được sử dụng trong sơ đồ 3 có thể được điều chế bằng phản ứng của axyl isoxyanat có công thức VII với hydrazit có công thức VI bằng phương pháp được mô tả trong án phẩm: Synth. Commun. 25(12), 1885-1892 (1995).

Có thể thích hợp để thay đổi trình tự các bước của phản ứng. Ví dụ, các axit benzoic mang sulfoxit có thể được chuyển hóa trực tiếp thành các clorua axit của chúng. Một tùy chọn trong bản mô tả sáng chế này là thứ nhất điều chế amit đến giai đoạn thioete và sau đó oxy hóa thioete thành sulfoxit.

Tập hợp các hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó mà có thể được tổng hợp bằng các phản ứng được nêu trên đây cũng có thể được điều chế theo cách song song, trong đó trường hợp này có thể được kết thúc theo cách thủ công, tự động một phần hoặc tự động hoàn toàn. Ví dụ, trong bản mô tả sáng chế này có thể tự động thực hiện phản ứng, xử lý hoặc tinh chế các sản phẩm và/hoặc các chất trung gian. Nói chung, điều này được hiểu có nghĩa là quy trình như được mô tả, ví dụ, ở D. Tiebes trong án phẩm: Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (người biên tập: Günther Jung), Wiley, 1999, các trang từ 1 đến 34.

Để thực hiện phản ứng và xử lý một cách song song, có thể sử dụng nhiều dụng cụ hiện có bán sẵn trên thị trường, ví dụ các khối phản ứng Calypso của Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA hoặc các trạm phản ứng của Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, England hoặc MultiPROBE Automated Workstations của PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Để tinh chế song song hợp chất có công thức (I) và muối của nó hoặc các chất trung gian mà xuất hiện trong quá trình điều chế, các thiết bị có sẵn bao gồm các thiết bị sắc ký, ví dụ của ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Các thiết bị được chi tiết hóa dẫn đến quy trình dạng mô đun, trong đó các bước hoạt động riêng rẽ được tự động hóa, nhưng cần vận hành thủ công giữa các bước hoạt động. Điều này có thể tránh được bằng cách sử dụng các hệ thống tự động liền khối từng phần hoặc hoàn toàn, trong đó các mô đun tự động tương ứng được vận hành, ví dụ bằng thiết bị tự động. Các hệ thống tự động thuộc loại này có thể được mua, ví dụ, từ Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA.

Việc thực hiện một hoặc nhiều bước tổng hợp có thể được trợ giúp bằng cách sử dụng nhựa chất phản ứng/chất chống muối mang trên polyme. Tài liệu chuyên ngành mô tả nhiều phương pháp thử nghiệm, ví dụ trong ấn phẩm: ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Ngoài các phương pháp được mô tả trong bản mô tả sáng chế này, các hợp chất có công thức chung (I) và muối của nó có thể được điều chế hoàn toàn hoặc một phần bằng các phương pháp mang trên pha rắn. Đối với mục đích này, các chất trung gian riêng rẽ hoặc tất cả các chất trung gian trong tổng hợp hoặc tổng hợp được làm thích ứng đối với quy trình tương ứng được gắn kết với nhựa tổng hợp. Phương pháp tổng hợp mang trên pha rắn được mô tả thích hợp trong tài liệu kỹ thuật, ví dụ Barry A. Bunin trong ấn phẩm: "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998 và Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (người biên tập: Günther Jung), Wiley, 1999. Việc sử dụng phương pháp tổng hợp mang trên pha rắn cho phép nhiều phương pháp đã biết từ tài liệu chuyên ngành và các phương pháp lần nữa có thể được thực hiện thủ công hoặc theo cách tự động. Các phản ứng có thể được thực hiện, ví dụ bằng các phương tiện công nghệ IRORI trong thiết bị phản ứng siêu nhỏ từ hãng Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA.

Trên pha rắn hoặc trong pha lỏng, việc thực hiện một hoặc nhiều bước có thể được trợ giúp bởi việc sử dụng công nghệ vi sóng. Tài liệu kỹ thuật mô tả nhiều phương pháp thử nghiệm, ví dụ ấn phẩm: Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (người biên tập: C. O. Kappe và A. Stadler), Wiley, 2005.

Việc điều chế theo các quy trình được mô tả trong bản mô tả sáng chế này thu được hợp chất có công thức (I) và muối của nó ở dạng tập hợp chất, mà được gọi là

thư viện. Sáng chế cũng đề xuất thư viện bao gồm ít nhất hai hợp chất có công thức (I) và muối của nó.

Các hợp chất theo sáng chế có công thức (I) (và/hoặc muối của nó), sau đây được gọi chung là "hợp chất theo sáng chế", có hiệu quả diệt cỏ tuyệt vời diệt phổ rộng các thực vật gây hại hàng năm có một lá mầm và có hai lá mầm quan trọng về mặt kinh tế. Các hoạt chất cũng khả năng sự phòng trừ tốt các thực vật dạng cỏ dại lâu năm mà khó phòng trừ và tạo ra chồi non từ thân rễ, thân rễ hoặc các cơ quan lâu năm khác.

Do đó, sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn hoặc điều hòa sinh trưởng thực vật, tốt hơn là trong các vụ thu hoạch của thực vật, trong đó một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế được áp dụng cho thực vật (ví dụ thực vật dạng cỏ dại như cỏ dại có một lá mầm hoặc có hai lá mầm hoặc thực vật không mong muốn), cho hạt giống (ví dụ, hạt, hạt giống hoặc cành giâm sinh dưỡng như thân củ hoặc phần cành có chồi non) hoặc cho khu vực mà ở đó thực vật phát triển (ví dụ khu vực trồng trọt). Hợp chất theo sáng chế có thể được triển khai ví dụ, trước khi gieo hạt (nếu thích hợp cũng bằng cách kết hợp vào đất), trước khi nảy mầm hoặc sau khi nảy mầm. Các ví dụ cụ thể về một số đại diện của hệ thực vật dạng cỏ dại có một lá mầm và có hai lá mầm mà có thể được phòng trừ bởi hợp chất theo sáng chế là như sau, mặc dù sự liệt kê là không nhằm mục đích tạo ra giới hạn đến các loài cụ thể:

Các thực vật gây hại có một lá mầm thuộc giống: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Cây lúa miến.

Các cỏ dại có hai lá mầm thuộc giống: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa,

Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Nếu hợp chất theo sáng chế được áp dụng vào bề mặt đất trước khi nảy mầm, hạt giống cỏ dại được ngăn ngừa hoàn toàn khỏi nảy mầm hoặc cỏ dại phát triển cho đến khi chúng đạt đến giai đoạn lá mầm, nhưng sau đó bị ngừng phát triển và, cuối cùng là, sau từ ba đến bốn tuần đi qua, chết hoàn toàn.

Nếu hoạt chất được áp dụng sau nảy mầm cho các phần có màu xanh của thực vật, cũng có sự ngừng phát triển sau khi xử lý và thực vật gây hại vẫn ở giai đoạn phát triển trong thời gian áp dụng hoặc chúng chết hoàn toàn sau khoảng thời gian nhất định, sao cho sự cạnh tranh bởi cỏ dại, mà có hại đối với cây trồng, do đó được loại trừ rất sớm và theo cách duy trì.

Mặc dù hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời chống lại cỏ dại có một lá mầm và có hai lá mầm, tập hợp cây trồng quan trọng về mặt kinh tế, ví dụ cây trồng có hai lá mầm thuộc giống Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia hoặc cây trồng có một lá mầm thuộc giống Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Cây lúa miến, Triticale, Triticum, Zea, đặc biệt là Zea và Triticum, nếu có tổn hại thì chỉ bị tổn hại ở mức độ không đáng kể, phụ thuộc vào cấu trúc của hợp chất tương ứng theo sáng chế và tỷ lệ áp dụng hợp chất này. Đối với các mục đích này, hợp chất theo sáng chế rất thích hợp để phòng trừ có chọn lọc sự phát triển của thực vật không mong muốn trong tập hợp cây trồng như các thực vật hữu ích về mặt nông nghiệp hoặc cây cảnh.

Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế (phụ thuộc vào cấu trúc cụ thể của chúng và tỷ lệ áp dụng được triển khai) có các đặc tính điều hòa sự phát triển đáng chú ý ở cây trồng. Chúng can thiệp vào sự trao đổi chất của thực vật với tác dụng điều chỉnh và do đó có thể được sử dụng để kiểm soát các sâu tử thực vật và tạo thuận lợi cho thu hoạch, ví dụ bằng cách gây khô và kìm hãm phát triển. Ngoài ra, chúng cũng thích hợp để phòng trừ và ức chế chung sự phát triển của thực vật không mong muốn mà không

làm chết cây. Việc úc chế sự phát triển của thực vật đóng vai trò chủ yếu đối với nhiều cây trồng có một lá mầm và có hai lá mầm, do, ví dụ, điều này có thể làm giảm hoặc ngăn ngừa lưu trú hoàn toàn.

Nhờ các đặc tính diệt cỏ và điều hòa sinh trưởng thực vật của chúng, hoạt chất cũng có thể được sử dụng để phòng trừ các thực vật gây hại trong vụ thu hoạch của thực vật được biến đổi gen hoặc thực vật được biến đổi bằng cách đột biến gen thông thường. Nói chung, thực vật chuyển gen đáng chú ý ở các đặc tính thuận lợi đặc biệt, ví dụ kháng với một số thuốc diệt sinh vật gây hại nhất định, cụ thể là một số thuốc diệt cỏ, kháng các bệnh thực vật hoặc kháng sinh vật gây bệnh thực vật, như một số côn trùng hoặc vi sinh vật như nấm, vi khuẩn hoặc virút. Các đặc tính cụ thể khác liên quan đến, ví dụ, vật liệu sau thu hoạch về mặt số lượng, chất lượng, khả năng bảo quản, thành phần và cấu phần đặc biệt. Ví dụ, các thực vật chuyển gen đã biết là có hàm lượng tinh bột cao hoặc chất lượng tinh bột thay đổi hoặc có thành phần axit béo khác trong vật liệu thu hoạch.

Đối với cây chuyển gen, ưu tiên được đưa ra là sử dụng hợp chất theo sáng chế trong các vụ thu hoạch của thực vật hữu ích hoặc cây cảnh chuyển gen quan trọng về mặt kinh tế, ví dụ về các cây ngũ cốc như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, cây kê/cây lúa miến, lúa gạo và ngô hoặc vụ thu hoạch khác của củ cải đường, bông, đậu nành, cải hạt có dầu, khoai tây, cà chua, đậu Hà lan và các thực vật khác. Tốt hơn là, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng làm thuốc diệt cỏ trong tập hợp cây trồng hữu ích mà có sức kháng hoặc đã được tạo sức kháng bằng các phương pháp tái tổ hợp, với các tác động độc tố thực vật của thuốc diệt cỏ.

Được ưu tiên là sử dụng hợp chất theo sáng chế hoặc muối của nó trong các vụ thu hoạch của thực vật hữu ích và cây cảnh chuyển gen quan trọng về mặt kinh tế, ví dụ về cây ngũ cốc như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, cây kê/cây lúa miến, lúa gạo, sắn và ngô hoặc các vụ thu hoạch khác của củ cải đường, bông, đậu nành, cải hạt dầu, khoai tây, cà chua, đậu Hà lan và các thực vật khác. Tốt hơn là, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng làm thuốc diệt cỏ trong các vụ thu hoạch của thực vật hữu ích mà có sức kháng hoặc đã được tạo sức kháng bằng các phương pháp tái tổ hợp, với các tác động độc tố thực vật của thuốc diệt cỏ.

Các phương pháp thông thường để tạo ra thực vật mới mà có các đặc tính được biến đổi so với các thực vật mà đã xuất hiện cho đến nay bao gồm, ví dụ, các phương pháp tạo giống truyền thống và phát sinh đột biến. Theo cách khác, thực vật mới có các đặc tính được biến đổi có thể được tạo ra với sự trợ giúp của các phương pháp tái tổ hợp (xem, ví dụ, đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EP-A-0221044, EP-A-0131624). Ví dụ, đã có nhiều mô tả về:

- các biến đổi tái tổ hợp của cây trồng nhằm mục đích làm biến đổi tinh bột được tổng hợp ở thực vật (ví dụ, công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
- cây trồng chuyển gen mà kháng các thuốc diệt cỏ cụ thể thuộc loại glufosinat (tham chiếu đến, ví dụ, đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EP-A-0242236, EP-A-242246) hoặc loại glyphosat (công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 92/00377) hoặc thuộc loại sulfonylure (đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EP-A-0257993, đơn yêu cầu cấp patent Mỹ số US-A-5013659),
- cây trồng chuyển gen, ví dụ bông, có khả năng tạo ra độc tố Bacillus thuringiensis (độc tố Bt) mà làm cho thực vật kháng các sinh vật gây hại cụ thể (đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- cây trồng chuyển gen có thành phần axit béo thay đổi (công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 91/13972),
- cây trồng biến đổi gen có các cấu tử mới hoặc chất chuyển hóa thứ cấp, ví dụ chất kháng độc thực vật mới, mà gây kháng bệnh gia tăng (đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EPA 309862, EPA0464461),
- thực vật biến đổi gen có quang hô hấp giảm, mà có sản lượng cao hơn và dung nạp ứng suất cao hơn (đơn yêu cầu cấp patent châu Âu số EPA 0305398),
- cây trồng chuyển gen mà tạo ra protein quan trọng về mặt dược phẩm hoặc về mặt chẩn đoán ("phân tử tạo dược phẩm"),
- cây trồng chuyển gen mà nhận thấy sản lượng cao hơn hoặc chất lượng tốt hơn,

- cây trồng chuyển gen mà nhận thấy sự kết hợp, ví dụ, các đặc tính mới được nêu trên đây ("gen tạo khôi lượng lớn").

Nhiều công nghệ sinh học phân tử mà có thể được sử dụng để tạo ra thực vật chuyển gen mới với các đặc tính được biến đổi là đã được biết đến nói chung; xem, ví dụ, I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.), Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg or Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Đối với các thao tác tái tổ hợp này, các phân tử axit nucleic mà cho phép đột biến gen hoặc thay đổi trình tự bằng cách tái tổ hợp trình tự ADN có thể được đưa vào plasmid. Với sự trợ giúp của các phương pháp tiêu chuẩn, có thể, ví dụ, thực hiện các thay đổi cơ bản, loại bỏ các phần của trình tự hoặc bổ sung các trình tự tự nhiên hoặc tổng hợp. Để nối các đoạn ADN với nhau, có thể bổ sung cầu nối hoặc cầu liên kết vào các đoạn này; xem, ví dụ, Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; hoặc Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim, 2nd edition, 1996.

Có thể đạt được việc tạo ra tế bào thực vật có hoạt tính sản phẩm gen giảm, ví dụ, bằng cách biểu hiện ít nhất một ARN nghĩa ngược thích hợp hoặc ARN nghĩa thuận để đạt được tác dụng cùng ngăn chặn hoặc biểu hiện ít nhất một ribozym được tạo cấu trúc thích hợp tách đặc hiệu các bản sao của sản phẩm gen được nêu trên đây. Đối với mục đích này, thứ nhất có thể sử dụng các phân tử ADN mà bao gồm toàn bộ trình tự mã hóa của sản phẩm gen bao gồm các trình tự sườn có mặt hoặc các phân tử ADN khác mà chỉ bao gồm các phần trình tự mã hóa, trong trường hợp đó các phần này phải đủ dài để mang về tác dụng nghĩa ngược vào tế bào. Cũng có thể sử dụng trình tự ADN mà có mức tương đồng cao với trình tự mã hóa của sản phẩm gen, nhưng không phải là giống nhau hoàn toàn.

Khi biểu hiện các phân tử axit nucleic ở thực vật, protein được tổng hợp có thể được khu biệt trong khoang mong muốn bất kỳ của tế bào thực vật. Tuy nhiên, để đạt được sự khu biệt trong khoang cụ thể, ví dụ, có thể kết hợp vùng mã hóa vào trình tự ADN mà bảo đảm sự khu biệt trong khoang cụ thể. Các trình tự này là đã được biết đến đối với chuyên gia trong lĩnh vực này (xem, ví dụ, Braun et al., EMBO J. 11

(1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Các phân tử axit nucleic cũng có thể được biểu hiện trong hạt cơ quan của tế bào thực vật.

Tế bào thực vật chuyển gen có thể được sinh ra bằng các kỹ thuật đã biết để thu được toàn bộ thực vật. Nói chung, thực vật chuyển gen có thể là thực vật thuộc loài thực vật mong muốn bất kỳ, nghĩa là cả thực vật có một lá mầm và có hai lá mầm.

Do đó, có thể thu được thực vật chuyển gen mà các đặc tính của nó thay đổi bằng cách biểu hiện quá mức, ngăn chặn hoặc ức chế các gen tương đồng (= tự nhiên) hoặc trình tự gen hoặc biểu hiện gen khác loại (= bên ngoài) hoặc trình tự gen.

Tốt hơn là, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng cho cây trồng chuyển gen mà kháng các chất điều hòa sự phát triển, ví dụ dicamba hoặc kháng thuốc diệt cỏ mà ức chế các enzym thực vật thiết yếu, ví dụ axetolactat synthaza (ALS), EPSP synthaza, glutamin synthaza (GS) hoặc hydroxyphenylpyruvat dioxygenaza (HPPD) hoặc kháng thuốc diệt cỏ từ nhóm gồm sulfonylure, glyphosat, glufosinat hoặc benzoylisoxazol và các hoạt chất tương đương.

Đối với việc dùng hoạt chất của sáng chế cho cây trồng chuyển gen, không chỉ có tác dụng nhắm vào thực vật gây hại quan sát được trong các cây trồng khác xuất hiện, mà thường cũng là tác động mà đặc hiệu để áp dụng cho các cây trồng chuyển gen cụ thể, ví dụ phổ cỏ dại được mở rộng thay đổi hoặc đặc hiệu mà có thể được phòng trừ, tỷ lệ áp dụng thay đổi mà có thể được sử dụng để áp dụng, tốt hơn là khả năng kết hợp tốt với thuốc diệt cỏ mà cây trồng chuyển gen kháng và làm ảnh hưởng đến sự phát triển và sản lượng của cây trồng chuyển gen.

Do đó, sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng hợp chất theo sáng chế làm thuốc diệt cỏ để phòng trừ thực vật gây hại trong cây trồng chuyển gen.

Hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng ở dạng bột thấm ướt, thổi đặc nhũ hóa được, dung dịch có thể phun, sản phẩm tạo bụi hoặc hạt trong chế phẩm thông thường. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm diệt cỏ và điều hòa sinh trưởng thực vật, chế phẩm này bao gồm hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế theo các cách khác nhau, theo các thông số sinh học và/hoặc lý hóa học cần thiết. Các ví dụ về các dạng chế phẩm có thể có bao gồm: bột thấm ướt (wettable powders-WP), bột hòa tan trong nước (water-soluble powders-SP), thể đặc hòa tan trong nước, thể đặc nhũ hóa được (emulsifiable concentrates-EC), nhũ tương (emulsions-EW), như các nhũ tương dầu trong nước và nước trong dầu, dung dịch có thể phun, thể đặc huyền phù (suspension concentrates-SC), phân tán chủ yếu trên dầu hoặc nước, dung dịch trộn lẫn được với dầu, huyền phù bao nang (capsule suspensions-CS), sản phẩm tạo bụi (dusting products-DP), sản phẩm xử lý hạt, hạt để rắc và áp dụng vào đất, hạt (granules-GR) ở dạng vi hạt, hạt có thể phun, hạt bao ngoài và hạt hấp phụ, hạt phân tán trong nước (water-dispersible granules-WG), hạt hòa tan trong nước (water-soluble granules-SG), các chế phẩm ULV, vi nang và sáp.

Các dạng chế phẩm riêng rẽ này đã được biết đến nói chung và được mô tả, ví dụ, trong ấn phẩm: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th edition 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Các chất phụ trợ phối chế cần thiết, như các nguyên liệu trơ, chất hoạt động bề mặt, dung môi và các chất phụ trợ khác, cũng đã được biết đến và được mô tả, ví dụ, trong các ấn phẩm: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd ed., J. Wiley & Sons, N.Y., C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd ed., Interscience, N.Y. 1963, McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J., Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986.

Dựa trên các chế phẩm này, cũng có thể tạo ra các kết hợp với hoạt chất diệt sinh vật gây hại khác, ví dụ thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, thuốc diệt cỏ, thuốc diệt nấm

và với các chất an toàn, phân bón và/hoặc chất điều hòa sự phát triển, ví dụ ở dạng chế phẩm hoàn thành hoặc như bể trộn. Các chất an toàn thích hợp là, ví dụ, mefenpyrdietyl, xyprosulfamit, isoxadifen-etyl, cloquintoxet-mexyl và dichlormid.

Bột thám ướt là chế phẩm mà có thể được phân tán đồng đều trong nước và, ngoài hoạt chất, ngoại trừ chất pha loãng hoặc chất tro, cũng bao gồm chất hoạt động bề mặt thuộc loại ion và/hoặc không ion (chất làm ướt, chất phân tán), ví dụ alkylphenol được polyoxyethyl hóa, rượu béo được polyetoxyl hóa, amin béo được polyoxyethyl hóa, polyglycol ete rượu béo sulfat, alkansulfonat, alkylbenzensulfonat, natri lignosulfonat, natri 2,2'-dinaphthylmetan-6,6'-disulfonat, natri dibutylnaphtalensulfonat hoặc natri oleoylelmethyltaurat khác. Để tạo ra bột thám ướt, các hoạt chất của thuốc diệt cỏ được nghiền mịn, ví dụ trong các thiết bị thông thường như máy nghiền búa, máy nghiền quạt và máy nghiền phun không khí và đồng thời hoặc sau đó trộn với các chất phụ trợ chế phẩm.

Thể đặc nhũ hóa được được tạo ra bằng cách hòa tan hoạt chất trong dung môi hữu cơ, ví dụ butanol, cyclohexanon, dimethylformamit, xylen hoặc các dung môi thơm có nhiệt độ sôi tương đối cao khác hoặc hydrocacbon hoặc hỗn hợp gồm các dung môi hữu cơ, với việc bổ sung một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt ion và/hoặc không ion (chất nhũ hóa). Chất nhũ hóa có thể được sử dụng, ví dụ, là: canxi alkylarylsulfonat như canxi dodecylbenzensulfonat hoặc chất nhũ hóa không ion như polyglycol este của axit béo, alkylaryl polyglycol ete, polyglycol ete rượu béo, các sản phẩm ngưng tụ propylen oxit-etylen oxit, alkyl polyete, sorbitan este, ví dụ este của axit béo sorbitan hoặc polyoxyetylen sorbitan este, ví dụ este của axit béo polyoxyetylen sorbitan.

