

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07C235/84



[12] 发明专利申请公开说明书

C07C237/48 C07D333/38

C07D231/40 C07D231/14

C07D233/90 C07D213/75

A01N 37/18 A01N 43/00

[21] 申请号 01805190.1

[43] 公开日 2003 年 7 月 9 日

[11] 公开号 CN 1429199A

[22] 申请日 2001.10.11 [21] 申请号 01805190.1

[30] 优先权

[32] 2000.10.17 [33] US [31] 60/240,890

[32] 2001. 9. 21 [33] US [31] 60/323,833

[86] 国际申请 PCT/US01/42632 2001.10.11

[87] 国际公布 WO02/32856 英 2002.4.25

[85] 进入国家阶段日期 2002.8.16

[71] 申请人 纳幕尔杜邦公司

地址 美国特拉华州威尔明顿

[72] 发明人 T·P·塞尔比 孙经武

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 王景朝 姜建成

权利要求书 6 页 说明书 108 页

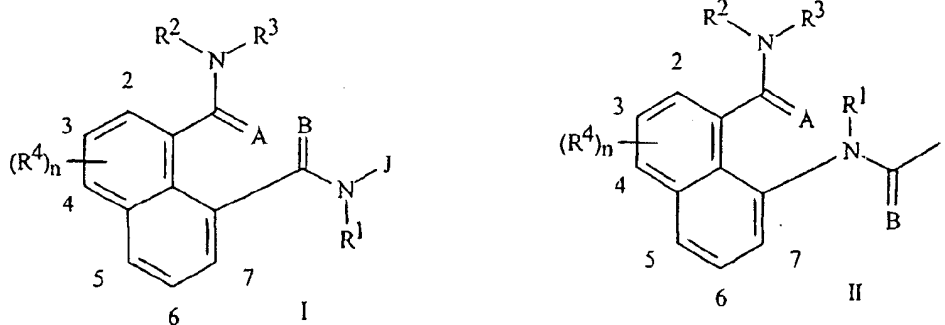
[54] 发明名称 杀虫剂 1,8 - 萘二甲酰胺

[57] 摘要

本发明公开了式 I 和式 II 的化合物及其 N - 氧化物和农业适用盐, 其用于防治无脊椎害虫, 式 I 和式 II 中, A、B、J、R1、R2、R3、R4 和 n 如说明书中所定义。本发明还公开了包含式 I 或式 II 化合物的组合物以及防治无脊椎害虫的方法, 该方法包括使无脊椎害虫或其环境与有效量的式 I 或式 II 化合物相接触。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 选自下列式 I 或式 II 的化合物及其 N-氧化物和农业适用盐:



5 其中

每一 J 独立地是苯基环、萘基环体系、5 或 6 元杂芳环或芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系，其中，每一环或环体系任选地是用 1-5 个 R⁵ 取代的；

A 和 B 独立地是 O 或 S；

10 n 为 0-4；

R¹ 是 H；或 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基或 C₃-C₆ 环烷基，各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、NO₂、羟基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基和 C₃-C₆ 环烷基氨基；或者

15 烷基氨基；或者

R¹ 是 C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基或 C₃-C₈ 二烷基氨基羰基；

R² 是 H、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₂-C₆ 烷氧基羰基或 C₂-C₆ 烷基羰基；

20 C₆ 烷氧基羰基或 C₂-C₆ 烷基羰基；

R³ 是 H；或 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基或 C₃-C₆ 环烷基，各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、NO₂、羟基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酰基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基；或者

25 R² 和 R³ 可通过与它们相连的氮而在一起形成环，该环含 2-6 个碳原子

并任选地含有一个另外的氮、硫或氧原子，该环可任选地被选自 C₁-C₂ 烷基、卤素、CN、NO₂ 和 C₁-C₂ 烷氧基的 1-4 个取代基取代；和

每一 R⁴ 和每一 R⁵ 独立地是 H、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 卤代炔基、C₃-C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、羟基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基硫代、C₁-C₄ 卤代烷基亚硫酰基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、或 C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或者