Sản phẩm tạo bụi thu được bằng cách nghiền hoạt chất với chất dạng rắn được phân bô mịn, ví dụ bột talc, đất sét tự nhiên, như caolanh, bentonit và pyrophylit hoặc đất diatomit. Thể đặc huyền phù có thể chủ yếu là nước hoặc dầu. Chúng có thể được tạo ra, ví dụ, bằng cách nghiền ướt bằng máy nghiền hạt có bán trên thị trường với sự bổ sung tùy ý chất hoạt động bề mặt như được nêu trên đây, ví dụ, đối với các loại chế phẩm khác. Nhũ tương, ví dụ nhũ tương dầu trong nước (oil-in-water emulsions-EW), có thể được tạo ra, ví dụ, bằng thiết bị khuấy, nghiền dạng keo và/hoặc thiết bị trộn tĩnh bằng cách sử dụng dung môi hữu cơ trong nước và tùy ý chất hoạt động bề mặt

nhiều được liệt kê trên đây, ví dụ, đối với các loại chế phẩm khác. Hạt có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên nguyên liệu trơ được tạo hạt hấp phụ hoặc bằng cách áp dụng thê đặc chúa hoạt chất bằng các phương tiện dính bám, ví dụ rượu polyvinyl, natri polyacrylat hoặc dầu khoáng, vào bề mặt của chất mang, như cát, kaolinit hoặc nguyên liệu trơ được tạo hạt. Các hoạt chất thích hợp cũng có thể được tạo hạt theo cách thông thường để tạo ra hạt phân bón - nếu muốn như hỗn hợp với phân bón. Thông thường, hạt phân tán trong nước được tạo ra bằng các quy trình thông thường như phun khô, tạo hạt kiểu tầng sôi, tạo hạt kiểu bể lắng, trộn với thiết bị trộn tốc độ cao và ép dùn mà không cần nguyên liệu trơ dạng rắn. Để sản xuất hạt kiểu bể lắng, hạt kiểu tầng sôi, hạt kiểu máy ép dùn và hạt kiểu phun, xem, ví dụ, các quy trình trong ấn phẩm: "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th ed., McGraw-Hill, New York 1973, p. 8-57. Để mô tả chi tiết hơn liên quan đến việc điều chế chế phẩm bảo vệ cây trồng, xem, ví dụ, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103.

Thông thường, các chế phẩm hóa nông chứa từ 0,1 đến 99% trọng lượng, đặc biệt là từ 0,1 đến 95% trọng lượng, của hợp chất theo sáng chế.

Trong bột thẩm ướt, nồng độ hoạt chất là, ví dụ, nằm trong khoảng từ 10 đến 90% trọng lượng; phần còn lại đến 100% trọng lượng bao gồm các cấu tử chế phẩm thông thường. Trong thê đặc nhũ hóa được, nồng độ hoạt chất có thể nằm trong khoảng từ 1 đến 90% và tốt hơn là nằm trong khoảng từ 5 đến 80% trọng lượng. Các chế phẩm dạng bụi chứa từ 1 đến 30% trọng lượng hoạt chất, tốt hơn là thường nằm trong khoảng từ 5 đến 20% trọng lượng hoạt chất; dung dịch có thể phun chứa khoảng từ 0,05 đến 80% và tốt hơn là nằm trong khoảng từ 2 đến 50% trọng lượng hoạt chất. Trong trường hợp hạt phân tán trong nước, hàm lượng hoạt chất phụ thuộc riêng phần vào hoạt chất có mặt ở dạng lỏng hoặc dạng rắn và trong đó chất phụ trợ hạt, chất làm đầy, v.v, được sử dụng. Trong hạt phân tán trong nước, hàm lượng của hoạt chất là, ví dụ, nằm trong khoảng từ 1 đến 95% trọng lượng, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 10 đến 80% trọng lượng.

Ngoài ra, chế phẩm chứa hoạt chất đã nêu tùy ý bao gồm các chất kết dính thông thường tương ứng, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất thẩm thấu, chất bảo quản, chất chống đông và các dung môi, chất làm dày, chất mang và thuốc nhuộm, chất khử tạo bọt, chất ức chế sự bay hơi và các chất mà tác động đến độ pH và độ nhớt.

Dựa trên các chế phẩm này, cũng có thể tạo ra các kết hợp với hoạt chất diệt sinh vật gây hại khác, ví dụ thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, thuốc diệt cỏ, thuốc diệt nấm và với các chất an toàn, phân bón và/hoặc chất điều hòa sự phát triển, ví dụ ở dạng chế phẩm hoàn toàn hoặc như bể trộn.

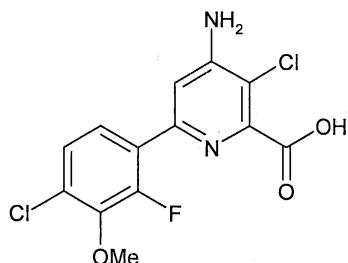
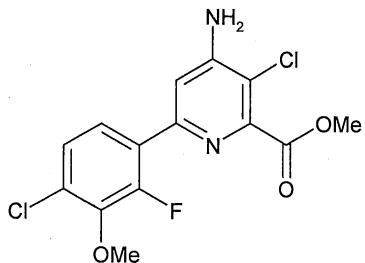
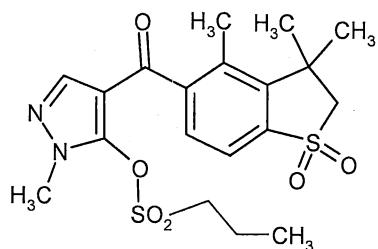
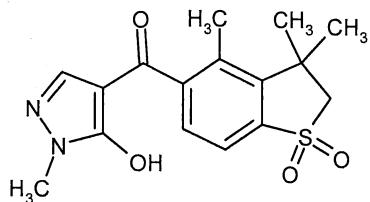
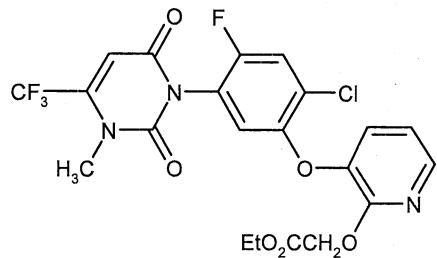
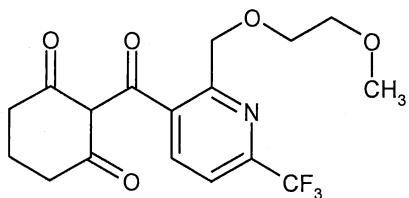
Các thành phần kết hợp tiện lợi đối với hợp chất theo sáng chế trong chế phẩm hỗn hợp hoặc trong bể trộn là, ví dụ, các hoạt chất đã biết dựa trên sự ức chế, ví dụ, axetolactat synthaza, axetyl-CoA carboxylaza, xenluloza synthaza, enolpyruvylshikimat-3-phosphat synthaza, glutamin synthetaza, p-hydroxyphenylpyruvat dioxygenaza, phytoendesaturaza, photosystem I, photosystem II, protoporphyrinogen oxidaza, như được mô tả, ví dụ, trong ấn phẩm: Weed Research 26 (1986) 441-445 hoặc "The Pesticide Manual", 15th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009 và tài liệu chuyên ngành được trích dẫn trong đó. Các ví dụ về thuốc diệt cỏ hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật đã biết mà có thể được kết hợp với hợp chất theo sáng chế bao gồm hoạt chất mà theo (các hợp chất được ký hiệu bởi tên thông thường theo Tổ chức tiêu chuẩn hóa quốc tế (International Organization for Standardization-ISO) hoặc theo tên hóa học hoặc số mã) và thường bao gồm tất cả các dạng sử dụng, như axit, muối, este và chất đồng phân, như chất đồng phân lập thể và chất đồng phân quang học. Trong danh mục này, một hoặc nếu không, trong một số trường hợp, nhiều hơn một dạng áp dụng được kể đến:

axetochlor, axibenzolar, axibenzolar-S-metyl, axifluorfen, axifluorfen-natri, aclonifen, alachlor, allidochlor, alloxydim, alloxydim-natri, ametryn, amicarbazon, amidochlor, amidosulfuron, aminoxyaclopyrachlor, aminopyralit, amitrol, amoni sulfamat, anxymidol, anilofos, asulam, atrazin, azafenidin, azimsulfuron, aziprotryn, beflubutamid, benazolin, benazolin-etyl, bencarbazon, benfluralin, benfuresat,

bensulit, bensulfuron, bensulfuron-metyl, bentazon, benzfendizon, benzobixyclon, benzofenap, benzofluor, benzoylprop, bixyclopyron, bifenoxy, bilanafos, bilanafos-natri, bispyribac, bispyribac-natri, bromaxil, brombutit, bromfenoxim, bromxynil, bromuron, buminafos, busoxinon, butachlor, butafenaxil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylat, cafenstrol, carbetamit, carfentrazon, carfentrazon-etyl, chlometoxyfen, chloramben, chlorazifop, chlorazifop-butyl, chlorbromuron, chlorbufam, chlorfenac, chlorfenac-natri, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-methyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-etyl, chlormequat-clorua, chlornitrofen, clophthalim, chlorthal-dimethyl, chlortoluron, chlorsulfuron, xinidon, xinidon-etyl, xinmetylin, xinosulfuron, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clofencet, clomazon, clomeprop, cloprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-metyl, cumyluron, xyanamit, xyanazin, xyclanilit, xycloat, xyclosulfamuron, xycloxydim, xycluron, xyhalofop, xyhalofop-butyl, xyperquat, xyprazin, xyprazol, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron/dymron, dalapon, daminozit, dazomet, n-decanol, desmedipham, desmetryn, detosyl-pyrazolat (DTP), diallat, dicamba, dichlobenil, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclofop-metyl, diclofop-P-metyl, diclosulam, diethatyl, diethatyl-etyl, difenoxyuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, diflufenzopyr-natri, dimefuron, dikegulac-natri, dimepiperat, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimethipin, dimetasulfuron, dinitramin, dinoseb, dinoterb, diphenamid, dipropetryn, diquat, diquat-dibromua, dithiopyr, diuron, DNOC, eglinazin-etyl, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethephon, ethidimuron, ethiozin, ethofumesat, etoxyfen, etoxyfen-etyl, etoxysulfuron, etobenzanid, F-5331, nghĩa là N-[2-clo-4-flo-5-[4-(3-flopropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]phenyl]etansulfonamit, F-7967, nghĩa là 3-[7-clo-5-flo-2-(triflometyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, fenoxaprop-P-etyl, fenoxasulfon, fentrazamit, fenuron, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl, fluazolat, flucarbazon, flucarbazon-natri, flucetosulfuron, fluchloralin, flufenacet (thiafluamit), flufenpyr, flufenpyr-etyl, flumetralin, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, flumipropyn, fluometuron, flodifen, floglycofen, floglycofen-etyl, flupoxam, flupropaxil,

flupropanat, fluprysulfuron, fluprysulfuron-metyl-natri, flurenol, flurenol-butyl, fluridon, flurochloridon, fluroxypyrr, fluroxypyrr-meptyl, flurprimidol, flurtamon, fluthiaxet, fluthiaxet-metyl, fluthiamit, fomesafen, foramsulfuron, forchlorfenuron, fosamin, furyloxyfen, axit gibberellic, glufosinat, glufosinat-amoni, glufosinat-P, glufosinat-P-amoni, glufosinat-P-natri, glyphosat, glyphosat-isopropylamoni, H-9201, nghĩa là O-(2,4-dimetyl-6-nitrophenyl) O-etyl isopropylphosphoramidothioat, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-etoxyethyl, haloxyfop-P-etoxyethyl, haloxyfop-metyl, haloxyfop-P-metyl, hexazinon, HW-02, nghĩa là 1-(dimetoxyphosphoryl)etyl (2,4-diclophenoxy)axetat, imazamethabenz, imazamethabenz-metyl, imazamox, imazamox-amoni, imazapic, imazapyr, imazapyr-isopropylamoni, imazaquin, imazaquin-amoni, imazethapyr, imazethapyr-amoni, imazosulfuron, inabenfit, indanofan, indaziflam, axit indoleaxetic (IAA), axit 4-indol-3-ylbutyric (IBA), iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, ioxynil, ipfencarazon, isocarbamid, isopropalin, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxachlortol, isoxaflutol, isoxapyrifop, KUH-043, nghĩa là 3-({[5-(diflometyl)-1-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-yl]metyl}sulfonyl)-5,5-dimetyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol, karbutilat, ketospiradox, lactofen, lenaxil, linuron, hydrazit maleic, MCPA, MCPB, MCPB-metyl, -etyl và -natri, mecoprop, mecoprop-natri, mecoprop-butotyl, mecoprop-P-butotyl, mecoprop-P-dimethylamoni, mecoprop-P-2-ethylhexyl, mecoprop-P-kali, mefenaxet, mefluidit, mepiquat clorua, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, methabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, metazachlor, metazasulfuron, methazol, methiopyrsulfuron, methiozolin, metoxyphenon, metyldymron, 1-metylxcyclopropen, methyl isothioxyanat, metobenzuron, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metyl, molinat, monalit, monocarbamit, monocarbamit dihydrosulfat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron este, monuron, MT-128, nghĩa là 6-clo-N-[(2E)-3-cloprop-2-en-1-yl]-5-metyl-N-phenylpyridazin-3-amin, MT-5950, nghĩa là N-[3-clo-4-(1-metyleetyl)phenyl]-2-metylpentanamit, NGGC-011, naproanilit, napropamit, naptalam, NC-310, nghĩa là 4-(2,4-diclobenzoyl)-1-metyl-5-benzyloxypyrazol, neburon, nicosulfuron, nipyraclofen, nitralin, nitrofen, nitrophenolat-natri (hỗn hợp chất đồng phân), nitrofluorfen, axit nonanoic, norflurazon, orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon,

oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paclobutrazole, paraquat, paraquat diclorua, axit pelargonic (axit nonanoic), pendimethalin, pendralin, penoxsulam, pentanochlor, pentoazon, perfluidon, pethoxamid, phenisopham, phenmedipham, phenmediphampetyl, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pirifenop, pirifenop-butyl, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-metyl, probenazol, profluazol, proxyazin, prodiamin, prifluralin, profoxydim, prohexadion, prohexadion-canxi, prohydrojasmon, prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazin, propham, propisochlor, propoxycarbazon, propoxycarbazon-natri, propyrisulfuron, propyzamit, prosulfalin, prosulfocarb, prosulfuron, prynachlor, pyraclonil, pyraflufen, pyraflufen-etyl, pyrasulfotol, pyrazolynat (pyrazolat), pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridat, pyriftalid, pyriminobac, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyrithiobac, pyrithiobac-natri, pyroxasulfone, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamin, quizalofop, quizalofop-etyl, quizalofop-P, quizalofop-P-etyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenaxil, secbumeton, setoxydim, siduron, simazin, simetryn, SN-106279, nghĩa là methyl (2R)-2-(7-[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]-2-naphthyl)oxy)propanoat, sulcotrion, sulfallat (CDEC), sulfentrazon, sulfometuron, sulfometuron-metyl, sulfosat (glyphosat-trimesium), sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, nghĩa là 1-etoxy-3-methyl-1-oxobut-3-en-2-yl 5-[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]-2-nitrobenzoat, SYP-300, nghĩa là 1-[7-flo-3-oxo-4-(prop-2-yn-1-yl)-3,4-dihydro-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-3-propyl-2-thioxoimidazolidin-4,5-dion, tebutam, tebuthiuron, tecnazen, tefuryltrion, tembotrion, tepraloxymid, terbaxil, terbucarb, terbuchlor, terbumeton, terbutylazin, terbutryn, thenylchlor, thiafluamit, thiazafluron, thiazopyr, thidiazimin, thidiazuron, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, thiobencarb, tiocarbazil, topramezon, tralkoxydim, triafamon, triallat, triasulfuron, triaziflam, triazofenamit, tribenuron, tribenuron-metyl, axit tricloaxetic (TCA), triclopyr, tridiphane, trietazin, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-natri, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, trimeturon, trinexapac, trinexapac-etyl, tritosulfuron, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, vernolat, ZJ-0862, nghĩa là 3,4-diclo-N-{2-[(4,6-dimetoxyprimidin-2-yl)oxy]benzyl}anilin và các hợp chất sau đây:



Để áp dụng, chế phẩm ở dạng có bán trên thị trường là, nếu thích hợp, được pha loãng bằng nước theo cách thông thường, ví dụ trong trường hợp bột thấm ướt, thě đặc nhũ hóa được, thě phân tán và hạt phân tán trong nước. Chế phẩm dạng bụi, hạt để áp dụng vào đất hoặc hạt để rắc và dung dịch có thě phun thường không được pha loãng tiếp với chất trơ khác trước khi áp dụng.

Tỷ lệ áp dụng cần thiết của hợp chất có công thức (I) thay đổi theo các điều kiện bên ngoài, bao gồm nhiệt độ, độ ẩm và loại thuốc diệt cỏ được sử dụng. Có thể thay đổi trong các giới hạn rộng, ví dụ nằm trong khoảng từ 0,001 đến 1,0kg/ha hoặc nhiều hoạt chất hơn, nhưng tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,005 đến 750g/ha.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ sau đây nhằm minh họa cho sáng chế.

A. Các ví dụ hóa học

1. Điều chế N-(5-benzyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-clo-4-(methylsulfonyl)-3-[(2,2,2-trifloetoxy)metyl]benzamit (Ví dụ số 6-198)

Hòa tan 90mg (0,26mmol) axit 2-clo-4-(methylsulfonyl)-3-[(2,2,2-trifloetoxy)metyl]benzoic và 45mg (0,26mmol) 5-benzyl-1,3,4-oxadiazol-2-amin trong 8ml CH₂Cl₂ ở nhiệt độ trong phòng (RT). Sau đó, thêm 248mg (0,398mmol) 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinan 2,4,6-trioxit (50% dung dịch trong THF) vào, khuấy hỗn hợp trong một giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó, thêm 0,181ml (1,3mmol) trietylamin, 6mg (0,052mmol) 4-dimethylaminopyridin vào. Sau đó, khuấy hỗn hợp trong 20 giờ ở nhiệt độ trong phòng và rửa hai lần, mỗi lần bằng 4ml nước, làm khô qua Na₂SO₄ và cô đặc. Tinh chế phần còn lại bằng cách sắc ký cột (HPLC điều chế; axetonitril/nước). Hiệu suất 70mg (45%).

¹H NMR (400 MHz; DMSO-d₆): 12,49 ppm (s rộng 1H); 8,08 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,39-7,24 (m, 5H), 5,23 (s, 2H), 4,27 (q, 2H), 3,39 (s, 3H).

2. Điều chế 2-clo-N-(5-etyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-6-(triflometyl)nicotinamit (Ví dụ số 7-3)

Hòa tan 200mg (0,887mmol) axit 2-clo-6-(triflometyl)nicotinic và 100mg (0,887mmol) 5-etyl-1,3,4-oxadiazol-2-amin trong 8ml CH₂Cl₂ ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó, thêm 846mg (1,33mmol) 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinan 2,4,6-trioxit (50% dung dịch trong THF) vào, khuấy hỗn hợp trong một giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó thêm 0,618ml (4,43mmol) trietylamin, 22mg (0,177mmol) 4-dimethylaminopyridin vào. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong 20 giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó rửa hai lần, mỗi lần bằng 4ml, làm khô qua natri sulfat và cô đặc. Tinh chế phần còn lại bằng cách sắc ký cột (HPLC điều chế; axetonitril/nước). Hiệu suất 80mg (28%).

¹H NMR (400 MHz; DMSO-d₆): 12,59 ppm (s rộng 1H); 8,49 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 2,85 (q, 2H), 1,28 (t, 3H).

3. Điều chế 2-clo-N-(5-etyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-4-(methylsulfonyl)benzamit (Ví dụ số 3-9)

Hòa tan 415mg (1,77mmol) axit 2-clo-4-(methylsulfonyl)benzencarboxylic và 200mg (1,77mmol) 5-etyl-1,3,4-oxadiazol-2-amin trong 9ml CH₂Cl₂ ở nhiệt độ phòng. Sau đó, thêm 1,68g (2,64mmol) 2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinan 2,4,6-trioxit (50% dung dịch trong THF) vào, khuấy hỗn hợp trong một giờ ở nhiệt độ phòng và sau đó thêm 0,246ml (1,77mmol) trietylamin, 43mg (0,35mmol) 4-dimethylaminopyridin vào. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong 48 giờ ở nhiệt độ phòng và sau đó rửa hai lần, mỗi lần bằng 4ml nước và tinh chế bằng cách sắc ký cột (HPLC điều chế; axetonitril/nước). Hiệu suất 41mg (6%).

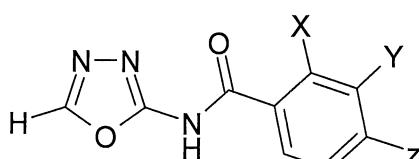
¹H NMR (400 MHz; DMSO-d₆): 12,55 ppm (s rộng 1H); 8,12 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 3,35 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 1,26 (t, 3H).

Các chữ viết tắt được sử dụng có nghĩa:

Et = etyl Me = methyl n-Pr = n-propyl i-Pr = isopropyl

c-Pr = cyclopropyl Ph = phenyl Ac = axetyl Bz = benzoyl

Bảng 1: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY và R là hydro



| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-----|----|---|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-1 | F | H | Cl | |
| 1-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 1-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 1-4 | F | H | CF ₃ | |
| 1-5 | F | H | NO ₂ | |
| 1-6 | Cl | H | Br | |
| 1-7 | Cl | H | SMe | |
| 1-8 | Cl | H | SOMe | |
| 1-9 | Cl | H | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|------------------------------------|---|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 1-11 | Cl | H | SEt | |
| 1-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 1-13 | Cl | H | CF ₃ | |
| 1-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 1-15 | Cl | H | pyrazol-1-yl | |
| 1-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 1-17 | Br | H | Cl | |
| 1-18 | Br | H | Br | |
| 1-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 1-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 1-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 1-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |
| 1-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 1-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 1-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 1-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 1-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 1-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 1-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 1-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 1-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 1-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 1-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 1-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 1-35 | NO ₂ | H | F | |
| 1-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 1-37 | NO ₂ | H | Br | |
| 1-38 | NO ₂ | H | I | |
| 1-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 1-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 1-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 1-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 1-43 | Me | H | Cl | |
| 1-44 | Me | H | Br | |
| 1-45 | Me | H | SMe | |
| 1-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 1-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 1-48 | Me | H | SEt | |
| 1-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 1-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 1-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-----------------|--------------------------------------|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-52 | Et | H | Cl | |
| 1-53 | Et | H | Br | |
| 1-54 | Et | H | SMe | |
| 1-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 1-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 1-57 | Et | H | SEt | |
| 1-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 1-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 1-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 1-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 1-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 1-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 1-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 1-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |
| 1-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 1-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 1-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 1-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 1-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 1-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 1-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 1-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 1-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 1-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 1-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 1-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 1-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 1-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 1-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 1-85 | Me | SMe | H | |
| 1-86 | Me | SOMe | H | |
| 1-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 1-88 | Me | SEt | H | |
| 1-89 | Me | SOEt | H | |
| 1-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 1-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|---------------------------------------------------------------------|----|------------------------------------------------------------------------|
| 1-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 1-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 1-94 | Me | F | F | |
| 1-95 | Me | F | Cl | |
| 1-96 | Me | SEt | F | |
| 1-97 | Me | SOEt | F | |
| 1-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 1-99 | Me | Me | Cl | |
| 1-100 | Me | F | Cl | |
| 1-101 | Me | Cl | Cl | |
| 1-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 1-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 1-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 1-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 1-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 1-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂ | Cl | |
| 1-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 1-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 1-112 | Me | O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me | Cl | |
| 1-113 | Me | OCH ₂ -NHSO ₂ cPr | Cl | |
| 1-114 | Me | O(CH ₂)-5-2,4-dimetyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on | Cl | |
| 1-115 | Me | O(CH ₂)-3,5-dimethyl-1,2-oxazol-4-yl | Cl | |
| 1-116 | Me | SMe | Cl | |
| 1-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 1-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-119 | Me | SEt | Cl | |
| 1-120 | Me | SOEt | Cl | |
| 1-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 1-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 1-126 | Me | NHMe | Br | |
| 1-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 1-128 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Br | |
| 1-129 | Me | O(CH ₂)-5-pyrrolidin-2-on | Br | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-130 | Me | SMe | Br | |
| 1-131 | Me | SOMe | Br | |
| 1-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 1-133 | Me | SEt | Br | |
| 1-134 | Me | SOEt | Br | |
| 1-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 1-136 | Me | SMe | I | |
| 1-137 | Me | SOMe | I | |
| 1-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 1-139 | Me | SEt | I | |
| 1-140 | Me | SOEt | I | |
| 1-141 | Me | SO ₂ Et | I | |
| 1-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 1-143 | Me | SMe | CF ₃ | |
| 1-144 | Me | SOMe | CF ₃ | |
| 1-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 8,03 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,54 (s, 1H), 3,46 (s, 3H), 3,42 (s, 3H) |
| 1-146 | Me | SEt | CF ₃ | |
| 1-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 1-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 1-153 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-154 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-155 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-156 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 1-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-161 | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 1-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 1-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 1-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 1-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |
| 1-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |
| 1-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 1-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-179 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 1-180 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 1-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-di-metoxy pyrimidin-2-yl) | SO ₂ Me | |
| 1-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 1-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 1-187 | Me | SEt | SO ₂ Me | |
| 1-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 1-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 1-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-200 | Et | SMe | Cl | |
| 1-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 1-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 1-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|---------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 1-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 1-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |
| 1-211 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | F | |
| 1-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 1-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-215 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Cl | |
| 1-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 1-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 1-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 1-219 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Br | |
| 1-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 1-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 1-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 1-223 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | I | |
| 1-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 1-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 1-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-232 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 1-233 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 1-234 | F | SMe | CF ₃ | |
| 1-235 | F | SOMe | CF ₃ | |
| 1-236 | Cl | Me | Cl | |
| 1-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 1-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |
| 1-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-240 | Cl | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-241 | Cl | O(CH ₂)-5-pyrrolidin-2-on | Cl | |
| 1-242 | Cl | SMe | Cl | |
| 1-243 | Cl | SOMe | Cl | |

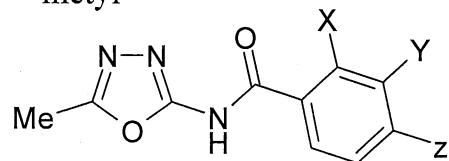
| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-245 | Cl | F | SMe | |
| 1-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 1-247 | Cl | COOMe | SO ₂ Me | |
| 1-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 1-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 1-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | 11,98 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,33- 4,22 (m, 2H), 3,36 (s, 3H) |
| 1-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 1-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-258 | Cl | CH ₂ OcPentyl | SO ₂ Me | |
| 1-259 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-260 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SMe | |
| 1-261 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-262 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-263 | Cl | 5-xanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-264 | Cl | 5-xanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-265 | Cl | 5-(metoxymethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-266 | Cl | 5-(metoxymethyl)-5-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-267 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-268 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 1-269 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 1-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 1-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 1-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----|---------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-273 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-274 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 1-275 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 1-276 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |
| 1-277 | Cl | OiPr | SO ₂ Me | |
| 1-278 | Cl | OiPr | SO ₂ Et | |
| 1-279 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-280 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-282 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-284 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-286 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 1-287 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 1-288 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-290 | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-291 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-292 | Br | OMe | Br | |
| 1-293 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 1-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-296 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-298 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-300 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 1-301 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 1-302 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-304 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-306 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-308 | I | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 1-309 | I | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 1-310 | OMe | SMe | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1-311 | OMe | SOMe | CF ₃ | |
| 1-312 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-313 | OMe | SOEt | CF ₃ | |
| 1-314 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-315 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-316 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-317 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-318 | OMe | SMe | Cl | |
| 1-319 | OMe | SOMe | Cl | |
| 1-320 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-321 | OMe | SEt | Cl | |
| 1-322 | OMe | SOEt | Cl | |
| 1-323 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 1-324 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-325 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-326 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-327 | OCH ₂ c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 1-328 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 1-329 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-330 | OCH ₂ c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 1-331 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 1-332 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-333 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-334 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-335 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-336 | OCH ₂ c-Pr | SMe | Cl | |
| 1-337 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | Cl | |
| 1-338 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-339 | OCH ₂ c-Pr | SEt | Cl | |
| 1-340 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | Cl | |
| 1-341 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |
| 1-342 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-343 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-344 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-345 | OCH ₂ c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-346 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-347 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-348 | OCH ₂ c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 1-349 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 1-350 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 1-351 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-352 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-353 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (^1H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|--------------------|-----------------|-----------------|----------------------------------------------------------------------|
| 1-354 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |
| 1-355 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 1-356 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 1-357 | SMe | SEt | F | |
| 1-358 | SMe | SMe | F | |
| 1-359 | Cl | SMe | CF ₃ | |
| 1-360 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | |
| 1-361 | Cl | CF ₃ | CF ₃ | |
| 1-362 | Cl | CF ₃ | CF ₃ | |

Bảng 2: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY và R là methyl



| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (^1H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|--------------------|---|------------------------------------|----------------------------------------------------------------------|
| 2-1 | F | H | Cl | |
| 2-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 2-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 2-4 | F | H | CF ₃ | |
| 2-5 | F | H | NO ₂ | |
| 2-6 | Cl | H | Br | |
| 2-7 | Cl | H | SMe | |
| 2-8 | Cl | H | SOMe | |
| 2-9 | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 2-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 2-11 | Cl | H | SEt | |
| 2-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 2-13 | Cl | H | CF ₃ | |
| 2-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 2-15 | Cl | H | pyrazol-1-yl | |
| 2-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 2-17 | Br | H | Cl | |
| 2-18 | Br | H | Br | |
| 2-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 2-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 2-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 2-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|------------------------------------|-----------------|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 2-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 2-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 2-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 2-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 2-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 2-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 2-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 2-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 2-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 2-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 2-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 2-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 2-35 | NO ₂ | H | F | |
| 2-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 2-37 | NO ₂ | H | Br | |
| 2-38 | NO ₂ | H | I | |
| 2-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 2-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 2-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 2-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 2-43 | Me | H | Cl | |
| 2-44 | Me | H | Br | |
| 2-45 | Me | H | SMe | |
| 2-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 2-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 2-48 | Me | H | SEt | |
| 2-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 2-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 2-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 2-52 | Et | H | Cl | |
| 2-53 | Et | H | Br | |
| 2-54 | Et | H | SMe | |
| 2-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 2-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 2-57 | Et | H | SEt | |
| 2-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 2-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 2-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 2-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 2-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 2-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 2-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 2-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|-----------------------------------------------------|-----------------------|-------------------------------------------------------------------------------|
| 2-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 2-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 2-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 2-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 2-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 2-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 2-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 2-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 2-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 2-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 2-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 2-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 2-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 2-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 2-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 2-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 2-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 2-85 | Me | SMe | H | |
| 2-86 | Me | SOMe | H | |
| 2-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 2-88 | Me | SEt | H | |
| 2-89 | Me | SOEt | H | |
| 2-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 2-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 2-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 2-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 2-94 | Me | F | F | |
| 2-95 | Me | F | Cl | |
| 2-96 | Me | SEt | F | |
| 2-97 | Me | SOEt | F | |
| 2-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 2-99 | Me | Me | Cl | |
| 2-100 | Me | F | Cl | 12,08 (bs, 1H), 7,56 (dd, 1H), 7,43 (d, 1H), 2,44 (s, 3H), 2,32 (s, 3H) |
| 2-101 | Me | Cl | Cl | |
| 2-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 2-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 2-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 2-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|------------------------------------------------------------------------------|----|------------------------------------------------------------------------|
| 2-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 2-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 2-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂ | Cl | |
| 2-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 2-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 2-112 | Me | O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me | Cl | |
| 2-113 | Me | O-CH ₂ -NHSO ₂ cPr | Cl | |
| 2-114 | Me | O(CH ₂) ₅ -dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on | Cl | |
| 2-115 | Me | O(CH ₂) ₃ ,5-dimethyl-1,2-oxazol-4-yl | Cl | |
| 2-116 | Me | SMe | Cl | |
| 2-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 2-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 2-119 | Me | SEt | Cl | |
| 2-120 | Me | SOEt | Cl | |
| 2-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 2-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 2-126 | Me | NHMe | Br | |
| 2-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 2-128 | Me | O(CH ₂)CONEt ₂ | Br | |
| 2-129 | Me | O(CH ₂) ₅ -pyrrolidin-2-on | Br | |
| 2-130 | Me | SMe | Br | |
| 2-131 | Me | SOMe | Br | |
| 2-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 2-133 | Me | SEt | Br | |
| 2-134 | Me | SOEt | Br | |
| 2-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 2-136 | Me | SMe | I | |
| 2-137 | Me | SOMe | I | |
| 2-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 2-139 | Me | SEt | I | |
| 2-140 | Me | SOEt | I | |
| 2-141 | Me | SO ₂ Et | I | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 2-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 2-143 | Me | SMe | CF ₃ | 12,11 (bs, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 2,65 (s, 3H), 2,31 (s, 3H) |
| 2-144 | Me | SOMe | CF ₃ | |
| 2-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 12,31 (bs, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,71 (s, 3H) |
| 2-146 | Me | SEt | CF ₃ | |
| 2-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 2-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 2-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 2-153 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-154 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-155 | Me | 5-xyanometyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-156 | Me | 5-xyanometyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 2-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-161 | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 2-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 2-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 2-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 2-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 2-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |
| 2-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |
| 2-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |
| 2-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 2-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 2-179 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 2-180 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 2-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-di-methoxypyrimidin-2-yl) | SO ₂ Me | |
| 2-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 2-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 2-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 2-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | 12,36 (bs, 1H), 8,27 (d, 1H), 8,02(d, 1H), 3,59 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 2,68 (s, 3H) |
| 2-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 2-187 | Me | SEt | SO ₂ Me | |
| 2-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 2-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 2-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 2-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 2-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 2-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 2-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 2-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-200 | Et | SMe | Cl | |
| 2-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |
| 2-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 2-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 2-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 2-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 2-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|---------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------|
| 2-211 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | F | |
| 2-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 2-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 2-215 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | Cl | |
| 2-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 2-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 2-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 2-219 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | Br | |
| 2-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 2-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 2-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 2-223 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | I | |
| 2-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 2-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 2-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 2-232 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 2-233 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 2-234 | F | SMe | CF ₃ | |
| 2-235 | F | SOMe | CF ₃ | |
| 2-236 | Cl | Me | Cl | |
| 2-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 2-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |
| 2-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-240 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Cl | 13,63 (bs, 1H), 7,58 (2d, 2H), 4,70 (s, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,86 (s, 3H) |
| 2-241 | Cl | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Cl | |
| 2-242 | Cl | SMe | Cl | |
| 2-243 | Cl | SOMe | Cl | |
| 2-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 2-245 | Cl | F | SMe | |
| 2-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | 12,48 (bs, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,89 |

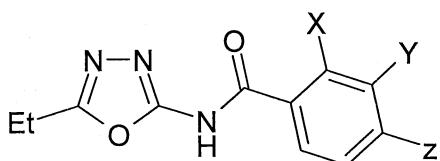
| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | (d, 1H), 3,30 (s, 3H) |
| 2-247 | Cl | COOMe | SO ₂ Me | |
| 2-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 2-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 2-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 2-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | 8,12 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,30 (q, 2H) |
| 2-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 2-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-258 | Cl | CH ₂ OcPentyl | SO ₂ Me | |
| 2-259 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-260 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SMe | |
| 2-261 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-262 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-263 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-264 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | 8,01 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 5,19-5,13 (m, 1H), 3,64-3,54 (m, 1H), 3,39 (q, 2H), 3,12 (dd, 1H), 3,05-2,96 (m, 3H), 1,15 (t, 3H) |
| 2-265 | Cl | 5-(methoxymethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-266 | Cl | 5-(methoxymethyl)-5-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-267 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-268 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-269 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 2-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 2-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 2-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 2-273 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 2-274 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 2-275 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 2-276 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |
| 2-277 | Cl | OiPr | SO ₂ Me | |
| 2-278 | Cl | OiPr | SO ₂ Et | |
| 2-279 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-280 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-282 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-284 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-286 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 2-287 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 2-288 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 2-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 2-290 | Cl | SMe | SO ₂ Me | 8,11 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 3,57 (s, 3H) |
| 2-291 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 2-292 | Br | OMe | Br | |
| 2-293 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 2-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-296 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-298 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-300 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 2-301 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 2-302 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-304 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-306 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 2-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 2-308 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 2-309 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 2-310 | OMe | SMe | CF ₃ | |
| 2-311 | OMe | SOMe | CF ₃ | |
| 2-312 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-313 | OMe | SOEt | CF ₃ | |
| 2-314 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 2-315 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-316 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-317 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-318 | OMe | SMe | Cl | |
| 2-319 | OMe | SOMe | Cl | |
| 2-320 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 2-321 | OMe | SEt | Cl | |
| 2-322 | OMe | SOEt | Cl | |
| 2-323 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 2-324 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-325 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-326 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-327 | OCH ₂ c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 2-328 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 2-329 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-330 | OCH ₂ c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 2-331 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 2-332 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 2-333 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-334 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-335 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 2-336 | OCH ₂ c-Pr | SMe | Cl | |
| 2-337 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | Cl | |
| 2-338 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 2-339 | OCH ₂ c-Pr | SEt | Cl | |
| 2-340 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | Cl | |
| 2-341 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |
| 2-342 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-343 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-344 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 2-345 | OCH ₂ c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 2-346 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 2-347 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 2-348 | OCH ₂ c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 2-349 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 2-350 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 2-351 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-352 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-353 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 2-354 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |
| 2-355 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 2-356 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 2-357 | SMe | SEt | F | |
| 2-358 | SMe | SMe | F | |
| 2-359 | Cl | SMe | CF ₃ | 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 2,40 (s, 3H) |
| 2-360 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | |
| 2-361 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 2-362 | Cl | SO ₂ Me | SO ₂ Me | 12,55 (bs, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,21 (d, 1H), 3,66 (s, 3H), 3,56 (s, 3H) |

Bảng 3: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY và R là etyl



| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|----|---|------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-1 | F | H | Cl | |
| 3-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 3-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 3-4 | F | H | CF ₃ | |
| 3-5 | F | H | NO ₂ | |
| 3-6 | Cl | H | Br | |
| 3-7 | Cl | H | SMe | |
| 3-8 | Cl | H | SOME | |
| 3-9 | Cl | H | SO ₂ Me | 12,55 (bs, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 3,35 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 1,26 (t, 3H) |
| 3-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 3-11 | Cl | H | SEt | |
| 3-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 3-13 | Cl | H | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|------------------------------------|---|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 3-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 3-15 | Cl | H | pyrazol-1-yl | |
| 3-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 3-17 | Br | H | Cl | |
| 3-18 | Br | H | Br | |
| 3-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 3-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 3-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 3-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |
| 3-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 3-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 3-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 3-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 3-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 3-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | 8,23 (d, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 2,85 (q, 2H), 1,24 (t, 3H) |
| 3-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 3-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 3-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 3-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 3-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 3-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 3-35 | NO ₂ | H | F | |
| 3-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 3-37 | NO ₂ | H | Br | |
| 3-38 | NO ₂ | H | I | |
| 3-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 3-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 3-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 3-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | 8,53 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 2,32 (q, 2H), 1,23 (t, 3H) |
| 3-43 | Me | H | Cl | |
| 3-44 | Me | H | Br | |
| 3-45 | Me | H | SMe | |
| 3-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 3-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 3-48 | Me | H | SEt | |
| 3-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 3-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 3-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 3-52 | Et | H | Cl | |
| 3-53 | Et | H | Br | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-----------------|-----------------------------------------------------|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 3-54 | Et | H | SMe | |
| 3-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 3-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 3-57 | Et | H | SEt | |
| 3-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 3-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 3-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 3-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 3-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 3-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 3-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 3-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |
| 3-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 3-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 3-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 3-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 3-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 3-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 3-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 3-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 3-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 3-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 3-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 3-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 3-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 3-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 3-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 3-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 3-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 3-85 | Me | SMe | H | |
| 3-86 | Me | SOMe | H | |
| 3-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 3-88 | Me | SEt | H | |
| 3-89 | Me | SOEt | H | |
| 3-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 3-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 3-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 3-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|----------------------------------------------------------------------|----|------------------------------------------------------------------------|
| 3-94 | Me | F | F | |
| 3-95 | Me | F | Cl | |
| 3-96 | Me | SEt | F | |
| 3-97 | Me | SOEt | F | |
| 3-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 3-99 | Me | Me | Cl | |
| 3-100 | Me | F | Cl | |
| 3-101 | Me | Cl | Cl | |
| 3-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 3-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 3-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 3-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 3-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 3-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 3-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CONMe ₂ | Cl | |
| 3-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 3-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 3-112 | Me | O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me | Cl | |
| 3-113 | Me | OCH ₂ NHSO ₂ cPr | Cl | |
| 3-114 | Me | O(CH ₂)-5-2,4-di-metyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on | Cl | |
| 3-115 | Me | O(CH ₂)-3,5-dimetyl-1,2-oxazol-4-yl | Cl | |
| 3-116 | Me | SMe | Cl | |
| 3-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 3-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 3-119 | Me | SEt | Cl | |
| 3-120 | Me | SOEt | Cl | |
| 3-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 3-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 3-126 | Me | NHMe | Br | |
| 3-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 3-128 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 3-129 | Me | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Br | |
| 3-130 | Me | SMe | Br | |
| 3-131 | Me | SOMe | Br | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 3-133 | Me | SEt | Br | |
| 3-134 | Me | SOEt | Br | |
| 3-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 3-136 | Me | SMe | I | |
| 3-137 | Me | SOMe | I | |
| 3-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 3-139 | Me | SEt | I | |
| 3-140 | Me | SOEt | I | |
| 3-141 | Me | SO ₂ Et | I | |
| 3-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 3-143 | Me | SMe | CF ₃ | 11,84 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 3,30 (q, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,09 (t, 3H) |
| 3-144 | Me | SOMe | CF ₃ | |
| 3-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 7,87 (2d, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,70 (q, 2H), 2,08 (s, 3H), 1,23 (t, 3H) |
| 3-146 | Me | SEt | CF ₃ | |
| 3-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 3-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 3-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 3-153 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-154 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-155 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-156 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 3-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-161 | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 3-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 3-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 3-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 3-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 3-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |
| 3-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |
| 3-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 3-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 3-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 3-179 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 3-180 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 3-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-dimethoxypyrimidin-2-yl) | SO ₂ Me | |
| 3-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 3-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 3-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 3-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | 12,30 (bs, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,03 (d, 1H), 3,59 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 2,85 (q, 2H), 2,68 (s, 3H), 1,26 (t, 3H) |
| 3-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 3-187 | Me | SEt | SO ₂ Me | |
| 3-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 3-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 3-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 3-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 3-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 3-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 3-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 3-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-200 | Et | SMe | Cl | |
| 3-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|---------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 3-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 3-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 3-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 3-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 3-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 3-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 3-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 3-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |
| 3-211 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | F | |
| 3-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 3-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 3-215 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Cl | |
| 3-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 3-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 3-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 3-219 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Br | |
| 3-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 3-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 3-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 3-223 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | I | |
| 3-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 3-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 3-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 3-232 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 3-233 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 3-234 | F | SMe | CF ₃ | |
| 3-235 | F | SOME | CF ₃ | 8,15 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 2,18 (q, 2H), 1,04 (t, 3H) |
| 3-236 | Cl | Me | Cl | |
| 3-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 3-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |

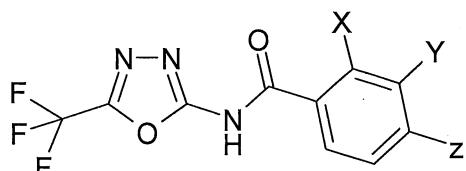
| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-240 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Cl | |
| 3-241 | Cl | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Cl | |
| 3-242 | Cl | SMe | Cl | |
| 3-243 | Cl | SOMe | Cl | |
| 3-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 3-245 | Cl | F | SMe | |
| 3-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | 8,12 (d, 1H), 7,89 (s, 1H), 3,47 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 1,26 (t, 3H) |
| 3-247 | Cl | COOMe | SO ₂ Me | |
| 3-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 3-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 3-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 3-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | 8,16 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 5,36 (s, 2H), 4,04 (q, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,58 (s, 2H), 1,22 (t, 3H) |
| 3-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 3-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-258 | Cl | CH ₂ OcPentyl | SO ₂ Me | |
| 3-259 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-260 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SMe | |
| 3-261 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-262 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-263 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-264 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | 8,08 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 5,10-5,20 (m, 1H), 3,39 (q, 3H), 3,14 (dd, 1H), 3,02-2,97 (m, 2H), 2,82 (q, 2H), 1,24 (t, 3H), 1,15 (t, 3H) |
| 3-265 | Cl | 5-(metoxymethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-266 | Cl | 5-(metoxymethyl)-5-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-267 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-268 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-269 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 3-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 3-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 3-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 3-273 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 3-274 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 3-275 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 3-276 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |
| 3-277 | Cl | OiPr | SO ₂ Me | |
| 3-278 | Cl | OiPr | SO ₂ Et | |
| 3-279 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-280 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-282 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-284 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-286 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 3-287 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 3-288 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 3-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 3-290 | Cl | SMe | SO ₂ Me | 12,43 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 2,86 (q, 2H), 1,26 (t, 3H) |
| 3-291 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 3-292 | Br | OMe | Br | |
| 3-293 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 3-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-296 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-298 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-300 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 3-301 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 3-302 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 3-304 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-306 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 3-308 | I | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 3-309 | I | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 3-310 | OMe | SMe | CF ₃ | |
| 3-311 | OMe | SOMe | CF ₃ | |
| 3-312 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 3-313 | OMe | SOEt | CF ₃ | |
| 3-314 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 3-315 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-316 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-317 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-318 | OMe | SMe | Cl | |
| 3-319 | OMe | SOMe | Cl | |
| 3-320 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 3-321 | OMe | SEt | Cl | |
| 3-322 | OMe | SOEt | Cl | |
| 3-323 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 3-324 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-325 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-326 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-327 | OCH ₂ c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 3-328 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 3-329 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 3-330 | OCH ₂ c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 3-331 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 3-332 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 3-333 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-334 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-335 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 3-336 | OCH ₂ c-Pr | SMe | Cl | |
| 3-337 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | Cl | |
| 3-338 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 3-339 | OCH ₂ c-Pr | SEt | Cl | |
| 3-340 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | Cl | |
| 3-341 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |
| 3-342 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-343 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 3-344 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-345 | OCH ₂ c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 3-346 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 3-347 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 3-348 | OCH ₂ c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 3-349 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 3-350 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 3-351 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-352 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-353 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 3-354 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |
| 3-355 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 3-356 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 3-357 | SMe | SEt | F | |
| 3-358 | SMe | SMe | F | |
| 3-359 | Cl | SMe | CF ₃ | 12,39 (bs, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 2,86 (q, 2H), 1,27 (t, 3H) |
| 3-360 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | |
| 3-361 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | 12,54 (bs, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 3,52 (s, 3H), 2,85 (q, 2H), 1,27 (t, 3H) |
| 3-362 | Cl | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |

Bảng 4: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY và R là triflometyl



| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|----|---|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-1 | F | H | Cl | |
| 4-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 4-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 4-4 | F | H | CF ₃ | |
| 4-5 | F | H | NO ₂ | |
| 4-6 | Cl | H | Br | |
| 4-7 | Cl | H | SMe | |
| 4-8 | Cl | H | SOME | |
| 4-9 | Cl | H | SO ₂ Me | 13,22 (bs, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,95 (d, 1H) |
| 4-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|------------------------------------|---|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-11 | Cl | H | SEt | |
| 4-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 4-13 | Cl | H | CF ₃ | |
| 4-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 4-15 | Cl | H | pyrazol-1-yl | |
| 4-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 4-17 | Br | H | Cl | |
| 4-18 | Br | H | Br | |
| 4-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 4-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 4-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 4-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |
| 4-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 4-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 4-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 4-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 4-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 4-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | 8,33 (d, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,06 (d, 1H), 3,46 (s, 3H) |
| 4-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 4-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 4-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 4-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 4-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 4-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 4-35 | NO ₂ | H | F | |
| 4-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 4-37 | NO ₂ | H | Br | |
| 4-38 | NO ₂ | H | I | |
| 4-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 4-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 4-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 4-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 4-43 | Me | H | Cl | |
| 4-44 | Me | H | Br | |
| 4-45 | Me | H | SMe | |
| 4-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 4-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 4-48 | Me | H | SEt | |
| 4-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 4-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 4-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-----------------|--------------------------------------|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-52 | Et | H | Cl | |
| 4-53 | Et | H | Br | |
| 4-54 | Et | H | SMe | |
| 4-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 4-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 4-57 | Et | H | SEt | |
| 4-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 4-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 4-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 4-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 4-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 4-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 4-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 4-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |
| 4-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 4-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 4-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 4-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 4-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 4-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 4-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 4-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 4-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 4-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 4-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 4-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 4-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 4-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 4-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 4-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 4-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 4-85 | Me | SMe | H | |
| 4-86 | Me | SOMe | H | |
| 4-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 4-88 | Me | SEt | H | |
| 4-89 | Me | SOEt | H | |
| 4-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 4-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|----------------------------------------------------------------------|----|------------------------------------------------------------------------|
| 4-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 4-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 4-94 | Me | F | F | |
| 4-95 | Me | F | Cl | |
| 4-96 | Me | SEt | F | |
| 4-97 | Me | SOEt | F | |
| 4-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 4-99 | Me | Me | Cl | |
| 4-100 | Me | F | Cl | |
| 4-101 | Me | Cl | Cl | |
| 4-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 4-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 4-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 4-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 4-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 4-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 4-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂ | Cl | |
| 4-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 4-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 4-112 | Me | O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me | Cl | |
| 4-113 | Me | OCH ₂ -NHSO ₂ cPr | Cl | |
| 4-114 | Me | O(CH ₂)-5-2,4-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on | Cl | |
| 4-115 | Me | O(CH ₂)-3,5-dimethyl-1,2-oxazol-4-yl | Cl | |
| 4-116 | Me | SMe | Cl | |
| 4-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 4-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 4-119 | Me | SET | Cl | |
| 4-120 | Me | SOEt | Cl | |
| 4-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 4-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 4-126 | Me | NHMe | Br | |
| 4-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 4-128 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Br | |
| 4-129 | Me | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Br | |
| 4-130 | Me | SMe | Br | |
| 4-131 | Me | SOMe | Br | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 4-133 | Me | SET | Br | |
| 4-134 | Me | SOEt | Br | |
| 4-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 4-136 | Me | SMe | I | |
| 4-137 | Me | SOMe | I | |
| 4-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 4-139 | Me | SET | I | |
| 4-140 | Me | SOEt | I | |
| 4-141 | Me | SO ₂ Et | I | |
| 4-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 4-143 | Me | SMe | CF ₃ | 7,72 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 2,67 (s, 3H), 2,30 (s, 3H) |
| 4-144 | Me | SOMe | CF ₃ | 7,89 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 3,05 (s, 3H), 2,85 (s, 3H) |
| 4-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 13,11 (bs, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 3,43 (s, 3H), 2,73 (s, 3H) |
| 4-146 | Me | SET | CF ₃ | |
| 4-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 4-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 4-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 4-153 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 4-154 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-155 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 4-156 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 4-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-161 | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 4-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 4-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 4-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 4-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 4-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |
| 4-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |
| 4-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 4-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 4-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 4-179 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 4-180 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 4-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-di-methoxypyrimidin-2-yl) | SO ₂ Me | |
| 4-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | 13,09 (bs, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 3,44 (s, 3H), 2,47 (s, 3H) |
| 4-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 4-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 4-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 4-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 4-187 | Me | SET | SO ₂ Me | |
| 4-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 4-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 4-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 4-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 4-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 4-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 4-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 4-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-200 | Et | SMe | Cl | |
| 4-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |
| 4-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 4-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 4-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|--------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 4-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 4-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |
| 4-211 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | F | |
| 4-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 4-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 4-215 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Cl | |
| 4-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 4-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 4-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 4-219 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | Br | |
| 4-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 4-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 4-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 4-223 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | I | |
| 4-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 4-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 4-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 4-232 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 4-233 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 4-234 | F | SMe | CF ₃ | |
| 4-235 | F | SOMe | CF ₃ | |
| 4-236 | Cl | Me | Cl | |
| 4-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 4-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |
| 4-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-240 | Cl | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | 13,08 (bs, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 4,74 (s, 2H), 3,01 (s, 3H), 2,87 (s, 3H) |
| 4-241 | Cl | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Cl | |
| 4-242 | Cl | SMe | Cl | |
| 4-243 | Cl | SOMe | Cl | |
| 4-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 4-245 | Cl | F | SMe | |

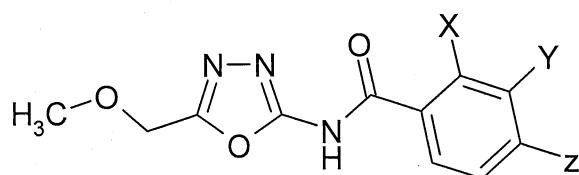
| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------------------|--------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | 13,29 (bs, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 3,49 (s, 3H) |
| 4-247 | Cl | COOMe | SO ₂ Me | |
| 4-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 4-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 4-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 4-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | 13,21 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,29 (q, 2H), |
| 4-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | 12,98 (bs, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,18 (q, 2H), 2,57 (s, 3H) |
| 4-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 4-258 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-259 | Cl | CH ₂ OcPentyl | SO ₂ Me | |
| 4-260 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-261 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SMe | |
| 4-262 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 4-263 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-264 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 4-265 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-266 | Cl | 5-(methoxymethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-267 | Cl | 5-(methoxymethyl)-5-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-268 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 4-269 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | 13,24 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 5,09 (dd, 2H), 4,02-3,93 (m, 1H), 3,72 (dd, 1H), 3,62 (dd, 1H), 3,59-3,52 (m, 3H), 1,93-1,86 (m, 1H), 1,83-1,75 (m, 2H), 1,59-1,51 (m, 1H) |
| 4-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 4-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ - | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----|--------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| | | tetrahydrofuran-3-yl | | |
| 4-273 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 4-274 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 4-275 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 4-276 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 4-277 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |
| 4-278 | Cl | O <i>i</i> Pr | SO ₂ Me | |
| 4-279 | Cl | O <i>i</i> Pr | SO ₂ Et | |
| 4-280 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-282 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-284 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-286 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-287 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 4-288 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 4-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 4-290 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 4-291 | Cl | SMe | SO ₂ Me | 13,22 (bs, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 3,59 (s, 3H) |
| 4-292 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 4-293 | Br | OMe | Br | |
| 4-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 4-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-296 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-298 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-300 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-301 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 4-302 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 4-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-304 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-306 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-308 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 4-309 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 4-310 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 4-311 | OMe | SMe | CF ₃ | |
| 4-312 | OMe | SOMe | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-313 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-314 | OMe | SOEt | CF ₃ | |
| 4-315 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 4-316 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-317 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-318 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-319 | OMe | SMe | Cl | |
| 4-320 | OMe | SOMe | Cl | |
| 4-321 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 4-322 | OMe | SEt | Cl | |
| 4-323 | OMe | SOEt | Cl | |
| 4-324 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 4-325 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-326 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-327 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-328 | OCH ₂ c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 4-329 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 4-330 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-331 | OCH ₂ c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 4-332 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 4-333 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 4-334 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-335 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-336 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 4-337 | OCH ₂ c-Pr | SMe | Cl | |
| 4-338 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | Cl | |
| 4-339 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 4-340 | OCH ₂ c-Pr | SEt | Cl | |
| 4-341 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | Cl | |
| 4-342 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |
| 4-343 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-344 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-345 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 4-346 | OCH ₂ c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 4-347 | OCH ₂ c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 4-348 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 4-349 | OCH ₂ c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 4-350 | OCH ₂ c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 4-351 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 4-352 | OCH ₂ c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-353 | OCH ₂ c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-354 | OCH ₂ c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 4-355 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|--------------------|--------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 4-356 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 4-357 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 4-358 | SMe | SEt | F | |
| 4-359 | SMe | SMe | F | |
| 4-360 | Cl | SMe | CF ₃ | |
| 4-361 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | |
| 4-362 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 4-363 | Cl | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |

Bảng 5: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY và R là CH₂OMe



| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|--------------------|---|------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 5-1 | F | H | Cl | |
| 5-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 5-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 5-4 | F | H | CF ₃ | |
| 5-5 | F | H | NO ₂ | |
| 5-6 | Cl | H | Br | |
| 5-7 | Cl | H | SMe | |
| 5-8 | Cl | H | SOMe | |
| 5-9 | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 5-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 5-11 | Cl | H | SEt | |
| 5-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 5-13 | Cl | H | CF ₃ | |
| 5-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 5-15 | Cl | H | pyrazol-1-yl | |
| 5-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 5-17 | Br | H | Cl | |
| 5-18 | Br | H | Br | |
| 5-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 5-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 5-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 5-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|------------------------------------|---|------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 5-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 5-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 5-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 5-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 5-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,02 (t, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 4,57 (s, 2H), 3,43 (s, 3H) |
| 5-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 5-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 5-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 5-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 5-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 5-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 5-35 | NO ₂ | H | F | |
| 5-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 5-37 | NO ₂ | H | Br | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,39 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,80 (m, 1H), 4,60 (s, 2H), 3,34 (s, 3H) |
| 5-38 | NO ₂ | H | I | |
| 5-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 5-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 5-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 5-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 5-43 | Me | H | Cl | |
| 5-44 | Me | H | Br | |
| 5-45 | Me | H | SMe | |
| 5-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 5-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 5-48 | Me | H | SEt | |
| 5-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 5-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 5-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,50 (bs, 1H), 7,95 (m, 3H), 4,93 (s, 2H), 4,11 (s, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,98 (s, 3H) |
| 5-52 | Et | H | Cl | |
| 5-53 | Et | H | Br | |
| 5-54 | Et | H | SMe | |
| 5-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 5-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 5-57 | Et | H | SEt | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|-----------------------------------------------------|-----------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 5-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 5-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 5-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 5-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 5-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 5-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 5-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 5-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |
| 5-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 5-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 5-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 5-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 5-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 5-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 5-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 5-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 5-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 5-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 5-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 5-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 5-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 5-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 5-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 5-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 5-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4-triazol-1-yl | |
| 5-85 | Me | SMe | H | |
| 5-86 | Me | SOMe | H | |
| 5-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 5-88 | Me | SEt | H | |
| 5-89 | Me | SOEt | H | |
| 5-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 5-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 5-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 5-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 5-94 | Me | F | F | |
| 5-95 | Me | F | Cl | |
| 5-96 | Me | SEt | F | |
| 5-97 | Me | SOEt | F | |
| 5-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 5-99 | Me | Me | Cl | |
| 5-100 | Me | F | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|----------------------------------------------------------------------|----|------------------------------------------------------------------------|
| 5-101 | Me | Cl | Cl | |
| 5-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 5-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 5-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 5-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 5-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 5-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 5-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂ | Cl | |
| 5-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 5-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 5-112 | Me | O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me | Cl | |
| 5-113 | Me | OCH ₂ -NHSO ₂ cPr | Cl | |
| 5-114 | Me | O(CH ₂)-5-2,4-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on | Cl | |
| 5-115 | Me | O(CH ₂)-3,5-dimethyl-1,2-oxazol-4-yl | Cl | |
| 5-116 | Me | SMe | Cl | |
| 5-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 5-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 5-119 | Me | SEt | Cl | |
| 5-120 | Me | SOEt | Cl | |
| 5-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 5-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 5-126 | Me | NHMe | Br | |
| 5-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 5-128 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Br | |
| 5-129 | Me | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Br | |
| 5-130 | Me | SMe | Br | |
| 5-131 | Me | SOMe | Br | |
| 5-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 5-133 | Me | SEt | Br | |
| 5-134 | Me | SOEt | Br | |
| 5-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 5-136 | Me | SMe | I | |
| 5-137 | Me | SOMe | I | |
| 5-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 5-139 | Me | SEt | I | |
| 5-140 | Me | SOEt | I | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------|--------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-141 | Me | SO ₂ Et | I | |
| 5-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 5-143 | Me | SMe | CF ₃ | 12,33 (s, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 4,62 (s, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,66 (s, 3H), 2,28 (s, 3H) |
| 5-144 | Me | SOMe | CF ₃ | |
| 5-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 7,89 (bs, 2H), 4,51 (s, 2H), 3,31 (s, 3H), 2,08 (s, 3H) |
| 5-146 | Me | SEt | CF ₃ | |
| 5-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 5-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 5-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 5-153 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-154 | Me | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-155 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-156 | Me | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 5-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | 12,27 (bs, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 5,69 (m, 2H), 4,62 (s, 2H), 3,55 (m, 5H), 2,29 (s, 3H) |
| 5-161 | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 5-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 5-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 5-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 5-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 5-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |
| 5-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |
| 5-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |
| 5-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 5-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 5-179 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 5-180 | Me | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 5-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-di-methoxypyrimidin-2-yl) | SO ₂ Me | |
| 5-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 5-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 5-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 5-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | 8,24 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 4,62 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 3,55 (s, 3H), 3,33 (s, 3H), 2,67 (s, 3H) |
| 5-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 5-187 | Me | SEt | SO ₂ Me | |
| 5-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 5-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 5-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 5-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 5-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 5-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 5-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 5-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-200 | Et | SMe | Cl | |
| 5-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |
| 5-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 5-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 5-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 5-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 5-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |
| 5-211 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | F | |
| 5-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----------------|--------------------------------------|--------------------|----------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 5-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 5-215 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | Cl | |
| 5-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 5-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 5-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 5-219 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | Br | |
| 5-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 5-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 5-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 5-223 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | I | |
| 5-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 5-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 5-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 5-232 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Me | |
| 5-233 | CF ₃ | [1,4]dioxan-2-yl-methoxy | SO ₂ Et | |
| 5-234 | F | SMe | CF ₃ | 7,86 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 4,18 (s, 3H), 3,40 (s, 3H) |
| 5-235 | F | SOMe | CF ₃ | 7,87 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 3,13 (ss, 6H) |
| 5-236 | Cl | Me | Cl | |
| 5-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 5-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |
| 5-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-240 | Cl | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | 7,65 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 4,70 (s, 2H), 3,43-3,24 (m, 5H), 3,0 (s, 3H), 2,86 (s, 3H) |
| 5-241 | Cl | O(CH ₂)-5-pyrolidin-2-on | Cl | |
| 5-242 | Cl | SMe | Cl | 7,72 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 4,61 (s, 2H), 3,35 (s, 3H), 2,44 (s, 3H) |
| 5-243 | Cl | SOMe | Cl | |
| 5-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 5-245 | Cl | F | SMe | |
| 5-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | 8,0 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 4,46 (s, 2H), 3,43 (s, 3H), 3,36 (s, 3H) |
| 5-247 | Cl | COOMe | SO ₂ Me | |

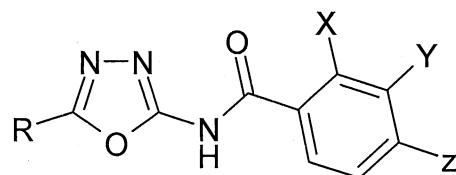
| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|-------------------------------------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 5-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 5-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 5-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 5-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 5-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-258 | Cl | CH ₂ OcPentyl | SO ₂ Me | |
| 5-259 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-260 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SMe | |
| 5-261 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-262 | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-263 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-264 | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-265 | Cl | 5-(metoxymethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-266 | Cl | 5-(metoxymethyl)-5-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-267 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-268 | Cl | CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-269 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 5-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | 12,68 (bs, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 5,12 (d, 2H), 5,06 (s, 2H), 4,62 (s, 2H), 3,97 (m, 1H), 3,72 (q, 1H), 3,62 (q, 1H), 3,37 (s, 3H), 1,94-1,85 (m, 1H), 1,83-1,73 (m, 2H), 1,59-1,48 (m, 1H) |
| 5-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Me | |
| 5-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl | SO ₂ Et | |
| 5-273 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 5-274 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 5-275 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 5-276 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-----|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 5-277 | Cl | OiPr | SO ₂ Me | |
| 5-278 | Cl | OiPr | SO ₂ Et | |
| 5-279 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-280 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-282 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-284 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-286 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 5-287 | Cl | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 5-288 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 5-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 5-290 | Cl | SMe | SO ₂ Me | 8,12 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 4,62 (s, 2H), 3,57 (s, 3H), 3,40 (s, 3H) |
| 5-291 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 5-292 | Br | OMe | Br | |
| 5-293 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 5-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-296 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-298 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-300 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 5-301 | Br | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 5-302 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-304 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-306 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 5-308 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Me | |
| 5-309 | I | [1,4]dioxan-2-yl-metoxy | SO ₂ Et | |
| 5-310 | OMe | SMe | CF ₃ | |
| 5-311 | OMe | SOMe | CF ₃ | |
| 5-312 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-313 | OMe | SOEt | CF ₃ | |
| 5-314 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 5-315 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-316 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-317 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|------------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 5-318 | OMe | SMe | Cl | |
| 5-319 | OMe | SOMe | Cl | |
| 5-320 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 5-321 | OMe | SEt | Cl | |
| 5-322 | OMe | SOEt | Cl | |
| 5-323 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 5-324 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-325 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-326 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-327 | OMe | H | SO ₂ Me | 7,79 (d, 1H), 7,61 (d, 2H), 4,62 (s, 2H), 3,95 (s, 3H) |
| 5-328 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 5-329 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 5-330 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-331 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 5-332 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 5-333 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 5-334 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-335 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-336 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 5-337 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | Cl | |
| 5-338 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | Cl | |
| 5-339 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 5-340 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | Cl | |
| 5-341 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | Cl | |
| 5-342 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |
| 5-343 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-344 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-345 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 5-346 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 5-347 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 5-348 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 5-349 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 5-350 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 5-351 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 5-352 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-353 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-354 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 5-355 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |
| 5-356 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 5-357 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 5-358 | SMe | SEt | F | |
| 5-359 | SMe | SMe | F | |

| Số | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|----|--------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-360 | F | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 5-361 | Cl | SMe | CF ₃ | 12,58 (bs, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 2,44 (s, 3H) |
| 5-362 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | 12,70 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 3,57 (s, 3H), 3,15 (s, 3H) |
| 5-363 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | 12,75 (bs, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 3,52 (s, 3H), 3,32 (s, 3H) |
| 5-364 | Cl | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |

Bảng 6: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là CY



| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|------|------|------------------------------------|--------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-1 | c-Pr | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-2 | c-Pr | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-3 | c-Pr | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-4 | c-Pr | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-5 | c-Pr | NO ₂ | H | Br | |
| 6-6 | c-Pr | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-7 | c-Pr | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-8 | c-Pr | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-9 | c-Pr | NO ₂ | H | Me | |
| 6-10 | c-Pr | NO ₂ | H | F | |
| 6-11 | c-Pr | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-12 | c-Pr | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-13 | c-Pr | CF ₃ | H | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,32 (bs, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,80 (d, 1H), 2,19 (m, 1H), 1,09 (m, 2H), 0,96 (m, 2H) |
| 6-14 | c-Pr | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-15 | c-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,09 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 5,22 (s, 2H), 4,29 (q, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,20 (m, 1H), 1,15-0,86 (m, 4H) |
| 6-16 | c-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-17 | c-Pr | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2- | SO ₂ Et | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|------|------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | oxazol-3-yl | | |
| 6-18 | c-Pr | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-19 | c-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,24 (bs, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 5,13 (s, 2H), 4,01-3,93 (m, 1H), 3,72 (dd, 1H), 3,64-3,53 (m, 3H), 3,40 (s, 2H), 2,0-1,92 (m, 1H), 1,92-1,86 (m, 1H), 1,82-1,73 (m, 2H), 1,58-1,49 (m, 1H), 1,13-1,07 (m, 1H), 0,98-0,88 (m, 4H) |
| 6-20 | c-Pr | Cl | SMe | Cl | |
| 6-21 | c-Pr | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,09 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 2,20 (m, 1H), 1,11 (m, 2H), 0,97 (m, 2H) |
| 6-22 | c-Pr | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-23 | c-Pr | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-24 | c-Pr | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-25 | c-Pr | Cl | OMe | Cl | |
| 6-26 | c-Pr | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-27 | c-Pr | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-28 | c-Pr | Cl | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,48 (bs, 1H), 8,12 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 3,49 (s, 3H), 2,21-2,17 (m, 1H), 1,14-1,09 (m, 2H), 1,02-0,92 (m, 2H) |
| 6-29 | c-Pr | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-30 | c-Pr | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-31 | c-Pr | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-32 | c-Pr | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-33 | c-Pr | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-34 | c-Pr | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-35 | c-Pr | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-36 | c-Pr | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-37 | c-Pr | Me | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,23 (bs, 1H), 7,83 (2d, 2H), 3,05 (s, 3H), 2,82 (s, 3H), 2,23-2,15 (m, 1H), 1,16-1,07 (m, 2H), 1,0-0,92 (m, 2H) |
| 6-38 | c-Pr | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 11,02 (bs, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 2,67 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 1,23-1,09 (m, 2H), 0,98-0,92 (m, 2H) |
| 6-39 | c-Pr | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-40 | c-Pr | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|------|--------------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-41 | c-Pr | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-42 | c-Pr | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-43 | c-Pr | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-44 | c-Pr | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-45 | c-Pr | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-46 | c-Pr | Me | F | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,07 (bs, 1H), 7,59 (dd, 1H), 7,43 (d, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (m, 1H), 1,10 (m, 2H), 0,95 (m, 2H) |
| 6-47 | c-Pr | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-48 | c-Pr | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-49 | c-Pr | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-50 | c-Pr | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-51 | c-Pr | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-52 | c-Pr | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-53 | c-Pr | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-54 | c-Pr | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-55 | c-Pr | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-56 | c-Pr | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-57 | c-Pr | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-58 | c-Pr | SMe | SMe | F | |
| 6-59 | c-Pr | SMe | SEt | F | |
| 6-60 | c-Pr | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-61 | c-Pr | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-62 | c-Pr | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-63 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-64 | CO ₂ Et | Cl | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 13,03 (s, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,02 (dd, 1H), 7,95 (d, 1H), 4,42 (q, 2H), 3,38 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-65 | CO ₂ Et | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,0 (d, 1H), 7,52 (m, 1H), 6,82 (d, 1H), 4,49 (q, 2H), 3,38 (s, 3H), 1,44 (t, 3H) |
| 6-66 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | OMe | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,87 (bs, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,41 (d, 1H), 4,41 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 1,32 (t, 3H) |
| 6-67 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | Br | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 13,03 (bs, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 4,40 (q, 2H), 1,32 (t, 3H) |
| 6-68 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-69 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | NO ₂ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|------|--------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-70 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 13,02 (bs, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 4,40 (q, 2H), 1,33 (t, 3H) |
| 6-71 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,91 (bs, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,72 (dd, 2H), 4,41 (q, 2H), 1,33 (t, 3H) |
| 6-72 | CO ₂ Et | NO ₂ | H | F | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 13,01 (bs, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,94 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 4,41 (q, 2H), 1,33 (t, 3H) |
| 6-73 | CO ₂ Et | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-74 | CO ₂ Et | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-75 | CO ₂ Et | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-76 | CO ₂ Et | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 11,21 (bs, 1H), 8,16 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 5,34 (s, 2H), 4,49 (q, 2H), 4,02 (q, 2H), 3,23 (s, 3H), 1,43 (t, 3H) |
| 6-77 | CO ₂ Et | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,76 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,42 (q, 2H), 4,17 (q, 2H), 2,56 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-78 | CO ₂ Et | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,13 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 5,21-5,12 (m, 1H), 4,52 (q, 2H), 3,80-3,71 (m, 1H), 3,42-3,24 (m, 3H), 2,98-2,83 (m, 2H), 1,47 (t, 3H), 1,29 (t, 3H) |
| 6-79 | CO ₂ Et | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-80 | CO ₂ Et | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-81 | CO ₂ Et | Cl | SMe | Cl | |
| 6-82 | CO ₂ Et | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 13,01 (bs, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 4,42 (q, 2H), 3,58 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-83 | CO ₂ Et | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-84 | CO ₂ Et | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-85 | CO ₂ Et | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-86 | CO ₂ Et | Cl | OMe | Cl | |
| 6-87 | CO ₂ Et | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-88 | CO ₂ Et | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-89 | CO ₂ Et | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-90 | CO ₂ Et | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-91 | CO ₂ Et | Cl | 4-metoxy-pyrazol- | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------------|-----------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | 1-yl | | |
| 6-92 | CO ₂ Et | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-93 | CO ₂ Et | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-94 | CO ₂ Et | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-95 | CO ₂ Et | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-96 | CO ₂ Et | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,93 (bs, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 4,42 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-97 | CO ₂ Et | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-98 | CO ₂ Et | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-99 | CO ₂ Et | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,76 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 8,00 (d, 1H), 4,42 (q, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,72 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-100 | CO ₂ Et | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-101 | CO ₂ Et | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-102 | CO ₂ Et | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-103 | CO ₂ Et | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-104 | CO ₂ Et | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-105 | CO ₂ Et | Me | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,89 (bs, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 4,41 (q, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,33 (t, 3H) |
| 6-106 | CO ₂ Et | Me | Me | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 7,78 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 4,35 (q, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,57 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,31 (t, 3H) |
| 6-107 | CO ₂ Et | Me | Me | SMe | |
| 6-108 | CO ₂ Et | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-109 | CO ₂ Et | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-110 | CO ₂ Et | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-111 | CO ₂ Et | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 13,22 (bs, 1H), 8,30 (dd, 1H), 7,86 (d, 1H), 4,41 (q, 2H), 3,84 (m, 2H), 3,41 (s, 3H), 3,49 (s, 3H), 1,34 (t, 3H) |
| 6-112 | CO ₂ Et | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-113 | CO ₂ Et | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-114 | CO ₂ Et | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-115 | CO ₂ Et | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-116 | CO ₂ Et | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-117 | CO ₂ Et | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-118 | CO ₂ Et | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-119 | CO ₂ Et | SMe | SMe | F | |
| 6-120 | CO ₂ Et | SMe | SEt | F | |
| 6-121 | CO ₂ Et | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,92 (bs, 1H), 8,12 (dd, 1H), 7,58 (d, 1H), 4,41 (q, 2H), 3,44 (s, 3H), 1,33 (t, 3H) |
| 6-122 | CO ₂ Et | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-123 | CO ₂ Et | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-124 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-125 | CO ₂ Me | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-126 | CO ₂ Me | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-127 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-128 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | Br | |
| 6-129 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-130 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-131 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-132 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | Me | |
| 6-133 | CO ₂ Me | NO ₂ | H | F | |
| 6-134 | CO ₂ Me | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-135 | CO ₂ Me | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-136 | CO ₂ Me | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-137 | CO ₂ Me | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-138 | CO ₂ Me | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-139 | CO ₂ Me | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-140 | CO ₂ Me | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-141 | CO ₂ Me | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-142 | CO ₂ Me | Cl | SMe | Cl | |
| 6-143 | CO ₂ Me | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-144 | CO ₂ Me | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-145 | CO ₂ Me | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-146 | CO ₂ Me | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-147 | CO ₂ Me | Cl | OMe | Cl | |
| 6-148 | CO ₂ Me | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-149 | CO ₂ Me | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-150 | CO ₂ Me | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-151 | CO ₂ Me | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-152 | CO ₂ Me | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-153 | CO ₂ Me | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-154 | CO ₂ Me | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-155 | CO ₂ Me | Cl | F | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-156 | CO ₂ Me | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-157 | CO ₂ Me | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-158 | CO ₂ Me | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-159 | CO ₂ Me | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-160 | CO ₂ Me | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-161 | CO ₂ Me | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-162 | CO ₂ Me | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-163 | CO ₂ Me | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-164 | CO ₂ Me | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-165 | CO ₂ Me | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-166 | CO ₂ Me | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-167 | CO ₂ Me | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-168 | CO ₂ Me | Me | Me | SMe | |
| 6-169 | CO ₂ Me | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-170 | CO ₂ Me | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-171 | CO ₂ Me | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-172 | CO ₂ Me | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-173 | CO ₂ Me | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-174 | CO ₂ Me | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-175 | CO ₂ Me | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-176 | CO ₂ Me | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-177 | CO ₂ Me | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-178 | CO ₂ Me | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-179 | CO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-180 | CO ₂ Me | SMe | SMe | F | |
| 6-181 | CO ₂ Me | SMe | SEt | F | |
| 6-182 | CO ₂ Me | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-183 | CO ₂ Me | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-184 | CO ₂ Me | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-185 | benzyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-186 | benzyl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-187 | benzyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-188 | benzyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-189 | benzyl | NO ₂ | H | Br | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,93 (s, 1H), 7,72 (m, 2H), 7,41-7,28 (m, 5H), 4,09 (s, 2H) |
| 6-190 | benzyl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-191 | benzyl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-192 | benzyl | NO ₂ | H | Cl | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,85-8,73 (m, 2H), 7,59 (dd, 1H), 7,39-7,23 (m, 5H), 4,09 (s, 2H) |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------|------------------------------------|----------------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-193 | benzyl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-194 | benzyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-195 | benzyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-196 | benzyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-197 | benzyl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 7,83-7,72 (m, 2H), 7,68 (m, 1H), 7,40-7,37 (m, 5H), 4,83 (s, 2H), 4,28 (s, 2H), 2,91 (s, 3H) |
| 6-198 | benzyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,49 (s, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,39-7,24 (m, 5H), 5,23 (s, 2H), 4,27 (q, 2H), 3,39 (s, 3H) |
| 6-199 | benzyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,18 (s, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,40- 7,28 (m, 6H), 4,89 (s, 2H), 4,25 (s, 2H), 4,16 (q, 2H), 2,56 (s, 3H) |
| 6-200 | benzyl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5- dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,04 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,41- 7,24 (m, 5H), 5,19-5,09 (m, 1H), 3,78-3,69 (m, 1H), 3,36 (q, 2H), 3,28-3,18 (m, 1H), 2,98-2,78 (m, 2H), 1,28 (m, 5H) |
| 6-201 | benzyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-202 | benzyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ - tetrahydrofuran-2- yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,09 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,40- 7,29 (m, 5H), 5,27 (s, 2H), 4,13 (s, 2H), 4,10-4,02 (m, 1H), 3,79 (q, 1H), 3,71 (q, 1H), 3,68-3,57 (m, 2H), 3,28 (s, 3H), 2,01-1,90 (m, 1H), 1,90-1,81 (m, 2H), 1,62-1,51 (m, 1H) |
| 6-203 | benzyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-204 | benzyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-205 | benzyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-206 | benzyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-207 | benzyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-208 | benzyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-209 | benzyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-210 | benzyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-211 | benzyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-212 | benzyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-213 | benzyl | Cl | 4-metoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-214 | benzyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-215 | benzyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-216 | benzyl | Cl | F | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-217 | benzyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-218 | benzyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-219 | benzyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-220 | benzyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-221 | benzyl | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-222 | benzyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-223 | benzyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-224 | benzyl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-225 | benzyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-226 | benzyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-227 | benzyl | Me | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,40 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,40-7,26 (m, 5H), 4,25 (s, 2H), 3,41 (q, 2H), 2,42 (s, 3H) |
| 6-228 | benzyl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-229 | benzyl | Me | Me | SMe | |
| 6-230 | benzyl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-231 | benzyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-232 | benzyl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-233 | benzyl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-234 | benzyl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-235 | benzyl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-236 | benzyl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-237 | benzyl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-238 | benzyl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-239 | benzyl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-240 | benzyl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-241 | benzyl | SMe | SMe | F | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 10,65 (bs, 1H), 7,73 (m, 1H), 7,38-7,28 (m, 5H), 7,16 (t, 1H), 4,18 (s, 2H), 2,53 (s, 3H), 2,44 (s, 3H) |
| 6-242 | benzyl | SMe | SEt | F | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,49-7,38 (m, 6H), 7,24 (t, 1H), 4,19 (s, 2H), 2,92 (q, 2H), 1,23 (t, 3H) |
| 6-243 | benzyl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-244 | benzyl | F | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,18 (t, 1H), 8,0 (t, 1H), 7,65 (t, 2H), 7,39-7,21 (m, 3H), 4,17 (s, 2H), 3,11 (s, 3H) |
| 6-245 | benzyl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-246 | phenyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 9,02 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,29-7,18 (m, 5H) |
| 6-247 | phenyl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-248 | phenyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,39 (s, 1H), 8,02-7,90 (m, 4H), 7,61-7,48 (m, 3H), 3,47 (s, 3H) |
| 6-249 | phenyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-250 | phenyl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-251 | phenyl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-252 | phenyl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-253 | phenyl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-254 | phenyl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-255 | phenyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-256 | phenyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-257 | phenyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-258 | phenyl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-259 | phenyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,19 (d, 1H), 8,01 (d, 2H), 7,91 (d, 1H), 7,65-7,50 (m, 3H), 5,39 (s, 2H), 4,04 (q, 2H), 3,22 (s, 3H) |
| 6-260 | phenyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-261 | phenyl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,24 (d, 1H), 8,04-7,97 (m, 3H), 7,66-7,51 (m, 3H), 5,21-5,09 (m, 1H), 3,81-3,58 (m, 1H), 3,38 (q, 2H), 3,31-3,19 (m, 1H), 2,99-2,78 (m, 2H), 1,28 (t, 3H) |
| 6-262 | phenyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-263 | phenyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-264 | phenyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-265 | phenyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-266 | phenyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-267 | phenyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-268 | phenyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-269 | phenyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-270 | phenyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-271 | phenyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-272 | phenyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-273 | phenyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-274 | phenyl | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-275 | phenyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-276 | phenyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-277 | phenyl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-278 | phenyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-279 | phenyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,64 (s, 1H), 8,05 (2d, 2H), 7,94 (bs, 2H), 7,64 –7,61 (m, 3H), 3,49 (s, 3H), 2,76 (s, 3H) |
| 6-280 | phenyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-281 | phenyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-282 | phenyl | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,46 (s, 1H), 7,93 (d, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,58 – 7,64 (m, 3H), 2,69 (s, 3H), 2,32 (s, 3H) |
| 6-283 | phenyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-284 | phenyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-285 | phenyl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-286 | phenyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-287 | phenyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-288 | phenyl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-289 | phenyl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-290 | phenyl | Me | Me | SMe | |
| 6-291 | phenyl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-292 | phenyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-293 | phenyl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-294 | phenyl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-295 | phenyl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-296 | phenyl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-297 | phenyl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-298 | phenyl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-299 | phenyl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-300 | phenyl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-301 | phenyl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-302 | phenyl | SMe | SMe | F | |
| 6-303 | phenyl | SMe | SEt | F | |
| 6-304 | phenyl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-305 | phenyl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-306 | phenyl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-307 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-308 | pyrazin-2-yl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-309 | pyrazin-2-yl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 9,32 (s, 1H), 8,72 (dd, 2H), 8,38 (s, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,90 (d, |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 1H), 3,40 (s, 3H) |
| 6-310 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-311 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-312 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-313 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-314 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-315 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-316 | pyrazin-2-yl | NO ₂ | H | F | |
| 6-317 | pyrazin-2-yl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-318 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-319 | pyrazin-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-320 | pyrazin-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 9,39 (s, 1H), 8,78 (dd, 2H), 8,23 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 5,39 (m, 2H), 4,05 (q, 2H), 3,23 (s, 3H) |
| 6-321 | pyrazin-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-322 | pyrazin-2-yl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 9,38 (s, 1H), 8,78 (d, 2H), 8,13 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 5,12-5,11 (m, 1H), 3,82-3,71 (m, 1H), 3,39 (q, 2H), 3,33-3,24 (dd, 1H), 3,0-2,81 (m, 1H), 1,3 (t, 3H) |
| 6-323 | pyrazin-2-yl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-324 | pyrazin-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-325 | pyrazin-2-yl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-326 | pyrazin-2-yl | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-327 | pyrazin-2-yl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-328 | pyrazin-2-yl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-329 | pyrazin-2-yl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-330 | pyrazin-2-yl | Cl | OMe | Cl | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-331 | pyrazin-2-yl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-332 | pyrazin-2-yl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-333 | pyrazin-2-yl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-334 | pyrazin-2-yl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-335 | pyrazin-2-yl | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-336 | pyrazin-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-337 | pyrazin-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-338 | pyrazin-2-yl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-339 | pyrazin-2-yl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-340 | pyrazin-2-yl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,84 (s, 1H), 9,33 (s, 1H), 8,86 (2d, 2H), 8,04 (2d, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,75 (s, 3H) |
| 6-341 | pyrazin-2-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-342 | pyrazin-2-yl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-343 | pyrazin-2-yl | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-344 | pyrazin-2-yl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-345 | pyrazin-2-yl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-346 | pyrazin-2-yl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-347 | pyrazin-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-348 | pyrazin-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-349 | pyrazin-2-yl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-350 | pyrazin-2-yl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-351 | pyrazin-2-yl | Me | Me | SMe | |
| 6-352 | pyrazin-2-yl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-353 | pyrazin-2-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-354 | pyrazin-2-yl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|--------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-355 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-356 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-357 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-358 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-359 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-360 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-361 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-362 | pyrazin-2-yl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-363 | pyrazin-2-yl | SMe | SMe | F | |
| 6-364 | pyrazin-2-yl | SMe | SEt | F | |
| 6-365 | pyrazin-2-yl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-366 | pyrazin-2-yl | F | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 9,35 (s, 1H), 8,88 (s, 2H), 7,90 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 3,17 (s, 3H), 3,12 (s, 3H) |
| 6-367 | pyrazin-2-yl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-368 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-369 | 4-OMe-Ph | Cl | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 12,67 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,87 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,36 (s, 3H) |
| 6-370 | 4-OMe-Ph | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-371 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-372 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | Br | |
| 6-373 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-374 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-375 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-376 | 4-OMe-Ph | NO ₂ | H | Me | |
| 6-377 | 4-OMe- | NO ₂ | H | F | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|----------|------------------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | Ph | | | | |
| 6-378 | 4-OMe-Ph | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-379 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-380 | 4-OMe-Ph | CH ₂ SO ₂ M _e | H | Br | |
| 6-381 | 4-OMe-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,43 (bs, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,49 (d, 2H), 6,80 (d, 2H), 5,61 (bs, 1H), 5,40-5,27 (m, 2H), 4,03 (q, 2H), 3,05 (s, 3H) |
| 6-382 | 4-OMe-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-383 | 4-OMe-Ph | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,08 (2d, 2H), 7,92 (d, 2H), 7,03 (d, 2H), 5,22-5,12 (m, 1H), 3,83-3,62 (m, 1H), 3,37 (q, 2H), 3,29-3,21 (m, 1H), 3,0-2,91 (dd, 1H), 2,88-2,79 (dd, 1H), 1,27 (t, 3H) |
| 6-384 | 4-OMe-Ph | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-385 | 4-OMe-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-386 | 4-OMe-Ph | Cl | SMe | Cl | |
| 6-387 | 4-OMe-Ph | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-388 | 4-OMe-Ph | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-389 | 4-OMe-Ph | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-390 | 4-OMe-Ph | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-391 | 4-OMe-Ph | Cl | OMe | Cl | |
| 6-392 | 4-OMe-Ph | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-393 | 4-OMe-Ph | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-394 | 4-OMe-Ph | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-395 | 4-OMe-Ph | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-396 | 4-OMe-Ph | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-397 | 4-OMe-Ph | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-398 | 4-OMe- | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|----------|-----------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | Ph | | | | |
| 6-399 | 4-OMe-Ph | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-400 | 4-OMe-Ph | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,54 (s, 1H), 8,02 (2d, 2H), 7,89 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,42 (s, 3H), 2,75 (s, 3H) |
| 6-401 | 4-OMe-Ph | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-402 | 4-OMe-Ph | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-403 | 4-OMe-Ph | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-404 | 4-OMe-Ph | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,37 (s, 1H), 7,87 (d, 2H), 7,79 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,15 (d, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,67 (s, 3H), 2,32 (s, 3H) |
| 6-405 | 4-OMe-Ph | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-406 | 4-OMe-Ph | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-407 | 4-OMe-Ph | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-408 | 4-OMe-Ph | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-409 | 4-OMe-Ph | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-410 | 4-OMe-Ph | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-411 | 4-OMe-Ph | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-412 | 4-OMe-Ph | Me | Me | SMe | |
| 6-413 | 4-OMe-Ph | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-414 | 4-OMe-Ph | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-415 | 4-OMe-Ph | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-416 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-417 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-418 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-419 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-420 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-421 | 4-OMe- | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|----------|------------------------------------|--------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | Ph | | | | |
| 6-422 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-423 | 4-OMe-Ph | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-424 | 4-OMe-Ph | SMe | SMe | F | |
| 6-425 | 4-OMe-Ph | SMe | SEt | F | |
| 6-426 | 4-OMe-Ph | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-427 | 4-OMe-Ph | F | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,14 (d, 1H), 7,89 (d, 3H), 7,17 (d, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,14 (s, 3H) |
| 6-428 | 4-OMe-Ph | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-429 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,23 (m, 1H), 8,12 (m, 1H), 7,92 (d, 2H), 7,53 (d, 2H), 3,13 (s, 3H) |
| 6-430 | 4-Cl-Ph | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-431 | 4-Cl-Ph | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,39 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,43-7,34 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 3,43 (s, 3H) |
| 6-432 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-433 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | Br | |
| 6-434 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-435 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-436 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-437 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | Me | |
| 6-438 | 4-Cl-Ph | NO ₂ | H | F | |
| 6-439 | 4-Cl-Ph | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-440 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-441 | 4-Cl-Ph | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-442 | 4-Cl-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,27-8,08 (m, 2H), 7,99-7,81 (m, 2H), 7,57-7,43 (m, 2H), 5,48-5,29 (m, 2H), 4,12-3,98 (m, 2H), 3,22 (m, 3H) |
| 6-443 | 4-Cl-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-444 | 4-Cl-Ph | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,16 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,96 (d, 2H), 7,53 (d, 2H), 5,20-5,09 (m, 1H), 3,80-3,69 (m, 1H), 3,39 (q, 2H), 3,31-3,19 (dd, 1H), 2,98-2,77 (m, 2H), 1,29 (t, 3H) |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|---------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-445 | 4-Cl-Ph | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-446 | 4-Cl-Ph | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-447 | 4-Cl-Ph | Cl | SMe | Cl | |
| 6-448 | 4-Cl-Ph | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-449 | 4-Cl-Ph | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-450 | 4-Cl-Ph | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-451 | 4-Cl-Ph | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-452 | 4-Cl-Ph | Cl | OMe | Cl | |
| 6-453 | 4-Cl-Ph | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-454 | 4-Cl-Ph | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-455 | 4-Cl-Ph | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-456 | 4-Cl-Ph | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-457 | 4-Cl-Ph | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-458 | 4-Cl-Ph | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-459 | 4-Cl-Ph | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-460 | 4-Cl-Ph | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-461 | 4-Cl-Ph | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-462 | 4-Cl-Ph | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,98-7,87 (dd, 4H), 7,51 (d, 2H), 3,26 (s, 3H), 2,87 (s, 3H) |
| 6-463 | 4-Cl-Ph | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-464 | 4-Cl-Ph | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-465 | 4-Cl-Ph | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 12,50 (s, 1H), 7,95 (d, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,69 (d, 2H), 2,69 (s, 3H), 2,32 (s, 3H) |
| 6-466 | 4-Cl-Ph | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-467 | 4-Cl-Ph | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-468 | 4-Cl-Ph | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-469 | 4-Cl-Ph | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-470 | 4-Cl-Ph | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-471 | 4-Cl-Ph | Me | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,64 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,97 (d, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,70 (d, 2H), 3,44 (s, 3H) |
| 6-472 | 4-Cl-Ph | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-473 | 4-Cl-Ph | Me | Me | SMe | |
| 6-474 | 4-Cl-Ph | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-475 | 4-Cl-Ph | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-476 | 4-Cl-Ph | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|------------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-477 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-478 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-479 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-480 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-481 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-482 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-483 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-484 | 4-Cl-Ph | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-485 | 4-Cl-Ph | SMe | SMe | F | |
| 6-486 | 4-Cl-Ph | SMe | SEt | F | |
| 6-487 | 4-Cl-Ph | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-488 | 4-Cl-Ph | F | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,90 (bs, 1H), 8,14 (m, 1H), 7,97 (d, 2H), 7,91 (d, 1H), 7,69 (d, 2H), 3,14 (s, 3H) |
| 6-489 | 4-Cl-Ph | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-490 | tert-butyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-491 | tert-butyl | Cl | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,49 (bs, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 1,34 (s, 9H) |
| 6-492 | tert-butyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,28 (m, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,90 (m, 1H), 1,24 (s, 9H) |
| 6-493 | tert-butyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-494 | tert-butyl | NO ₂ | H | Br | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,92 (s, 1H), 7,83 (dd, 1H), 7,76 (dd, 1H), 1,39 (s, 9H) |
| 6-495 | tert-butyl | NO ₂ | H | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,11 (s, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 1,41 (s, 9H) |
| 6-496 | tert-butyl | NO ₂ | H | NO ₂ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,68 (s, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 1,42 (s, 9H) |
| 6-497 | tert-butyl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-498 | tert-butyl | NO ₂ | H | Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,92 (s, 1H), 7,57 (2d, 2H), 6,59 (bs, 2H), 2,53 (s, 3H), 1,17 (s, 9H) |
| 6-499 | tert-butyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-500 | tert-butyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-501 | tert-butyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-502 | tert-butyl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-503 | tert-butyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-504 | tert-butyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 12,18 (bs, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 4,89 (s, 2H), 4,17 (q, 2H), 2,55 (s, 3H), 1,33 (bs, 9H) |
| 6-505 | tert-butyl | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,51 (bs, 1H), 8,08 (dd, 2H), 5,23-5,13 (m, 1H), 3,66-3,55 (m, 1H), 3,41 (q, 2H), 3,19-3,10 (dd, 1H), 3,03-2,98 (m, 2H), 1,33 (bs, 9H), 1,14 (t, 3H) |
| 6-506 | tert-butyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-507 | tert-butyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 8,12 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 5,22 (s, 2H), 4,14-4,04 (m, 1H), 3,82 (q, 1H), 3,64 (q, 1H), 3,69-3,60 (m, 2H), 3,30 (s, 3H), 2,0-1,91 (m, 1H), 1,91-1,79 (m, 2H), 1,65-1,56 (m, 1H), 1,41 (s, 9H) |
| 6-508 | tert-butyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-509 | tert-butyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,47 (bs, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 1,31 (bs, 9H) |
| 6-510 | tert-butyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-511 | tert-butyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-512 | tert-butyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-513 | tert-butyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-514 | tert-butyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-515 | tert-butyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-516 | tert-butyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-517 | tert-butyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-518 | tert-butyl | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-519 | tert-butyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-520 | tert-butyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-521 | tert-butyl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-522 | tert-butyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-523 | tert-butyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 7,97-7,85 (m, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 1,42 (s, 9H) |
| 6-524 | tert-butyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-525 | tert-butyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-526 | tert-butyl | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 12,16 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 2,65 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,33 (s, 9H) |
| 6-527 | tert-butyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-528 | tert-butyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-529 | tert-butyl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-530 | tert-butyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-531 | tert-butyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-532 | tert-butyl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-533 | tert-butyl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-534 | tert-butyl | Me | Me | SMe | |
| 6-535 | tert-butyl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-536 | tert-butyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-537 | tert-butyl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-538 | tert-butyl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-539 | tert-butyl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-540 | tert-butyl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-541 | tert-butyl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-542 | tert-butyl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-543 | tert-butyl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-544 | tert-butyl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-545 | tert-butyl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-546 | tert-butyl | SMe | SMe | F | |
| 6-547 | tert-butyl | SMe | SEt | F | |
| 6-548 | tert-butyl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-549 | tert-butyl | F | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 9,61 (bs, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 3,13 (s, 3H), 1,42 (s, 9H) |
| 6-550 | tert-butyl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-551 | furan-2-yl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-552 | furan-2-yl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-553 | furan-2-yl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-554 | furan-2-yl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-555 | furan-2-yl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-556 | furan-2-yl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-557 | furan-2-yl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-558 | furan-2-yl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-559 | furan-2-yl | NO ₂ | H | Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-560 | furan-2-yl | NO ₂ | H | F | |
| 6-561 | furan-2-yl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-562 | furan-2-yl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-563 | furan-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-564 | furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,12 (dd, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,27 (bs, 1H), 6,79 (m, 1H), 5,25 (s, 3H), 4,28 (q, 2H), 3,42 (s, 3H) |
| 6-565 | furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-566 | furan-2-yl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-567 | furan-2-yl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-568 | furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,75 (bs, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,27 (bs, 1H), 6,79 (m, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,01-3,93 (m, 1H), 3,72 (q, 1H), 3,63-3,53 (m, 3H), 3,40 (d, 3H), 1,92-1,84 (m, 1H), 1,82-1,85 (m, 2H), 1,59-1,48 (m, 1H) |
| 6-569 | furan-2-yl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-570 | furan-2-yl | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-571 | furan-2-yl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-572 | furan-2-yl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-573 | furan-2-yl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-574 | furan-2-yl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-575 | furan-2-yl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-576 | furan-2-yl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-577 | furan-2-yl | Cl | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,82 (bs, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,28 (bd, 1H), 6,80 (m, 1H), 3,48 (s, 3H) |
| 6-578 | furan-2-yl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|-----------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-579 | furan-2-yl | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-580 | furan-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-581 | furan-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-582 | furan-2-yl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-583 | furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-584 | furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,63 (bs, 1H), 8,04 (m, 3H), 7,28 (bs, 1H), 6,80 (m, 1H), 3,43 (s, 3H), 2,74 (s, 3H) |
| 6-585 | furan-2-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-586 | furan-2-yl | Me | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,39 (bs, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,59 (bs, 1H), 6,77 (m, 1H), 3,11 (s, 3H), 3,09 (s, 3H) |
| 6-587 | furan-2-yl | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,47 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,26 (bs, 1H), 6,79 (m, 1H), 2,68 (s, 3H), 2,32 (s, 3H) |
| 6-588 | furan-2-yl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-589 | furan-2-yl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-590 | furan-2-yl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-591 | furan-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-592 | furan-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-593 | furan-2-yl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-594 | furan-2-yl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-595 | furan-2-yl | Me | Me | SMe | |
| 6-596 | furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-597 | furan-2-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-598 | furan-2-yl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-599 | furan-2-yl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-600 | furan-2- | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|------------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | yl | | | | |