每一 R⁴ 和每一 R⁵ 独立地是苯基、苄基、苯氧基、5 或 6 元杂芳环或芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系，每一环任选地为 1 或 3 个独立地选自下列的取代基取代：C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 卤代炔基、C₃-C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₃-C₆ (烷基) 环烷基氨基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、或 C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或者

(R⁵)₂ 当连在相邻碳原子上时可以合在一起成为 -OCF₂O-、-CF₂CF₂O- 或 -OCF₂CF₂O-。

2. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 和 B 均为 0；

R¹ 是 H、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 烷基羰基或 C₂-C₆ 烷氧基羰基；和

n 为 0-2。

3. 权利要求 1 的式 II 化合物，其中

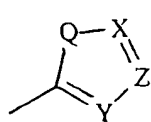
A 和 B 均为 0；

R¹ 是 H、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 烷基羰基或 C₂-C₆ 烷氧基羰基；和

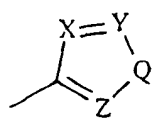
n 为 0-2。

4. 权利要求 2 或 3 的化合物，其中

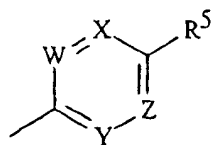
J 是苯基环或选自如下 J-1、J-2、J-3 和 J-4 的 5 元或 6 元杂芳环，每一 J 环任选地用 1-3 个 R⁵ 取代



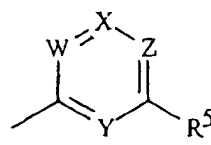
J-1



J-2



J-3



J-4

;

- 5 Q 是 O、S 或 NR⁵;
 W、X、Y 和 Z 独立地是 N 或 CR⁵，前提是在 J-3 和 J-4 中 W、X、Y 或 Z 至少之一是 N;
 R² 是 H、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 烷基羰基或 C₂-C₆ 烷氧基羰基;
- 10 R³ 是 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基或 C₃-C₆ 环烷基，各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、C₁-C₂ 烷氧基、C₁-C₂ 烷基硫代、C₁-C₂ 烷基亚硫酸基和 C₁-C₂ 烷基磺酰基；
 一个 R⁴ 基团在 2 位或 7 位连接萘基环体系，且该 R⁴ 是 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基硫代、C₁-C₄ 卤代烷基亚硫酸基或 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基；
- 15 每一 R⁵ 独立地是 H、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基硫代、C₁-C₄ 卤代烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基或 C₂-C₄ 烷氧基羰基，C₃-C₈ 二烷基氨基羰基；或
- 20 每一 R⁵ 独立地是苯基、苄基或 5 元或 6 元杂芳环，每一环任选地为下列的取代基取代：C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 卤代炔基、C₃-C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₃-C₆ (烷基) 环烷基氨基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基或
- 25 C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或

(R⁵)₂ 当与相邻碳原子连接时可以合在一起成为 -OCF₂O-、-CF₂CF₂O- 或 -OCF₂CF₂O-; 和

n 为 1 - 2。

5 5. 权利要求 4 的式 I 化合物, 其中 R² 是 H; R³ 是 C₁ - C₄ 烷基; 和至少一个 R⁵ 取代基与 NR¹C(=B) 部分邻位。

6. 权利要求 5 的化合物, 其中 R³ 是甲基。

7. 权利要求 4 的式 II 化合物, 其中

R¹ 是 H 或 C₁ - C₄ 烷基;

R² 是 H 或 C₁ - C₄ 烷基;

10 R³ 是任选地用卤素、CN、OCH₃ 或 S(O)_pCH₃ 取代的 C₁ - C₄ 烷基;

一个 R⁵ 基团在与 C(=B)NR¹ 部分邻位的位置上与 J 相连, 且该 R⁵ 是 C₁ - C₄ 烷基、C₁ - C₄ 卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁ - C₄ 烷氧基、C₁ - C₄ 卤代烷氧基、C₁ - C₄ 烷基硫代、C₁ - C₄ 烷基亚硫酰基、C₁ - C₄ 烷基磺酰基、C₁ - C₄ 卤代烷基硫代、C₁ - C₄ 卤代烷基亚硫酰基、C₁ - C₄ 卤代烷基磺酰基或 C₂ - C₄ 烷氧基羰基; C₃ - C₈ 二烷基氨基羰基或苯基、苄基, 或 5 元或 6 元杂芳环, 每一环任选地为下列的取代基取代: 卤素、CN、NO₂、C₁ - C₄ 烷基、C₂ - C₄ 链烯基、C₂ - C₄ 炔基、C₃ - C₆ 环烷基、C₁ - C₄ 卤代烷基、C₁ - C₄ 烷氧基或 C₁ - C₄ 卤代烷氧基;