| 6-601 | furan-2-yl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-602 | furan-2-yl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-603 | furan-2-yl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-604 | furan-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-605 | furan-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-606 | furan-2-yl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-607 | furan-2-yl | SMe | SMe | F | |
| 6-608 | furan-2-yl | SMe | SEt | F | |
| 6-609 | furan-2-yl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-610 | furan-2-yl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-611 | furan-2-yl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-612 | isopropyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-613 | isopropyl | Cl | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,43 (bs, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 3,35 (s, 3H), 3,21-3,16 (m, 1H), 1,30 (d, 6H) |
| 6-614 | isopropyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,29 (dd, 2H), 8,06 (s, 1H), 3,47 (s, 3H), 3,08 (m, 1H), 1,30 (d, 6H) |
| 6-615 | isopropyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-616 | isopropyl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-617 | isopropyl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-618 | isopropyl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-619 | isopropyl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-620 | isopropyl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-621 | isopropyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-622 | isopropyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-623 | isopropyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-624 | isopropyl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-625 | isopropyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,46 (bs, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,28 (q, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,20-3,12 (m, 1H), 1,34-1,21 (m, 6H) |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|-----------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-626 | isopropyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-627 | isopropyl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 7,92 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 5,18-5,11 (m, 1H), 3,63-3,52 (m, 1H), 3,41-3,32 (m, 2H), 3,17-3,07 (m, 1H), 3,03-2,94 (m, 2H), 1,31-1,19 (m, 6H), 1,10 (t, 3H) |
| 6-628 | isopropyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-629 | isopropyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,44 (bs, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 5,08 (m, 2H), 4,0-3,92 (m, 1H), 3,72 (q, 1H), 3,61 (q, 1H), 3,58-3,52 (m, 2H), 3,39 (s, 3H), 3,20-3,11 (m, 1H), 1,93-1,84 (m, 1H), 1,81-1,72 (m, 2H), 1,58-1,48 (m, 1H), 1,33-1,21 (m, 6H) |
| 6-630 | isopropyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-631 | isopropyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,52 (bs, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 3,19-3,16 (m, 1H), 1,30-1,28 (d, 6H) |
| 6-632 | isopropyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-633 | isopropyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-634 | isopropyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-635 | isopropyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-636 | isopropyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-637 | isopropyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-638 | isopropyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,52 (bs, 1H), 8,12 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 3,47 (s, 3H), 3,19-3,16 (m, 1H), 1,29 (d, 6H) |
| 6-639 | isopropyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-640 | isopropyl | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-641 | isopropyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-642 | isopropyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-643 | isopropyl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-644 | isopropyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-645 | isopropyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,33 (bs, 1H), 8,0 (dd, 2H), 3,42 (s, 3H), 3,17 (m, 1H), 2,71 (s, 3H), 1,37-1,24 (d, 6H) |
| 6-646 | isopropyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-647 | isopropyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-648 | isopropyl | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,29 (bs, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 3,17 (m, 1H), 2,67 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,29 (d, |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|-------------------------------------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 6H) |
| 6-649 | isopropyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-650 | isopropyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-651 | isopropyl | Me | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-652 | isopropyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-653 | isopropyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-654 | isopropyl | Me | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,32 (bs, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 3,43 (s, 3H), 3,17 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 1,30 (d, 6H) |
| 6-655 | isopropyl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-656 | isopropyl | Me | F | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,10 (bs, 1H), 7,56 (dd, 1H), 7,44 (d, 1H), 3,17 (m, 1H), 1,30 (d, 6H) |
| 6-657 | isopropyl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-658 | isopropyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-659 | isopropyl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-660 | isopropyl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-661 | isopropyl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-662 | isopropyl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-663 | isopropyl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-664 | isopropyl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-665 | isopropyl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-666 | isopropyl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-667 | isopropyl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-668 | isopropyl | SMe | SMe | F | |
| 6-669 | isopropyl | SMe | SEt | F | |
| 6-670 | isopropyl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-671 | isopropyl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-672 | isopropyl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-673 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-674 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-675 | CH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-676 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-677 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | Br | |
| 6-678 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-679 | CH ₂ CH ₂ | NO ₂ | H | NO ₂ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|-------------------------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | OMe | | | | |
| 6-680 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-681 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | Me | |
| 6-682 | CH ₂ CH ₂ OMe | NO ₂ | H | F | |
| 6-683 | CH ₂ CH ₂ OMe | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-684 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-685 | CH ₂ CH ₂ OMe | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-686 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,48 (s, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,32-4,21 (m, 2H), 3,72-3,62 (m, 3H), 3,44 (s, 3H), 3,14-3,03 (m, 2H), |
| 6-687 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-688 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,03 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 5,32-5,22 (m, 1H), 3,67 (m, 2H), 3,61-3,53 (m, 1H), 3,38 (q, 2H), 3,12 (dd, 1H), 3,08-2,98 (m, 5H), 1,20-1,09 (m, 5H) |
| 6-689 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-690 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,46 (bs, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 5,09 (dd, 2H), 4,02-3,92 (m, 1H), 3,76-3,66 (m, 3H), 3,66-3,52 (m, 3H), 3,39 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 3,14-3,03 (m, 2H), 1,98-1,83 (m, 1H), 1,82-1,74 (m, 2H), 1,58-1,48 (m, 1H) |
| 6-691 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | SMe | Cl | |
| 6-692 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-693 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-694 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-695 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-696 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | OMe | Cl | |
| 6-697 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-698 | CH ₂ CH ₂ | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|-------------------------------------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | OMe | | | | 7,64 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,68 (t, 2H), 3,26 (s, 3H), 3,07 (t, 2H), 3,0 (s, 3H), 2,87 (s, 3H) |
| 6-699 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | Cl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,53 (bs, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 3,69 (m, 2H), 3,47 (s, 3H), 3,26 (s, 3H), 3,08 (m, 2H) |
| 6-700 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-701 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-702 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-703 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-704 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-705 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,15 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 3,66 (m, 2H), 3,57 (s, 3H), 3,53 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), |
| 6-706 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-707 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-708 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-709 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-710 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-711 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-712 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-713 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-714 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-715 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-716 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-717 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | Me | SMe | |
| 6-718 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-719 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|-------------------------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-720 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-721 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-722 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-723 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-724 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-725 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-726 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-727 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-728 | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-729 | CH ₂ CH ₂ OMe | SMe | SMe | F | |
| 6-730 | CH ₂ CH ₂ OMe | SMe | SEt | F | |
| 6-731 | CH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-732 | CH ₂ CH ₂ OMe | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-733 | CH ₂ CH ₂ OMe | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-734 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-735 | CH ₂ CF ₃ | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-736 | CH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-737 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-738 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | Br | |
| 6-739 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-740 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-741 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-742 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | Me | |
| 6-743 | CH ₂ CF ₃ | NO ₂ | H | F | |
| 6-744 | CH ₂ CF ₃ | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-745 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-746 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-747 | CH ₂ CF ₃ | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-748 | CH ₂ CF ₃ | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-749 | CH ₂ CF ₃ | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,78 (bs, 1H), 8,10 (2d, 2H), 5,19 (m, 1H), 4,33 (q, 2H), 3,61 (m, 1H), 3,44 (q, 2H), 3,16 (dd, |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|---------------------------------|----|--------------------------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 1H), 3,08 (d, 2H), 1,16 (t, 3H) |
| 6-750 | CH ₂ CF ₃ | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-751 | CH ₂ CF ₃ | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-752 | CH ₂ CF ₃ | Cl | SMe | Cl | |
| 6-753 | CH ₂ CF ₃ | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,21 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 3,74 (q, 2H), 3,60 (s, 3H) |
| 6-754 | CH ₂ CF ₃ | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-755 | CH ₂ CF ₃ | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-756 | CH ₂ CF ₃ | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-757 | CH ₂ CF ₃ | Cl | OMe | Cl | |
| 6-758 | CH ₂ CF ₃ | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-759 | CH ₂ CF ₃ | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-760 | CH ₂ CF ₃ | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-761 | CH ₂ CF ₃ | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-762 | CH ₂ CF ₃ | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-763 | CH ₂ CF ₃ | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-764 | CH ₂ CF ₃ | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-765 | CH ₂ CF ₃ | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-766 | CH ₂ CF ₃ | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-767 | CH ₂ CF ₃ | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,62 (bs, 1H), 8,02 (dd, 2H), 4,31 (q, 2H), 3,43 (s, 3H), 2,62 (s, 3H) |
| 6-768 | CH ₂ CF ₃ | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-769 | CH ₂ CF ₃ | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-770 | CH ₂ CF ₃ | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,41 (bs, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,31 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,31 (s, 3H) |
| 6-771 | CH ₂ CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-772 | CH ₂ CF ₃ | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-773 | CH ₂ CF ₃ | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-774 | CH ₂ CF ₃ | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-775 | CH ₂ CF ₃ | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-776 | CH ₂ CF ₃ | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-777 | CH ₂ CF ₃ | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-778 | CH ₂ CF ₃ | Me | Me | SMe | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|---------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| 6-779 | CH ₂ CF ₃ | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-780 | CH ₂ CF ₃ | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-781 | CH ₂ CF ₃ | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-782 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-783 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-784 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-785 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-786 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-787 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-788 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-789 | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-790 | CH ₂ CF ₃ | SMe | SMe | F | |
| 6-791 | CH ₂ CF ₃ | SMe | SEt | F | |
| 6-792 | CH ₂ CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-793 | CH ₂ CF ₃ | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-794 | CH ₂ CF ₃ | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-795 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-796 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-797 | tetra-hydro-furan-2-yl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-798 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-799 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-800 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-801 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-802 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-803 | tetra- | NO ₂ | H | Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | hydro-furan-2-yl | | | | |
| 6-804 | tetra-hydro-furan-2-yl | NO ₂ | H | F | |
| 6-805 | tetra-hydro-furan-2-yl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-806 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-807 | tetra-hydro-furan-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-808 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-809 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-810 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-811 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-812 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,60 (bs, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 5,10 (m, 2H), 3,97 (m, 1H), 3,38 (s, 3H), |
| 6-813 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-814 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,60 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 5,11 (m, 1H), 3,84 (m, 2H), 3,58 (s, 3H), 2,26 (m, 2H), 1,98 (m, 2H) |
| 6-815 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-816 | tetra-hydro-furan-2- | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------------------|----|---------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | yl | | | | |
| 6-817 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-818 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-819 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-820 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,44 (bs, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 5,11 (dd, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,01 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 2,32-2,21 (m, 2H), 2,04-1,95 (m, 2H) |
| 6-821 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-822 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-823 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-824 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-825 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-826 | tetra-hydro-furan-2-yl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-827 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-828 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,5 (bs, 1H), 7,99 (dd, 2H), 5,11 (m, 1H), 3,84 (m, 2H), 3,41 (s, 3H), 2,71 (s, 3H), 2,32-2,21 (m, 2H), 2,04-1,93 (m, 2H) |
| 6-829 | tetra-hydro-furan-2- | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------------------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | yl | | | | |
| 6-830 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-831 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,31 (bs, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 5,11 (dd, 1H), 3,84 (dd, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,37-2,20 (m, 2H), 2,07- 1,95 (m, 2H) |
| 6-832 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-833 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-834 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-835 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-836 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-837 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-838 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-839 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | Me | SMe | |
| 6-840 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-841 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-842 | tetra-hydro-furan-2-yl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-843 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-844 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-845 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-846 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-847 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-848 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-849 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-850 | tetra-hydro-furan-2-yl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-851 | tetra-hydro-furan-2-yl | SMe | SMe | F | |
| 6-852 | tetra-hydro-furan-2-yl | SMe | SEt | F | |
| 6-853 | tetra-hydro-furan-2-yl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-854 | tetra-hydro-furan-2-yl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-855 | tetra-hydro-furan-2-yl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-856 | n-Pr | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-857 | n-Pr | Cl | H | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,41 (s, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,97 |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | (dd, 1H), 7,93 (d, 1H), 3,38 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 1,70 (m, 2H), 0,92 (t, 3H) |
| 6-858 | n-Pr | SO ₂ Me | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 8,27 (dd, 2H), 8,04 (s, 1H), 3,48 (s, 3H), 2,80 (m, 2H), 1,72 (m, 2H), 0,97 (m, 3H) |
| 6-859 | n-Pr | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-860 | n-Pr | NO ₂ | H | Br | |
| 6-861 | n-Pr | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-862 | n-Pr | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-863 | n-Pr | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-864 | n-Pr | NO ₂ | H | Me | |
| 6-865 | n-Pr | NO ₂ | H | F | |
| 6-866 | n-Pr | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-867 | n-Pr | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-868 | n-Pr | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-869 | n-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-870 | n-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 11,34 (bs, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,92 (s, 2H), 4,20 (q, 2H), 2,78 (t, 2H), 1,71 (m, 2H), 0,94 (t, 3H) |
| 6-871 | n-Pr | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-872 | n-Pr | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-873 | n-Pr | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,46 (bs, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 5,07 (d, 2H), 3,97 (m, 1H), 3,72 (q, 1H), 3,62 (q, 1H), 3,56 (m, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,81 (t, 2H), 1,96-1,87 (m, 1H), 1,83-1,76 (m, 2H), 1,76-1,66 (m, 2H), 1,58-1,49 (m, 1H), 0,96 (t, 3H) |
| 6-874 | n-Pr | Cl | SMe | Cl | |
| 6-875 | n-Pr | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,45 (bs, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 1,70 (m, 2H), 0,95 (t, 3H) |
| 6-876 | n-Pr | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-877 | n-Pr | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-878 | n-Pr | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-879 | n-Pr | Cl | OMe | Cl | |
| 6-880 | n-Pr | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-881 | n-Pr | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,29 (bs, 1H), 7,62 (d, 1H), |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------|-----------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 7,46 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,01 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 1,71 (m, 2H), 0,96 (t, 3H) |
| 6-882 | n-Pr | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-883 | n-Pr | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-884 | n-Pr | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-885 | n-Pr | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-886 | n-Pr | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-887 | n-Pr | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-888 | n-Pr | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-889 | n-Pr | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,35 (bs, 1H), 8,0 (dd, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,81-2,75 (m, 2H), 2,71 (s, 3H), 1,78-1,64 (m, 2H), 0,96 (t, 3H) |
| 6-890 | n-Pr | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-891 | n-Pr | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-892 | n-Pr | Me | SMe | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,20 (bs, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 2,80 (t, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 1,73-1,68 (m, 2H), 0,96 (t, 3H) |
| 6-893 | n-Pr | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-894 | n-Pr | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-895 | n-Pr | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-896 | n-Pr | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-897 | n-Pr | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-898 | n-Pr | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-899 | n-Pr | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-900 | n-Pr | Me | Me | SMe | |
| 6-901 | n-Pr | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-902 | n-Pr | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-903 | n-Pr | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-904 | n-Pr | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-905 | n-Pr | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-906 | n-Pr | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-907 | n-Pr | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-908 | n-Pr | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-909 | n-Pr | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-910 | n-Pr | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-911 | n-Pr | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-912 | n-Pr | SMe | SMe | F | |
| 6-913 | n-Pr | SMe | SEt | F | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|---------------------|------------------------------------|----------------------------------------------------------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-914 | n-Pr | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-915 | n-Pr | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-916 | n-Pr | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-917 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-918 | CH ₂ OEt | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-919 | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-920 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-921 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | Br | |
| 6-922 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-923 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-924 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-925 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | Me | |
| 6-926 | CH ₂ OEt | NO ₂ | H | F | |
| 6-927 | CH ₂ OEt | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-928 | CH ₂ OEt | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-929 | CH ₂ OEt | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-930 | CH ₂ OEt | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,63 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,66 (s, 2H), 4,29 (q, 2H), 3,55 (q, 2H), 1,15 (t, 3H) |
| 6-931 | CH ₂ OEt | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-932 | CH ₂ OEt | Cl | 5-xyanomethyl-4,5- dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,69 (bs, 1H), 8,11 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 5,21 – 5,17 (m, 1H), 4,66 (s, 2H), 3,64 – 3,52 (m, 4H), 3,42 (q, 2H), 3,16 (dd, 1H), 3,02 (m, 2H), 1,16 (2t, 6H) |
| 6-933 | CH ₂ OEt | Cl | 4,5-dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-934 | CH ₂ OEt | Cl | CH ₂ OCH ₂ - tetrahydrofuran-2- yl | SO ₂ Me | |
| 6-935 | CH ₂ OEt | Cl | SMe | Cl | |
| 6-936 | CH ₂ OEt | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-937 | CH ₂ OEt | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-938 | CH ₂ OEt | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-939 | CH ₂ OEt | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-940 | CH ₂ OEt | Cl | OMe | Cl | |
| 6-941 | CH ₂ OEt | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-942 | CH ₂ OEt | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-943 | CH ₂ OEt | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-944 | CH ₂ OEt | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-945 | CH ₂ OEt | Cl | 4-methoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-946 | CH ₂ OEt | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-947 | CH ₂ OEt | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|---------------------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-948 | CH ₂ OEt | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-949 | CH ₂ OEt | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,58 (bs, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 4,66 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 3,55 (s, 3H), 2,69 (s, 3H), 1,16 (t, 3H) |
| 6-950 | CH ₂ OEt | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,50 (bs, 1H), 8,03 (d, 1H), 8,00 (d, 1H), 4,66 (s, 2H), 3,56 (q, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,72 (s, 3H), 1,16 (t, 3H) |
| 6-951 | CH ₂ OEt | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-952 | CH ₂ OEt | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-953 | CH ₂ OEt | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-954 | CH ₂ OEt | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-955 | CH ₂ OEt | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-956 | CH ₂ OEt | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-957 | CH ₂ OEt | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-958 | CH ₂ OEt | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-959 | CH ₂ OEt | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-960 | CH ₂ OEt | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-961 | CH ₂ OEt | Me | Me | SMe | |
| 6-962 | CH ₂ OEt | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-963 | CH ₂ OEt | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-964 | CH ₂ OEt | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-965 | CH ₂ OEt | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-966 | CH ₂ OEt | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-967 | CH ₂ OEt | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-968 | CH ₂ OEt | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-969 | CH ₂ OEt | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-970 | CH ₂ OEt | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-971 | CH ₂ OEt | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-972 | CH ₂ OEt | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-973 | CH ₂ OEt | SMe | SMe | F | |
| 6-974 | CH ₂ OEt | SMe | SEt | F | |
| 6-975 | CH ₂ OEt | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-976 | CH ₂ OEt | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-977 | CH ₂ OEt | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-978 | xyclobutyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-979 | xyclobutyl | Cl | H | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|-------|------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-980 | xyclobutyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-981 | xyclobutyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-982 | xyclobutyl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-983 | xyclobutyl | SMe | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,19 (bs, 1H), 7,91 (bs, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 3,77-3,69 (m, 1H), 2,54 (s, 3H), 2,40-2,22 (m, 4H), 2,10-1,85 (m, 2H) |
| 6-984 | xyclobutyl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-985 | xyclobutyl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-986 | xyclobutyl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-987 | xyclobutyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-988 | xyclobutyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-989 | xyclobutyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-990 | xyclobutyl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-991 | xyclobutyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,49 (s, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,28 (q, 2H), 3,72 (m, 1H), 3,34 (s, 3H), 2,40 – 2,22 (m, 4H), 2,10 – 2,02 (m, 1H), 1,98 – 1,89 (m, 1H) |
| 6-992 | xyclobutyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-993 | xyclobutyl | Cl | 5-xyanometyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-994 | xyclobutyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-995 | xyclobutyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,45 (s, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 5,07 (s, 2H), 3,96 (m, 1H), 3,71 (m, 2H), 3,66-3,51 (m, 3H), 3,48 (s, 3H), 2,40 – 2,25 (m, 4H), 2,10 – 1,71 (m, 5H), 1,59- 1,49 (m, 1H) |
| 6-996 | xyclobutyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-997 | xyclobutyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,43 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 3,73 (t, 1H), 3,57 (s, 3H), 2,40 – 2,25 (m, 4H), 2,10 – 2,02 (m, 1H), 1,98 – 1,88 (m, |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|------------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 1H) |
| 6-998 | xyclobutyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-999 | xyclobutyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1000 | xyclobutyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-1001 | xyclobutyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-1002 | xyclobutyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1003 | xyclobutyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-1004 | xyclobutyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1005 | xyclobutyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1006 | xyclobutyl | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1007 | xyclobutyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1008 | xyclobutyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1009 | xyclobutyl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1010 | xyclobutyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1011 | xyclobutyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,37 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 3,73 (t, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,70 (s, 3H), 2,39 – 2,24 (m, 4H), 2,09 – 2,02 (m, 1H), 1,98 – 1,86 (m, 1H) |
| 6-1012 | xyclobutyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1013 | xyclobutyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1014 | xyclobutyl | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1015 | xyclobutyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1016 | xyclobutyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1017 | xyclobutyl | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1018 | xyclobutyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1019 | xyclobutyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1020 | xyclobut | Me | Cl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-----------------|---------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| | yl | | | | |
| 6-1021 | xyclobut yl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1022 | xyclobut yl | Me | Me | SMe | |
| 6-1023 | xyclobut yl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1024 | xyclobut yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1025 | xyclobut yl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1026 | xyclobut yl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1027 | xyclobut yl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1028 | xyclobut yl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1029 | xyclobut yl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1030 | xyclobut yl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1031 | xyclobut yl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1032 | xyclobut yl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1033 | xyclobut yl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1034 | xyclobut yl | SMe | SMe | F | |
| 6-1035 | xyclobut yl | SMe | SEt | F | |
| 6-1036 | xyclobut yl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1037 | xyclobut yl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1038 | xyclobut yl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-1039 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-1040 | xyclopen tyl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-1041 | xyclopen tyl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-1042 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-1043 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | Br | |
| 6-1044 | xyclopen tyl | SMe | H | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,16 (bs, 1H), 7,83 (bs, 1H), |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-----------------|----------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | | 7,64 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 2,56 (s, 3H), 2,09-1,97 (m, 2H), 1,87-75 (m, 2H), 1,72-1,60 (m, 4H) |
| 6-1045 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-1046 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-1047 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-1048 | xyclopen tyl | NO ₂ | H | F | |
| 6-1049 | xyclopen tyl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-1050 | xyclopen tyl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-1051 | xyclopen tyl | CH ₂ SO ₂ M e | H | Br | |
| 6-1052 | xyclopen tyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,47 (s, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,28 (q, 2H), 3,39 (s, 3H), 207 – 1,96 (m, 2H), 1,85 – 1,56 (m, 6H) |
| 6-1053 | xyclopen tyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-1054 | xyclopen tyl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,45 (s, 1H), 8,09 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 5,22-5,15 (m, 1H), 3,59 (dd, 1H), 3,42 (q, 2H), 3,14 (dd, 1H), 3,02 (m, 2H), 2,09 – 1,97 (m, 2H), 1,87-1,60 (m, 6H), 1,16 (t, 3H) |
| 6-1055 | xyclopen tyl | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1056 | xyclopen tyl | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,45 (s, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 5,07 (dd, 2H), 3,98 (m, 1H), 3,71 (dd, 1H), 3,64-3,51 (m, 3H), 3,49 (s, 3H), 2,08 – 1,47 (m, 12H), |
| 6-1057 | xyclopen tyl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-1058 | xyclopen tyl | Cl | SMe | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,42 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 3,57 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 2,07 – 1,96 (m, 2H), 1,88 – 1,46 (m, 6H) |
| 6-1059 | xyclopen tyl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-1060 | xyclopen tyl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1061 | xyclopen tyl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-----------------|----|-----------------------------------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-1062 | xyclopen tyl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-1063 | xyclopen tyl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1064 | xyclopen tyl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,23 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,72 (s, 3H), 2,99 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,08 – 1, 98 (m, 2H), 1,82 – 1,73 (m, 2H), 1,70- 1,49 (m, 4H) |
| 6-1065 | xyclopen tyl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1066 | xyclopen tyl | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1067 | xyclopen tyl | Cl | 4-metoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1068 | xyclopen tyl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1069 | xyclopen tyl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1070 | xyclopen tyl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1071 | xyclopen tyl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1072 | xyclopen tyl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-1073 | xyclopen tyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1074 | xyclopen tyl | Me | S(O)Me | CF ₃ | ¹ H NMR, CDCl ₃ , 400 MHz 10,85 (s, 1H), 8,18 (dd, 2H), 7,63 (d, 2H), 7,39 (dd, 2H), 7,05 (dd, 1H), 5,30 (s, 2H), 4,32 (q, 2H), 3,39 (s, 3H) |
| 6-1075 | xyclopen tyl | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1076 | xyclopen tyl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1077 | xyclopen tyl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1078 | xyclopen tyl | Me | 4-metoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1079 | xyclopen tyl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1080 | xyclopen tyl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1081 | xyclopen tyl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1082 | xyclopen tyl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1083 | xyclopen tyl | Me | Me | SMe | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| 6-1084 | xyclopen tyl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1085 | xyclopen tyl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1086 | xyclopen tyl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1087 | xyclopen tyl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1088 | xyclopen tyl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1089 | xyclopen tyl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1090 | xyclopen tyl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1091 | xyclopen tyl | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1092 | xyclopen tyl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1093 | xyclopen tyl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1094 | xyclopen tyl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1095 | xyclopen tyl | SMe | SMe | F | |
| 6-1096 | xyclopen tyl | SMe | SEt | F | |
| 6-1097 | xyclopen tyl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1098 | xyclopen tyl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1099 | xyclopen tyl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-1100 | Me ₂ N | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-1101 | Me ₂ N | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-1102 | Me ₂ N | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-1103 | Me ₂ N | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-1104 | Me ₂ N | NO ₂ | H | Br | |
| 6-1105 | Me ₂ N | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-1106 | Me ₂ N | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-1107 | Me ₂ N | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-1108 | Me ₂ N | NO ₂ | H | Me | |
| 6-1109 | Me ₂ N | NO ₂ | H | F | |
| 6-1110 | Me ₂ N | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-1111 | Me ₂ N | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-1112 | Me ₂ N | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-1113 | Me ₂ N | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-1114 | Me ₂ N | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-------------------|-----------------|--------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| 6-1115 | Me ₂ N | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1116 | Me ₂ N | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1117 | Me ₂ N | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1118 | Me ₂ N | Cl | SMe | Cl | |
| 6-1119 | Me ₂ N | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-1120 | Me ₂ N | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-1121 | Me ₂ N | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1122 | Me ₂ N | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-1123 | Me ₂ N | Cl | OMe | Cl | |
| 6-1124 | Me ₂ N | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1125 | Me ₂ N | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-1126 | Me ₂ N | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1127 | Me ₂ N | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1128 | Me ₂ N | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1129 | Me ₂ N | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1130 | Me ₂ N | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1131 | Me ₂ N | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1132 | Me ₂ N | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1133 | Me ₂ N | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-1134 | Me ₂ N | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1135 | Me ₂ N | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1136 | Me ₂ N | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1137 | Me ₂ N | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1138 | Me ₂ N | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1139 | Me ₂ N | Me | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1140 | Me ₂ N | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1141 | Me ₂ N | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1142 | Me ₂ N | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1143 | Me ₂ N | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1144 | Me ₂ N | Me | Me | SMe | |
| 6-1145 | Me ₂ N | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1146 | Me ₂ N | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1147 | Me ₂ N | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1148 | Me ₂ N | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1149 | Me ₂ N | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1150 | Me ₂ N | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1151 | Me ₂ N | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1152 | Me ₂ N | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|-------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|---------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-1153 | Me ₂ N | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1154 | Me ₂ N | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1155 | Me ₂ N | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1156 | Me ₂ N | SMe | SMe | F | |
| 6-1157 | Me ₂ N | SMe | SEt | F | |
| 6-1158 | Me ₂ N | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1159 | Me ₂ N | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1160 | Me ₂ N | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-1161 | Ph-NH | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-1162 | Ph-NH | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-1163 | Ph-NH | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-1164 | Ph-NH | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-1165 | Ph-NH | NO ₂ | H | Br | |
| 6-1166 | Ph-NH | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-1167 | Ph-NH | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-1168 | Ph-NH | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-1169 | Ph-NH | NO ₂ | H | Me | |
| 6-1170 | Ph-NH | NO ₂ | H | F | |
| 6-1171 | Ph-NH | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-1172 | Ph-NH | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-1173 | Ph-NH | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-1174 | Ph-NH | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 9,58 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 5,22 (s, 2H), 4,25 (q, 2H), 2,67 (s, 3H) |
| 6-1175 | Ph-NH | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-1176 | Ph-NH | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1177 | Ph-NH | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1178 | Ph-NH | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1179 | Ph-NH | Cl | SMe | Cl | |
| 6-1180 | Ph-NH | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-1181 | Ph-NH | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-1182 | Ph-NH | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1183 | Ph-NH | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-1184 | Ph-NH | Cl | OMe | Cl | |
| 6-1185 | Ph-NH | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1186 | Ph-NH | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-1187 | Ph-NH | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1188 | Ph-NH | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|----------------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| 6-1189 | Ph-NH | Cl | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1190 | Ph-NH | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1191 | Ph-NH | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1192 | Ph-NH | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1193 | Ph-NH | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1194 | Ph-NH | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-1195 | Ph-NH | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1196 | Ph-NH | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1197 | Ph-NH | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1198 | Ph-NH | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1199 | Ph-NH | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1200 | Ph-NH | Me | 4-methoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1201 | Ph-NH | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1202 | Ph-NH | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1203 | Ph-NH | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1204 | Ph-NH | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1205 | Ph-NH | Me | Me | SMe | |
| 6-1206 | Ph-NH | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1207 | Ph-NH | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1208 | Ph-NH | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1209 | Ph-NH | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1210 | Ph-NH | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1211 | Ph-NH | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1212 | Ph-NH | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1213 | Ph-NH | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1214 | Ph-NH | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1215 | Ph-NH | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1216 | Ph-NH | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1217 | Ph-NH | SMe | SMe | F | |
| 6-1218 | Ph-NH | SMe | SEt | F | |
| 6-1219 | Ph-NH | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1220 | Ph-NH | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1221 | Ph-NH | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-1222 | morpholin-1-yl | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-1223 | morpholin-1-yl | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-1224 | morpholin-1-yl | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-1225 | morpholin-1-yl | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-1226 | morpholin | NO ₂ | H | Br | |