20 而任选的第二 R⁵ 基团独立地是 C₁ - C₄ 烷基、C₁ - C₄ 卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁ - C₄ 烷氧基、C₁ - C₄ 卤代烷氧基、C₁ - C₄ 烷基硫代、C₁ - C₄ 烷基亚硫酰基、C₁ - C₄ 烷基磺酰基、C₁ - C₄ 卤代烷基硫代、C₁ - C₄ 卤代烷基亚硫酰基、C₁ - C₄ 卤代烷基磺酰基或 C₂ - C₄ 烷氧基羰基; C₃ - C₈ 二烷基氨基羰基或苯基、苄基, 或 5 元或 6 元杂芳环, 每一环任选地为下列的取代基取代: 卤素、CN、NO₂、C₁ - C₄ 烷基、C₂ - C₄ 链烯基、C₂ - C₄ 炔基、C₃ - C₆ 环烷基、C₁ - C₄ 卤代烷基、C₁ - C₄ 烷氧基或 C₁ - C₄ 卤代烷氧基。

25 7. 权利要求 6 的化合物, 其中 J 是苯基、吡唑、吡咯、吡啶或嘧啶, 每一个均被在与 C(=B)NR¹ 部分邻位的位置上与 J 相连的一个 R⁵ 和第二个任选的 R⁵ 取代。

8. 权利要求 7 的化合物, 其中

30 R¹ 和 R² 均是 H;

一个 R⁴ 在与 NR¹C(=X)J 部分邻位的 7 位上连接, 并选自 C₁ - C₃ 烷基、CF₃、OCF₃、OCHF₂、S(O)_pCF₃、S(O)_pCHF₂ 和卤素, 而任选的第二 R⁴ 在与 NR¹C(=X)J

部分对位的5位上连接，并选自卤素、 $C_1 - C_3$ 烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷基。

9. 权利要求8的化合物，其中

J是J-1;

Q是 NR^{5a} ;

5 X是N或CH;

Y是CH;

Z是 CR^{5b} ;

R^{5a} 是用一个或两个选自卤素、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基或 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基所取代的苯基或2-吡啶基; 和

10 R^{5b} 是卤素或 CF_3 。

10. 权利要求1的化合物，选自N-甲基-N'-(2-溴-4-氟苯基)-1,8-萘-二甲酰、N-甲基8-[(3,4-二氟苯基)羰基氨基]-1-萘甲酰和N-甲基8-[(2-噻吩基)羰基氨基]-1-萘甲酰。

11. 一种用于防治无脊椎害虫的组合物，包含生物有效量的权利要求1的化合物以及表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种。

12. 权利要求11的组合物，还包含有效量的至少一种附加生物活性化合物或试剂。

13. 权利要求12的组合物，其中，至少一种附加生物活性化合物或试剂选自由合成除虫菊酯类、氨基甲酸酯类、neonicotinoids、二乙基溴乙酰胺钠通道堵塞剂、杀虫大环内酯类、 γ -氨基丁酸(GABA)对抗剂、杀虫剂尿素和保幼激素组成的一组节肢害虫杀灭剂。