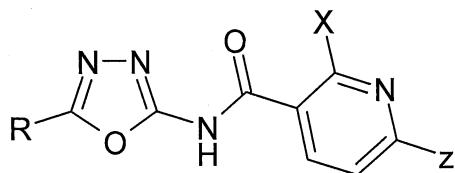
| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|--------------------|------------------------------------|----------------------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | n-1-yl | | | | |
| 6-1227 | morpholi n-1-yl | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-1228 | morpholi n-1-yl | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-1229 | morpholi n-1-yl | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-1230 | morpholi n-1-yl | NO ₂ | H | Me | |
| 6-1231 | morpholi n-1-yl | NO ₂ | H | F | |
| 6-1232 | morpholi n-1-yl | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-1233 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-1234 | morpholi n-1-yl | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-1235 | morpholi n-1-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 9,58 (bs, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 5,22 (s, 2H), 4,26 (q, 2H), 3,70-2,94 (m, 11H) |
| 6-1236 | morpholi n-1-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-1237 | morpholi n-1-yl | Cl | 5-xyanomethyl-4,5- dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1238 | morpholi n-1-yl | Cl | 4,5-dihydro-1,2- oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1239 | morpholi n-1-yl | Cl | CH ₂ OCH ₂ - tetrahydrofuran-2- yl | SO ₂ Me | |
| 6-1240 | morpholi n-1-yl | Cl | SMe | Cl | |
| 6-1241 | morpholi n-1-yl | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-1242 | morpholi n-1-yl | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-1243 | morpholi n-1-yl | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1244 | morpholi n-1-yl | Cl | OCH ₂ -xyclopropyl | Cl | |
| 6-1245 | morpholi n-1-yl | Cl | OMe | Cl | |
| 6-1246 | morpholi n-1-yl | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1247 | morpholi n-1-yl | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-1248 | morpholi n-1-yl | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1249 | morpholi | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|--------------------|-----------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| | n-1-yl | | | | |
| 6-1250 | morpholi n-1-yl | Cl | 4-metoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1251 | morpholi n-1-yl | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1252 | morpholi n-1-yl | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1253 | morpholi n-1-yl | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1254 | morpholi n-1-yl | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1255 | morpholi n-1-yl | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-1256 | morpholi n-1-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1257 | morpholi n-1-yl | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1258 | morpholi n-1-yl | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1259 | morpholi n-1-yl | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1260 | morpholi n-1-yl | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1261 | morpholi n-1-yl | Me | 4-metoxy-pyrazol- 1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1262 | morpholi n-1-yl | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1263 | morpholi n-1-yl | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1264 | morpholi n-1-yl | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1265 | morpholi n-1-yl | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1266 | morpholi n-1-yl | Me | Me | SMe | |
| 6-1267 | morpholi n-1-yl | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1268 | morpholi n-1-yl | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1269 | morpholi n-1-yl | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1270 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1271 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1272 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1273 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1274 | morpholi | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|--------------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| | n-1-yl | | | | |
| 6-1275 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1276 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1277 | morpholi n-1-yl | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1278 | morpholi n-1-yl | SMe | SMe | F | |
| 6-1279 | morpholi n-1-yl | SMe | SEt | F | |
| 6-1280 | morpholi n-1-yl | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1281 | morpholi n-1-yl | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1282 | morpholi n-1-yl | F | SMe | CF ₃ | |
| 6-1283 | sec-Bu | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 6-1284 | sec-Bu | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 6-1285 | sec-Bu | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 6-1286 | sec-Bu | NO ₂ | H | OMe | |
| 6-1287 | sec-Bu | NO ₂ | H | Br | |
| 6-1288 | sec-Bu | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 6-1289 | sec-Bu | NO ₂ | H | NO ₂ | |
| 6-1290 | sec-Bu | NO ₂ | H | Cl | |
| 6-1291 | sec-Bu | NO ₂ | H | Me | |
| 6-1292 | sec-Bu | NO ₂ | H | F | |
| 6-1293 | sec-Bu | OMe | H | SO ₂ Me | |
| 6-1294 | sec-Bu | CF ₃ | H | NO ₂ | |
| 6-1295 | sec-Bu | CH ₂ SO ₂ Me | H | Br | |
| 6-1296 | sec-Bu | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 6-1297 | sec-Bu | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SMe | |
| 6-1298 | sec-Bu | Cl | 5-xyanomethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1299 | sec-Bu | Cl | 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1300 | sec-Bu | Cl | CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1301 | sec-Bu | Cl | SMe | Cl | |
| 6-1302 | sec-Bu | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 6-1303 | sec-Bu | Cl | Me | SO ₂ Et | |
| 6-1304 | sec-Bu | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 6-1305 | sec-Bu | Cl | OCH ₂ -cyclopropyl | Cl | |
| 6-1306 | sec-Bu | Cl | OMe | Cl | |

| Số | R | X | Y | Z | Dữ liệu vật lý |
|--------|--------|---------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|
| 6-1307 | sec-Bu | Cl | NHAc | Cl | |
| 6-1308 | sec-Bu | Cl | OCH ₂ C(O)NMe ₂ | Cl | |
| 6-1309 | sec-Bu | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1310 | sec-Bu | Cl | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1311 | sec-Bu | Cl | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1312 | sec-Bu | Cl | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1313 | sec-Bu | Cl | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1314 | sec-Bu | Cl | F | SO ₂ Me | |
| 6-1315 | sec-Bu | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 6-1316 | sec-Bu | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 6-1317 | sec-Bu | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1318 | sec-Bu | Me | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1319 | sec-Bu | Me | SMe | CF ₃ | |
| 6-1320 | sec-Bu | Me | SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 6-1321 | sec-Bu | Me | pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1322 | sec-Bu | Me | 4-metoxy-pyrazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1323 | sec-Bu | Me | 1,2,3-triazol-1-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1324 | sec-Bu | Me | 1,2,3-triazol-2-yl | SO ₂ Me | |
| 6-1325 | sec-Bu | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 6-1326 | sec-Bu | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 6-1327 | sec-Bu | Me | Me | SMe | |
| 6-1328 | sec-Bu | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 6-1329 | sec-Bu | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1330 | sec-Bu | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 6-1331 | sec-Bu | CF ₃ | F | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1332 | sec-Bu | CF ₃ | SMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1333 | sec-Bu | CF ₃ | SEt | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1334 | sec-Bu | CF ₃ | S(O)Et | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1335 | sec-Bu | CF ₃ | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1336 | sec-Bu | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ OMe | SO ₂ CH ₃ | |
| 6-1337 | sec-Bu | CF ₃ | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 6-1338 | sec-Bu | CF ₃ | CH ₂ O-tetrahydrofuran-2-yl | SO ₂ Et | |
| 6-1339 | sec-Bu | SMe | SMe | F | |
| 6-1340 | sec-Bu | SMe | SEt | F | |
| 6-1341 | sec-Bu | SO ₂ CH ₃ | F | Cl | |
| 6-1342 | sec-Bu | F | S(O)Me | CF ₃ | |
| 6-1343 | sec-Bu | F | SMe | CF ₃ | |