14. 权利要求12的组合物，其中，至少一种附加生物活性化合物或试剂选自以下杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂或生物试剂：齐墩螨素(abamectin)，高灭磷，吡虫清，齐墩螨素(ivermectin)，艾扎丁，谷硫磷，氟氯菊酯，联苯肼酯，噻嗪酮，虫螨威，氟唑虫清，定虫隆，毒死蜱，甲基毒死蜱，chromafenozide，clothianidin，氯氟氰菊酯， β -氯氟氰菊酯，(RS)氯氟氰菊酯， λ -氯氟氰菊酯，氯氟菊酯，灭蝇胺，溴氟菊酯，杀螨硫隆，二嗪农，氟脲杀，乐果，噁茂醚，emamectin，硫丹，高氟戊菊酯，ethiprole，苯硫威，双氧威，甲氟菊酯，唑螨酯，杀灭菊酯，锐劲特，flonicamid，氟氟戊菊酯，氟胺氰菊酯，氟虫脲，地虫磷，特丁苯酰肼，氟铃脲，吡虫啉，噁二唑虫，丙胺磷，氟丙氧脲，

马拉松, 蜗牛敌, 甲胺磷, 杀扑磷, 灭多虫, 蒙五一五, 甲氧滴滴涕, 久效磷, 甲氧苯酰肼, 硝虫噻嗪, 双苯氟脲, 甲氧叉威, 一六零五, 甲基一六零五, 氯菊酯, 三九一一, 伏杀磷, 亚胺硫磷, 磷胺, 抗蚜威, 丙溴磷, 拒嗪酮, pyridalyl, 蚊蝇醚, 鱼藤酮, 艾克敌 105, 乙丙硫磷, 5 双苯酰肼, 伏虫隆, 七氟菊酯, 特丁磷, 杀虫畏, thiacloprid, thiamethoxam, 硫双灭多威, 杀虫双, 四溴菊酯, 敌百虫和杀虫隆, 涕灭威, 甲氧叉威, 克线磷, 虫螨脒, 灭螨猛, 乙酯杀螨醇, 三环锡, 开乐散, 除螨灵, 特苯噁唑, 啞螨醚, 杀螨锡, 甲氟菊酯, 啞螨酯, 噻螨酮, 克螨特, 啞螨酮, 吡螨胺, 苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus* 10 *thuringiensis*), 苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素, 杆状病毒, 以及食虫细菌、病毒和真菌。

15 15. 权利要求 14 的组合物, 其中, 至少一种附加生物活性化合物或试剂选自: 氟氰菊酯, (RS) 氟氰氟菊酯, 氟氟氟菊酯, β -氟氟氟菊酯, 高氟戊菊酯, 杀灭菊酯, 四溴菊酯, fenothicarb, 灭多虫, 甲 15 氧叉威, 硫双灭多威, clothianidin, 吡虫啉, thiacloprid, 噁二唑虫, 艾克敌 105, 齐墩螨素 (abamectin), 齐墩螨素 (avermectin), emamectin, 硫丹, ethiprole, 锐劲特, 氟虫脲, 杀虫隆, 噁茂醚, 蚊蝇醚, 拒嗪酮, 虫螨脒, 苏云金芽孢杆菌, 苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素, 以及及食昆虫的真菌。

20 16. 一种防治无脊椎害虫的方法, 包括使该无脊椎害虫或其环境与生物有效量的权利要求 1 的化合物或权利要求 11 的组合物相接触。

杀虫剂 1,8-萘二甲酰胺

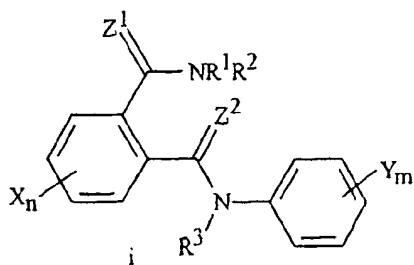
发明背景

5 本发明涉及特定的 1,8-萘二甲酰胺、其农业适用盐和组合物,以及其在农学和非农学环境中在防治无脊椎害虫上的使用方法。

10 为了获得作物的高收益,控制无脊椎害虫非常重要。无脊椎害虫对于正在生长以及储存的农作物造成的危害能使产量显著降低,并从而导致消费者花费增加。在林业、温室作物、观赏性植物、苗圃作物、储存的食物和纤维产品、牲畜、家用品、以及公共和动物健康等方面,控制无脊椎害虫也很重要。已有许多商业产品用于这些目的,但是仍不断需要更有效、更廉价、毒性低、无害于环境或具有不同施用模式的新化合物。