Bảng 7: Hợp chất có công thức chung (I) theo sáng chế, trong đó A là nitơ



| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-------------------------------------|----|-----------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-1 | H | Cl | CF ₃ | |
| 7-2 | Me | Cl | CF ₃ | 12,59 (bs, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,12 (d, 1H) |
| 7-3 | Et | Cl | CF ₃ | ¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz 12,59 (bs, 1H), 8,49 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 2,85 (q, 2H), 1,28 (t, 3H) |
| 7-4 | CF ₃ | Cl | CF ₃ | |
| 7-5 | CH ₂ OMe | Cl | CF ₃ | |
| 7-6 | c-Pr | Cl | CF ₃ | |
| 7-7 | CO ₂ Et | Cl | CF ₃ | 13,14 (bs, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 4,42 (q, 2H), 1,33 (t, 3H) |
| 7-8 | CO ₂ Me | Cl | CF ₃ | |
| 7-9 | benzyl | Cl | CF ₃ | 8,46 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,41-7,28 (m, 3H), 7,17 (bs, 2H), 4,25 (s, 2H) |
| 7-10 | phenyl | Cl | CF ₃ | 12,88 (bs, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,94 (bs, 2H), 7,67-7,57 (m, 3H) |
| 7-11 | pyrazin-2-yl | Cl | CF ₃ | 13,10 (bs, 1H), 9,36 (s, 1H), 8,88 (m, 2H), 8,54 (d, 1H), 8,17 (d, 1H) |
| 7-12 | 4-OMe-Ph | Cl | CF ₃ | 12,78 (bs, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 7,38 (d, 2H), 7,17 (d, 2H), 3,84 (s, 3H) |
| 7-13 | 4-Cl-Ph | Cl | CF ₃ | 12,90 (bs, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,94 (d, 2H), 7,69 (d, 2H) |
| 7-14 | t-Bu | Cl | CF ₃ | 12,60 (bs, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 1,32 (bs, 9H) |
| 7-15 | furan-2-yl | Cl | CF ₃ | 12,83 (bs, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,29 (s, 1H), 6,80 (m, 1H) |
| 7-16 | i-Pr | Cl | CF ₃ | 12,26 (bs, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,25 (s, 3H), 3,19 (m, 1H), 1,30 (d, 6H) |
| 7-17 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | CF ₃ | 12,61 (bs, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 3,69 (t, 2H), 3,09 (t, 2H) |
| 7-18 | CH ₂ CF ₃ | Cl | CF ₃ | 12,82 (bs, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 4,33 (q, 2H) |
| 7-19 | tetrahydrofuran-2-yl | Cl | CF ₃ | 12,73 (bs, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 5,11 (t, 1H), 3,84 (t, 2H), 2,31-2,18 (m, 2H), 2,0 (q, 2H) |
| 7-20 | n-Pr | Cl | CF ₃ | 12,61 (bs, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,12 |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-------------------------------------|----|-----------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | (d, 1H), 2,81 (t, 2H), 1,71 (q, 2H), 0,96 (t, 3H) |
| 7-21 | CH ₂ OEt | Cl | CF ₃ | |
| 7-22 | xyclobutyl | Cl | CF ₃ | 12,62 (bs, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 3,76-3,72 (m, 1H), 2,41-2,22 (m, 4H) |
| 7-23 | xcyclopentyl | Cl | CF ₃ | 12,65 (bs, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 3,32 (m, 1H), 2,18-1,97 (m, 2H), 1,83-1,73 (m, 2H), 1,71-1,61 (m, 6H) |
| 7-24 | Me ₂ N | Cl | CF ₃ | |
| 7-25 | Ph-NH | Cl | CF ₃ | |
| 7-26 | morpholin-1-yl | Cl | CF ₃ | 8,59 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 3,67 (m, 4H), 3,60 (m, 4H) |
| 7-27 | H | Cl | Cl | |
| 7-28 | Me | Cl | Cl | |
| 7-29 | Et | Cl | Cl | |
| 7-30 | CF ₃ | Cl | Cl | 13,21 (s, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,78 (d, 1H) |
| 7-31 | CH ₂ OMe | Cl | Cl | |
| 7-32 | c-Pr | Cl | Cl | |
| 7-33 | CO ₂ Et | Cl | Cl | |
| 7-34 | CO ₂ Me | Cl | Cl | |
| 7-35 | benzyl | Cl | Cl | |
| 7-36 | phenyl | Cl | Cl | |
| 7-37 | pyrazin-2-yl | Cl | Cl | |
| 7-38 | 4-OMe-Ph | Cl | Cl | |
| 7-39 | 4-Cl-Ph | Cl | Cl | |
| 7-40 | t-Bu | Cl | Cl | |
| 7-41 | furan-2-yl | Cl | Cl | |
| 7-42 | i-Pr | Cl | Cl | |
| 7-43 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | Cl | |
| 7-44 | CH ₂ CF ₃ | Cl | Cl | |
| 7-45 | tetrahydrofuran-2-yl | Cl | Cl | |
| 7-46 | n-Pr | Cl | Cl | |
| 7-47 | CH ₂ OEt | Cl | Cl | |
| 7-48 | xyclobutyl | Cl | Cl | |
| 7-49 | xcyclopentyl | Cl | Cl | |
| 7-50 | Me ₂ N | Cl | Cl | |
| 7-51 | Ph-NH | Cl | Cl | |
| 7-52 | morpholin-1-yl | Cl | Cl | |
| 7-53 | H | Me | Cl | |
| 7-54 | Me | Me | Cl | |
| 7-55 | Et | Me | Cl | 11,43 (s, 1H), 8,04 (d, 1H), 4,45 (d, 1H), 2,81 (q, 2H), 2,54 (s, 3H), |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|------|-------------------------------------|----|-----|------------------------------------------------------------------------|
| | | | | 1,27 (t, 3H) |
| 7-56 | CF ₃ | Me | Cl | |
| 7-57 | CH ₂ OMe | Me | Cl | |
| 7-58 | c-Pr | Me | Cl | |
| 7-59 | CO ₂ Et | Me | Cl | |
| 7-60 | CO ₂ Me | Me | Cl | |
| 7-61 | benzyl | Me | Cl | |
| 7-62 | phenyl | Me | Cl | |
| 7-63 | pyrazin-2-yl | Me | Cl | |
| 7-64 | 4-OMe-Ph | Me | Cl | |
| 7-65 | 4-Cl-Ph | Me | Cl | |
| 7-66 | t-Bu | Me | Cl | |
| 7-67 | furan-2-yl | Me | Cl | |
| 7-68 | i-Pr | Me | Cl | |
| 7-69 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | Cl | |
| 7-70 | CH ₂ CF ₃ | Me | Cl | |
| 7-71 | tetrahydrofuran-2-yl | Me | Cl | |
| 7-72 | n-Pr | Me | Cl | |
| 7-73 | CH ₂ OEt | Me | Cl | |
| 7-74 | xyclobutyl | Me | Cl | |
| 7-75 | xyclopentyl | Me | Cl | |
| 7-76 | Me ₂ N | Me | Cl | |
| 7-77 | Ph-NH | Me | Cl | |
| 7-78 | morpholin-1-yl | Me | Cl | |
| 7-79 | H | Cl | SMe | |
| 7-80 | Me | Cl | SMe | |
| 7-81 | Et | Cl | SMe | |
| 7-82 | CF ₃ | Cl | SMe | |
| 7-83 | CH ₂ OMe | Cl | SMe | |
| 7-84 | c-Pr | Cl | SMe | |
| 7-85 | CO ₂ Et | Cl | SMe | |
| 7-86 | CO ₂ Me | Cl | SMe | |
| 7-87 | benzyl | Cl | SMe | |
| 7-88 | phenyl | Cl | SMe | |
| 7-89 | pyrazin-2-yl | Cl | SMe | |
| 7-90 | 4-OMe-Ph | Cl | SMe | |
| 7-91 | 4-Cl-Ph | Cl | SMe | |
| 7-92 | t-Bu | Cl | SMe | |
| 7-93 | furan-2-yl | Cl | SMe | |
| 7-94 | i-Pr | Cl | SMe | |
| 7-95 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | SMe | |
| 7-96 | CH ₂ CF ₃ | Cl | SMe | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|----|--------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-97 | tetrahydrofuran-2-yl | Cl | SMe | |
| 7-98 | n-Pr | Cl | SMe | |
| 7-99 | CH ₂ OEt | Cl | SMe | |
| 7-100 | xyclobutyl | Cl | SMe | |
| 7-101 | xyclopentyl | Cl | SMe | |
| 7-102 | Me ₂ N | Cl | SMe | |
| 7-103 | Ph-NH | Cl | SMe | |
| 7-104 | morpholin-1-yl | Cl | SMe | |
| 7-105 | H | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-106 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-107 | Et | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-108 | CF ₃ | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-109 | CH ₂ OMe | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-110 | c-Pr | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-111 | CO ₂ Et | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-112 | CO ₂ Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-113 | benzyl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-114 | phenyl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-115 | pyrazin-2-yl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-116 | 4-OMe-Ph | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-117 | 4-Cl-Ph | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-118 | t-Bu | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-119 | furan-2-yl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-120 | i-Pr | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-121 | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-122 | CH ₂ CF ₃ | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-123 | tetrahydrofuran-2-yl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-124 | n-Pr | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-125 | CH ₂ OEt | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-126 | xyclobutyl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-127 | xyclopentyl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-128 | Me ₂ N | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-129 | Ph-NH | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-130 | morpholin-1-yl | Cl | SO ₂ Me | |
| 7-131 | H | Me | CF ₃ | |
| 7-132 | Me | Me | CF ₃ | |
| 7-133 | Et | Me | CF ₃ | |
| 7-134 | CF ₃ | Me | CF ₃ | 13,06 (bs, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 2,67 (s, 3H) |
| 7-135 | CH ₂ OMe | Me | CF ₃ | |
| 7-136 | c-Pr | Me | CF ₃ | 12,30 (bs, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 2,63 (s, 3H), 2,19 (m, |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|---------------------|-----------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | | | | 1H), 1,10 (m, 2H), 0,96 (m, 2H) |
| 7-137 | CO ₂ Et | Me | CF ₃ | |
| 7-138 | CO ₂ Me | Me | CF ₃ | |
| 7-139 | benzyl | Me | CF ₃ | |
| 7-140 | phenyl | Me | CF ₃ | |
| 7-141 | pyrazin-2-yl | Me | CF ₃ | |
| 7-142 | 4-OMe-Ph | Me | CF ₃ | 12,50 (bs, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,89 (d, 2H), 7,17 (d, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,69 (s, 3H) |
| 7-143 | 4-Cl-Ph | Me | CF ₃ | |
| 7-144 | t-Bu | Me | CF ₃ | 12,29 (bs, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 2,66 (s, 3H), 1,35 (s, 9H) |
| 7-145 | furan-2-yl | Me | CF ₃ | |
| 7-146 | i-Pr | Me | CF ₃ | 12,33 (bs, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 3,17 (m, 1H), 2,66 (s, 3H), 1,30 (d, 6H) |
| 7-147 | CH ₂ CH ₂ OMe | Me | CF ₃ | |
| 7-148 | CH ₂ CF ₃ | Me | CF ₃ | |
| 7-149 | tetrahydrofuran-2-yl | Me | CF ₃ | |
| 7-150 | n-Pr | Me | CF ₃ | 12,30 (bs, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 2,81 (s, 2H), 2,65 (s, 3H), 1,71 (m, 2H), 0,97 (t, 3H) |
| 7-151 | CH ₂ OEt | Me | CF ₃ | |
| 7-152 | xyclobutyl | Me | CF ₃ | 12,32 (bs, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 3,76-3,70 (m, 1H), 2,66 (s, 3H), 2,41-2,22 (m, 4H), 2,12-2,00 (m, 1H), 1,98-1,91 (m, 1H) |
| 7-153 | xyclopentyl | Me | CF ₃ | 12,28 (bs, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 3,37 (m, 1H), 2,65 (s, 3H), 2,09-1,98 (m, 2H), 1,88-1,76 (m, 2H), 1,75-1,69 (m, 4H) |
| 7-154 | Me ₂ N | Me | CF ₃ | |
| 7-155 | Ph-NH | Me | CF ₃ | 10,81 (s, 1H), 8,41 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,64 (d, 2H), 7,39 (dd, 2H), 7,05 (dd, 1H), 2,93 (s, 3H) |
| 7-156 | morpholin-1-yl | Me | CF ₃ | |
| 7-157 | H | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-158 | Me | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,26 (bs, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,25 (s, 3H) |
| 7-159 | Et | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,28 (bs, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,86 (q, 2H), 1,26 (t, 3H) |
| 7-160 | CF ₃ | CH ₂ OMe | CF ₃ | 13,03 (bs, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,25 (s, 3H) |
| 7-161 | CH ₂ OMe | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,41 (bs, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,03 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 4,63 (s, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,25 (s, 3H) |
| 7-162 | c-Pr | CH ₂ OMe | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|---------------------|-----------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-163 | CO ₂ Et | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-164 | CO ₂ Me | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-165 | benzyl | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-166 | phenyl | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-167 | pyrazin-2-yl | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-168 | 4-OMe-Ph | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-169 | 4-Cl-Ph | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-170 | t-Bu | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-171 | furan-2-yl | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-172 | i-Pr | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,26 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,23 (s, 3H), 3,18 (m, 1H), 1,29 (d, 6H) |
| 7-173 | CH ₂ CH ₂ OMe | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,28 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 5,07 (dd, 2H), 4,71 (s, 2H), 3,70 (t, 2H), 3,25 (2s, 6H), 3,07 (t, 2H) |
| 7-174 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-175 | tetrahydrofuran-2-yl | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,41 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 5,11 (dd, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,84 (t, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,32-2,14 (m, 2H), 2,06-1,90 (m, 2H) |
| 7-176 | n-Pr | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,22 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 4,70 (s, 2H), 3,23 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 1,60 (m, 2H), 0,94 (t, 3H) |
| 7-177 | CH ₂ OEt | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-178 | xyclobutyl | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,26 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,78-3,70 (m, 1H), 3,23 (s, 3H), 2,40 – 2,22 (m, 4H), 2,10 – 1,88 (m, 1H), 1,97 – 1,88 (m, 1H) |
| 7-179 | xyclopentyl | CH ₂ OMe | CF ₃ | 12,32 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,09 – 1,98 (m, 2H), 1,88 – 1,60 (m, 6H) |
| 7-180 | Me ₂ N | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-181 | Ph-NH | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-182 | morpholin-1-yl | CH ₂ OMe | CF ₃ | |
| 7-183 | H | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-184 | Me | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-185 | Et | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-186 | CF ₃ | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-187 | CH ₂ OMe | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-188 | c-Pr | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-189 | CO ₂ Et | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-190 | CO ₂ Me | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-191 | benzyl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-192 | phenyl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-193 | pyrazin-2-yl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-194 | 4-OMe-Ph | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-195 | 4-Cl-Ph | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-196 | t-Bu | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-197 | furan-2-yl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-198 | i-Pr | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-199 | CH ₂ CH ₂ OMe | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-200 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-201 | tetrahydrofuran-2-yl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-202 | n-Pr | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-203 | CH ₂ OEt | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-204 | xyclobutyl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-205 | xyclopentyl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-206 | Me ₂ N | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-207 | Ph-NH | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-208 | morpholin-1-yl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 7-209 | H | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-210 | Me | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-211 | Et | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-212 | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-213 | CH ₂ OMe | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-214 | c-Pr | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-215 | CO ₂ Eт | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-216 | CO ₂ Me | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-217 | benzyl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-218 | phenyl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-219 | pyrazin-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-220 | 4-OMe-Ph | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-221 | 4-Cl-Ph | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-222 | t-Bu | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-223 | furan-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-224 | i-Pr | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-225 | CH ₂ CH ₂ OMe | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-226 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-227 | tetrahydrofuran-2-yl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-228 | n-Pr | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-229 | CH ₂ OEt | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-230 | xyclobutyl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-231 | xyclopentyl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-232 | Me ₂ N | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|----------------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-233 | Ph-NH | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-234 | morpholin-1-yl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 7-235 | H | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-236 | Me | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-237 | Et | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-238 | CF ₃ | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-239 | CH ₂ OMe | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-240 | c-Pr | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-241 | CO ₂ Et | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-242 | CO ₂ Me | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-243 | benzyl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-244 | phenyl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-245 | pyrazin-2-yl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-246 | 4-OMe-Ph | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-247 | 4-Cl-Ph | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-248 | t-Bu | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-249 | furan-2-yl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-250 | i-Pr | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-251 | CH ₂ CH ₂ OMe | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-252 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-253 | tetrahydro-furan-2-yl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-254 | n-Pr | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-255 | CH ₂ OEt | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-256 | xyclobutyl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-257 | xyclopentyl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-258 | Me ₂ N | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-259 | Ph-NH | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-260 | morpholin-1-yl | CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe | CF ₃ | |
| 7-261 | H | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-262 | Me | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-263 | Et | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-264 | CF ₃ | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-265 | CH ₂ OMe | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-266 | c-Pr | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-267 | CO ₂ Et | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|--------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-268 | CO ₂ Me | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-269 | benzyl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-270 | phenyl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-271 | pyrazin-2-yl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-272 | 4-OMe-Ph | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-273 | 4-Cl-Ph | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-274 | t-Bu | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-275 | furan-2-yl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-276 | i-Pr | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-277 | CH ₂ CH ₂ OMe | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-278 | CH ₂ CF ₃ | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-279 | tetrahydro-furan-2-yl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-280 | n-Pr | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-281 | CH ₂ OEt | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-282 | xyclobutyl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-283 | xyclopentyl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-284 | Me ₂ N | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-285 | Ph-NH | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-286 | morpholin-1-yl | OCH ₂ -tetrahydro-furan-2-yl | CF ₃ | |
| 7-287 | H | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)metyl | CF ₃ | |
| 7-288 | Me | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)metyl | CF ₃ | 8,32 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,50 (s, 2H), 3,21 (m, 4H), 2,18 (m, 2H) |
| 7-289 | Et | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)metyl | CF ₃ | |
| 7-290 | CF ₃ | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)metyl | CF ₃ | 8,32 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 4,48 (s, 2H), 3,14 (m, 4H), 2,17 (m, 2H) |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|---------------------------------------------|-----------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-291 | CH ₂ OMe | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-292 | c-Pr | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-293 | CO ₂ Et | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-294 | CO ₂ Me | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-295 | benzyl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-296 | phenyl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-297 | pyrazin-2-yl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-298 | 4-OMe-Ph | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-299 | 4-Cl-Ph | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-300 | t-Bu | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-301 | furan-2-yl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-302 | i-Pr | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-303 | CH ₂ CH ₂ OMe | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | 12,34 (bs, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 4,50 (s, 2H), 3,67 (t, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,21 (m, 4H), 3,09 (t, 2H), 2,18 (m, 2H) |
| 7-304 | CH ₂ CF ₃ | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | 12,59 (bs, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,03 (d, 1H), 4,48 (s, 2H), 4,32 (q, 2H), 3,17 (m, 4H), 2,17 (m, 2H) |
| 7-305 | tetrahydro-furan-2-yl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-306 | n-Pr | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-307 | CH ₂ OEt | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|---------------------|---------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-308 | xyclobutyl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-309 | xclopentyl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-310 | Me ₂ N | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-311 | Ph-NH | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-312 | morpholin-1-yl | (1,1-dioxido-1,2-thiadiazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-313 | H | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-314 | Me | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-315 | Et | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-316 | CF ₃ | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-317 | CH ₂ OMe | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-318 | c-Pr | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-319 | CO ₂ Et | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-320 | CO ₂ Me | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-321 | benzyl | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-322 | phenyl | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-323 | pyrazin-2-yl | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-324 | 4-OMe-Ph | (3-metyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-325 | 4-Cl-Ph | (3-metyl-2- | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| | | oxoimidazolidin-1-yl)methyl | | |
| 7-326 | t-Bu | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-327 | furan-2-yl | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-328 | i-Pr | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-329 | CH ₂ CH ₂ OMe | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-330 | CH ₂ CF ₃ | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-331 | tetrahydro-furan-2-yl | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-332 | n-Pr | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-333 | CH ₂ OEt | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-334 | xyclobutyl | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-335 | xyclopentyl | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-336 | Me ₂ N | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-337 | Ph-NH | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-338 | morpholin-1-yl | (3-methyl-2-oxoimidazolidin-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-339 | H | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-340 | Me | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-341 | Et | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|-------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| 7-342 | CF ₃ | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-343 | CH ₂ OMe | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-344 | c-Pr | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-345 | CO ₂ Et | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-346 | CO ₂ Me | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-347 | benzyl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-348 | phenyl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-349 | pyrazin-2-yl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-350 | 4-OMe-Ph | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-351 | 4-Cl-Ph | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-352 | t-Bu | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-353 | furan-2-yl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-354 | i-Pr | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-355 | CH ₂ CH ₂ OMe | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5- | CF ₃ | |

| Số | R | X | Z | Dữ liệu vật lý (¹ H NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz) |
|-------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------------------|
| | | dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | | |
| 7-356 | CH ₂ CF ₃ | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-357 | tetrahydro-furan-2-yl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-358 | n-Pr | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-359 | CH ₂ OEt | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-360 | xyclobutyl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-361 | xyclopentyl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-362 | Me ₂ N | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-363 | Ph-NH | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-364 | morpholin-1-yl | (3-methoxy-4-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-1-yl)methyl | CF ₃ | |
| 7-365 | i-Pr | Cl | Me | 11,36 (s, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 3,25 (m, 1H), 1,31 (t, 3H) |

B. Ví dụ điều chế

a) Sản phẩm tạo bụi thu được bằng cách trộn 10 phần trọng lượng của hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó và 90 phần trọng lượng bột talc làm chất trơ và nghiền hỗn hợp trong máy nghiền búa.

b) Bột thấm ướt phân tán trong nước dễ dàng thu được bằng cách trộn 25 phần trọng lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó, 64 phần trọng lượng thạch

anh chứa cao lanh làm chất trơ, 10 phần trọng lượng kali lignosulfonat và 1 phần trọng lượng natri oleylmethyltaurat làm chất làm ướt và chất phân tán và nghiền hỗn hợp trong máy nghiền đĩa đĩa chốt.

c) Thể đặc phân tán có thể phân tán trong nước dễ dàng thu được bằng cách trộn 20 phần trọng lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó với 6 phần trọng lượng alkylphenol polyglycol ete (®Triton X 207), 3 phần trọng lượng isotridecanol polyglycol ete (8EO) và 71 phần trọng lượng dầu khoáng parafin (khoảng sôi ví dụ nằm trong khoảng từ 255 đến lớn hơn 277°C) và nghiền hỗn hợp trong máy nghiền hình cầu đến mịn nhỏ 5 micron.

d) Thể đặc nhũ hóa được thu được từ 15 phần trọng lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó, 75 phần trọng lượng xyclohexanon làm dung môi và 10 phần trọng lượng nonylphenol được etoxyl hóa làm chất nhũ hóa.

e) Hạt có thể phân tán trong nước thu được bằng cách trộn
 75 phần trọng lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó,
 10 phần trọng lượng canxi lignosulfonat,
 5 phần trọng lượng natri laurylsulfat,
 3 phần trọng lượng rượu polyvinyl và
 7 phần trọng lượng caolanh,
 nghiền hỗn hợp này trong máy nghiền đĩa chốt và nghiền bột theo kiểu tầng sôi
 bằng cách phun trên nước làm chất lỏng tạo hạt.

f) Hạt có thể phân tán trong nước cũng thu được bằng cách tạo đồng nhất và
 nghiền trước

25 phần trọng lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó,
 5 phần trọng lượng natri 2,2'-dinaphthylmetan-6,6'-disulfonat,
 2 phần trọng lượng natri oleylmethyltaurat,
 1 phần trọng lượng rượu polyvinyl,
 17 phần trọng lượng canxi carbonat và
 50 phần trọng lượng nước

trong máy nghiền dạng keo, sau đó nghiền hỗn hợp này trong máy nghiền tạo hạt và nghiền nhỏ và làm khô huyền phù thu được trong tháp phun bằng các phương tiện vòi một chất.

C. Ví dụ sinh học

1. Tác dụng diệt cỏ trước khi nảy mầm diệt thực vật gây hại

Hạt của thực vật dạng cỏ dại có một lá mầm và có hai lá mầm và cây trồng được đặt vào các chậu sợi gỗ trong đất sét trộn cát và được phủ đất. Sau đó, áp dụng hợp chất theo sáng chế được điều chế ở dạng bột thẩm ướt (WP) hoặc thể đặc nhũ hóa (EC) lên bề mặt của đất phủ như huyền phù trong nước hoặc nhũ tương ở tỷ lệ áp dụng nước nằm trong khoảng từ 600 đến 800 l/ha (được biến đổi) kèm bổ sung chất làm ướt 0,2%. Sau khi xử lý, đặt các chậu này vào nhà kính và giữ trong các điều kiện phát triển tốt đối với các thực vật thử nghiệm. Đánh giá tổn hại đối với thực vật thử nghiệm bằng mắt thường sau thời gian thử nghiệm 3 tuần bằng cách so sánh với thực vật đối chứng không được xử lý (hoạt tính diệt cỏ theo phần trăm (%): 100% tác dụng = thực vật bị chết, 0% tác dụng = tương tự thực vật đối chứng). Ví dụ, mỗi hợp chất số 6-028, 6-767, 6-889 và 6-627 ở tỷ lệ áp dụng 320g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt Amaranthus retroflexus và Veronica persica. Mỗi hợp chất số 3-264, 3-145, 4-145, 4-144, 2-264 và 3-264 ở tỷ lệ áp dụng 320g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt Abutilon theophrasti và Matricaria inodora. Mỗi hợp chất số 6-645 và 2-255 ở tỷ lệ áp dụng 320g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt Setaria viridis và Viola tricolor. Mỗi hợp chất số 6-705, 4-255 và 2-246 ở tỷ lệ áp dụng 320g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt Amaranthus retroflexus và Matricaria inodora.

2. Tác dụng diệt cỏ sau nảy mầm diệt thực vật gây hại

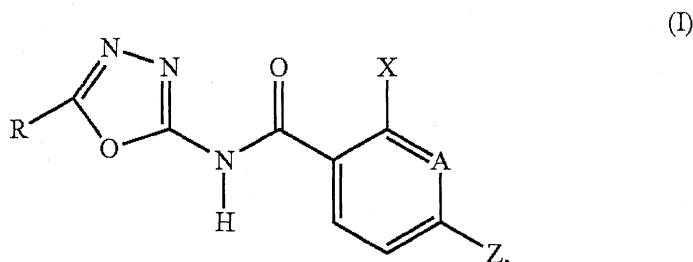
Hạt của cỏ dại có một lá mầm và có hai lá mầm và cây trồng được đặt vào đất sét trộn cát trong chậu sợi gỗ, phủ bằng đất và cấy trong nhà kính trong các điều kiện phát triển tốt. Từ 2 đến 3 tuần sau khi gieo hạt, thực vật thử nghiệm được xử lý ở giai đoạn một lá. Sau đó, phun hợp chất theo sáng chế được điều chế ở dạng bột thẩm ướt (WP) hoặc thể đặc nhũ hóa (EC) lên các phần xanh của thực vật nh huyền phù trong nước hoặc nhũ tương ở tỷ lệ áp dụng trong nước nằm trong khoảng từ 600 đến 800l/ha

(được biến đổi) kèm bô sung chất làm urôt 0,2%. Sau khi thực vật thử nghiệm được để đứng yên trong nhà kính trong các điều kiện phát triển tối ưu trong khoảng 3 tuần, đánh giá tác dụng của chế phẩm bằng mắt thường khi so với thực vật đối chứng không được xử lý (tác dụng diệt cỏ theo phần trăm (%): 100% tác dụng = thực vật bị chết, 0% tác dụng = tương tự thực vật đối chứng).

Ví dụ, mỗi hợp chất số 7-3, 6-584, 6-645, 2-240, 2-246 và 3-264 ở tỷ lệ áp dụng 80g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt *Echinochloa crus galli* và *Pharbitis purpureum*. Mỗi hợp chất số 2-255, 4-144, 2-246, 3-264 và 5-290 ở tỷ lệ áp dụng 80 g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt *Abutilon theophrasti* và *Amaranthus retroflexus*. Mỗi hợp chất số 4-145, 6-767, 6-889 và 2-264 ở tỷ lệ áp dụng 80g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt *Viola tricolor*. Mỗi hợp chất số 4-255, 6-699, 6-028, 6-625 và 6-688 ở tỷ lệ áp dụng 80g/ha thể hiện hiệu quả ít nhất 80% diệt *Stellaria media*.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ có công thức (I) và/hoặc muối của hợp chất này



trong đó các phần tử thê được xác định như sau:

A là N hoặc CY;

X là Cl hoặc Me;

Y là OCH₂(CO)NMe₂, Cl, CH₂OCH₂CF₃, dị vòng, SO₂Me, SOMe hoặc SMe;

Z là Cl, SO₂alkyl, hoặc CF₃; và

R là alkyl, CF₃, alkylOCH₃, hoặc xyclo-alkyl.

2. Chế phẩm diệt cỏ, chứa lượng có hoạt tính diệt cỏ của ít nhất một hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó theo điểm 1.

3. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 2, trong đó chế phẩm này nằm trong hỗn hợp với ít nhất một chất phụ trợ phối chế.

4. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 2, trong đó chế phẩm này chứa ít nhất một hoạt chất có tác dụng diệt sinh vật gây hại khác từ nhóm gồm chất diệt côn trùng, chất trừ nhện, chất diệt cỏ, chất diệt nấm, chất an toàn và chất điều hòa sinh trưởng.

5. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 4, trong đó chế phẩm này chứa chất an toàn.

6. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 5, trong đó chế phẩm này chứa cyprosulfamit, cloquintocet-mexyl, mefenpyr-dietyl và/hoặc isoxadifen-etyl.

7. Chế phẩm diệt cỏ theo điểm 4, trong đó chế phẩm này chứa chất diệt cỏ khác.
8. Phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn, phương pháp này bao gồm bước đưa lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức (I) và/hoặc muối của nó theo điểm 1, lên thực vật và/hoặc vị trí của thực vật không mong muốn.
9. Phương pháp theo điểm 8, trong đó hợp chất có công thức (I) được dùng để phòng trừ thực vật không mong muốn trong tập hợp các thực vật có ích.
10. Phương pháp theo điểm 9, trong đó thực vật có ích là cây chuyển gen.
11. Phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn, phương pháp này bao gồm bước đưa lượng hữu hiệu chế phẩm diệt cỏ theo điểm 2, lên thực vật và/hoặc vị trí của thực vật không mong muốn.
12. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó A là CY.
13. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó A là N.
14. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó X là Cl.
15. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó Y là SO₂Me, SOMe, hoặc SMe.
16. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó Z là Cl hoặc CF₃.
17. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó R là alkyl, CF₃, hoặc alkylOCH₃.
18. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó X là Me.
19. Hợp chất N-(1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarboxamit có tác dụng diệt cỏ theo điểm 1, trong đó Y là dị vòng.