EP919542 公开了作为杀虫剂的式 i 的邻萘二甲酰胺

15

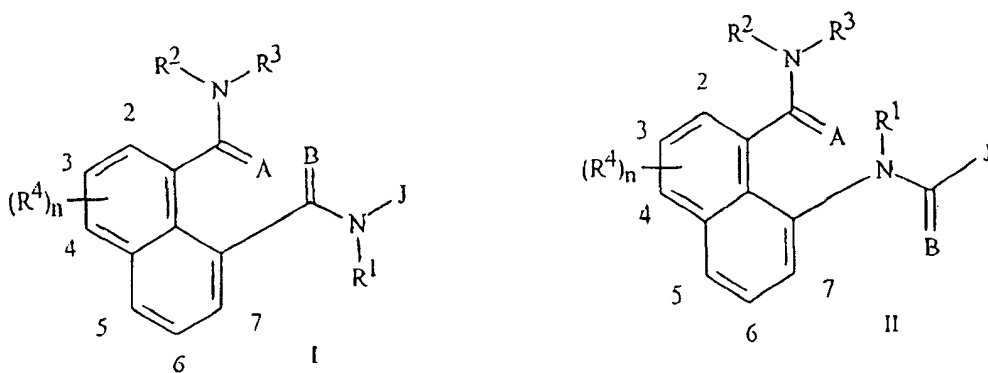


其中,除其它之外, Z^1 和 Z^2 是O和S;而 R^1 、 R^2 和 R^3 特别是H、烷基或取代烷基。

20

发明概述

本发明涉及式 I 和式 II 的化合物,包括其所有几何和立体异构体、N-氧化物和农业适用盐:



其中

每一 J 独立地是苯基环、萘基环体系、5 或 6 元杂芳环或芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系，其中，每一环或环体系任选地是用 1-5 个 R^5 取代的；

A 和 B 独立地是 O 或 S；

n 为 0-4；

R^1 是 H；或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基，各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫代、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基和 C_3-C_6 环烷基氨基；或者

R^1 是 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基或 C_3-C_8 二烷基氨基羰基；

R^2 是 H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_6 烷氧基羰基或 C_2-C_6 烷基羰基；

R^3 是 H；或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基，各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫代、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基和 C_1-C_4 烷基磺酰基；或者

R^2 和 R^3 可通过与它们相连的氮而在一起形成环，该环含 2-6 个碳原子并任选地含有一个另外的氮、硫或氧原子，该环可任选地被选自 C_1-C_2 烷基、卤素、CN、 NO_2 和 C_1-C_2 烷氧基的 1-4 个取代基取代；和

每一 R^4 和每一 R^5 独立地是 H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3

- C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、羟基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基硫代、C₁-C₄ 卤代烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、或 C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或者
- 每一 R⁴ 和每一 R⁵ 独立地是苯基、苄基、苯氧基、5 或 6 元杂芳环或芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系，每一环任选地为 1 或 3 个独立地选自下列的取代基取代：C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 卤代炔基、C₃-C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫代、C₁-C₄ 烷基亚硫酸基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 烷基氨基、C₂-C₈ 二烷基氨基、C₃-C₆ 环烷基氨基、C₃-C₆ (烷基) 环烷基氨基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、或 C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或者
- (R⁵)₂ 当连在相邻碳原子上时可以合在一起成为 -OCF₂O-、-CF₂CF₂O- 或 -OCF₂CF₂O-。

本发明还涉及用于控制无脊椎害虫的组合物，包含生物有效量的式 I 或式 II 化合物以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分。本发明还涉及一种组合物，其包含生物有效量的式 I 或式 II 化合物以及有效量的至少一种附加生物活性化合物或试剂。

本发明还涉及控制无脊椎害虫的方法，包括使无脊椎害虫或其环境与生物有效量的式 I 或式 II 化合物（例如作为在此描述的组合物）接触。本发明还涉及这样的方法，其中，使无脊椎害虫或其环境与用于控制无脊椎害虫、含有生物有效量的式 I 或式 II 化合物的组合物接触，或与含有式 I 或式 II 化合物及生物有效量的至少一种附加化合物或试剂的组合物接触，以防治无脊椎害虫。

发明详述

在上文中，单独使用或在诸如“烷基硫代”或“卤代烷基”等复合词中使用的术语“烷基”包括直链或支链烷基，如甲基、乙基、正丙基、异丙基，或不同的丁基、戊基或己基异构体。“链烯基”包括直链或支

链烯类，如1-丙烯基、2-丙烯基，以及丁烯基、戊烯基和己烯基的不同异构体。“链烯基”还包括多烯类，如1,2-丙二烯和2,4-己二烯。

“炔基”包括直链或支链炔类，如1-丙炔基、2-丙炔基，以及丁炔基、戊炔基和己炔基的不同异构体。“炔基”还可包括由多重三键组成的部分，如2,5-己二炔。“烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基以及丁氧基、戊氧基和己氧基的不同异构体。“烷基硫代”包括支链或直链烷基硫代部分，如甲基硫代、乙基硫代、以及丙基硫代、丁基硫代、戊基硫代和己基硫代的不同异构体。“环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。“烷基氨基”、“链烯基硫代”、“链烯基亚硫酸基”、“链烯基磺酰基”、“炔基硫代”、“炔基亚硫酸基”、“炔基磺酰基”等等的定义与以上例子相似。“烷氧基羰基”的例子包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ ， $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ ， $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ ， $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ ，以及丁氧基羰基或戊氧基羰基的不同异构体。“烷基氨基羰基”的例子包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ ， $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ ， $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ ， $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ ，以及丁基氨基羰基或戊基氨基羰基的不同异构体。术语“二烷基氨基”包括用可以相同或不同的两个烷基基团取代的氨基官能团。“二烷基氨基羰基”定义类似，其例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NCH}_3\text{C}(=\text{O})$ 。

术语“杂环”或“杂环体系”表示其中的至少一个环原子不是碳并包含1-4个杂原子的环或环体系，所述杂原子独立地选自氮、氧或硫，前提是每一杂环含有不多于4个的氮、不多于2个的氧，和不多于2个的硫。可以通过任何可用的碳或氮、通过取代该碳或氮上的氢而与杂环进行连接。术语“芳环体系”表示完全未饱和的碳环和杂环，其中多核环体系是芳族的（其中芳族表示所述环体系满足休克尔规则）。术语“杂芳环”表示具完全芳香性的环，其中至少一个环原子不是碳并包含1-4个杂原子，所述杂原子独立地选自氮、氧或硫，前提是每一杂环含有不多于4个的氮、不多于2个的氧，和不多于2个的硫（其中芳香表示所述环体系满足休克尔规则）。可以通过任何可用的碳或氮、通过取代该碳或氮上的氢而与所述杂环进行连接。术语“芳香杂环体系”包括完全芳香杂环和其中的多核环体系获的至少一个环是芳香的（其中芳香表示所述环体系满足休克尔规则）杂环。术语“杂双环稠环体系”包括由两个稠环组成的环体系，其中，至少一个环原子不是碳，并且是芳香的或非芳香的（如上所定义）。

单独的或在诸如“卤代烷基”等复合词中的术语“卤素”包括氟、氯、溴或碘。另外，当用于诸如“卤代烷基”等复合词中时，所述烷基可以用相同或不同的卤原子部分或全部取代。“卤代烷基”的例子包括 F_3C 、 $ClCH_2$ 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。术语“卤代链烯基”、“卤代炔基”、“卤代烷氧基”等的定义与术语“卤代烷基”类似。“卤代链烯基”的例子包括 $(Cl)_2C=CHCH_2$ 和 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 。“卤代炔基”的例子包括 $HC\equiv CCHCl$ 、 $CF_3C\equiv C$ 、 $CCl_3C\equiv C$ 和 $FCH_2C\equiv CCH_2$ 。“卤代烷氧基”的例子包括 CF_3O 、 CCl_3CH_2O 、 $HCF_2CH_2CH_2O$ 和 CF_3CH_2O 。

取代基团中的碳原子总数由“ C_i-C_j ”前缀表示，其中， i 和 j 为 1-6 的数。例如， C_1-C_3 烷基磺酰基表示甲基磺酰基直至丙基磺酰基； C_2 烷氧基烷基表示 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧基烷基表示例如 $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2$ 或 $CH_3CH_2OCH_2$ ；而 C_4 烷氧基烷基表示用烷氧基基团取代的烷基基团的各种异构体，含有总共 4 个碳原子，例子包括 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ 和 $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 。在上面所列举的当中，当式 1 的化合物含有杂环时，所有的取代基均通过任何可用的碳或氮、通过取代该碳或氮上的氢而与该环进行连接。

当基团含有可为氢的取代基时，例如 R^3 ，则当该取代基为氢时，即认为相当于该基团未被取代。当基团上任选取代基的数目为 0 时，例如当 n 为 0 时，则认为相当于该基团未被取代。当键被标示为不固定时，则取代基可通过氢的取代而与环上的任何可用碳原子连接；对于双环体系，一个或多个取代基可与双环体系中的任何一环连接，或与两环均连接。例如当 n 为 1 时，单一的 R^4 取代基可在所表明的 2、3、4、5、6 或 7 位的任何位置上连接式 I 或式 II；而当 n 为 2 时，2 个独立的 R^4 取代基可在 2, 3；2, 4；2, 5；2, 6 或 2, 7 位或在两位的任何其它组合上连接。当 R^2 和 R^3 与它们所连接的氮合起形成环时，则该环可在其中任何可用的碳或任选地在任何可用的氮上被任选地取代。

本发明的化合物可作为一种或多种立体异构体存在。所述各种立体异构体包括对映异构物、非对映异构体、阻转异构体和几何异构体。本领域技术人员将理解的是，当一种异构体相对于其它异构体为富集时或当与其它异构体分离时，其可以更为活泼和/或可以具有有利作用。另外，本领域技术人员知道如何对所述异构体进行分离、富化和/或选择性制备。本发明的化合物可以以异构体混合物、个体异构体、或以旋光

形式体存在。

本发明包括的化合物选自式 I 或式 II、其 N-氧化物和农业适用盐。本领域技术人员将理解的是，不是所有含氮杂环可以形成 N-氧化物，这是因为氮需要可以利用的孤对电子来氧化成氧化物；本领域技术人员应能识别那些能形成 N-氧化物的含氮杂环。本领域技术人员还应认识到叔胺可以形成 N-氧化物。制备杂环和叔胺的氮氧化物的合成方法为本领域技术人员所熟知，包括用过氧酸（如过乙酸和间氯过苯甲酸（MCPBA））、过氧化氢、烷基过氧化氢（如过氧化氢叔丁基）、过硼酸钠和双环氧乙烷类（如二甲基双环氧乙烷）对杂环和叔胺进行氧化作用。在文献中对 N-氧化物的这些制备方法已作了广泛描述和评论，参见例如：T. L. Gilchrist 在 *Comprehensive Organic Synthesis*（综合有机合成）第 7 卷第 748-750 页，S. V. Ley 编辑，Pergamon 出版社；M. Tisler 和 B. Stanovnik 在 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*（综合杂环化学）第 3 卷第 18-19 页，A. J. Boulton 和 A. McKillop 编辑，Pergamon 出版社；M. R. Grimmett 和 B. R. T. Keene 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry*（杂环化学进展）第 43 卷第 139-151 页，A. R. Katritzky 编辑，Academic 出版社；M. Tisler 和 B. Stanovnik 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry* 第 9 卷第 285-291 页，A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton 编辑，Academic 出版社；以及 G. W. H. Cheeseman 和 E. S. G. Werstiuk 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry* 第 22 卷第 390-392 页，A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton 编辑，Academic 出版社。

本发明化合物的盐包括与诸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、醋酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸的无机或有机酸的酸加成盐。

为了包括使合成容易进行和/或更高的节足害虫沙虫效力的缘故，优选的是：

优选 1. 式 I 化合物，其中

A 和 B 均为 0；

R¹ 是 H、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 烷基羰基或 C₂-C₆ 烷氧基羰基；和

n 为 0-2。

优选 2. 式 II 化合物，其中

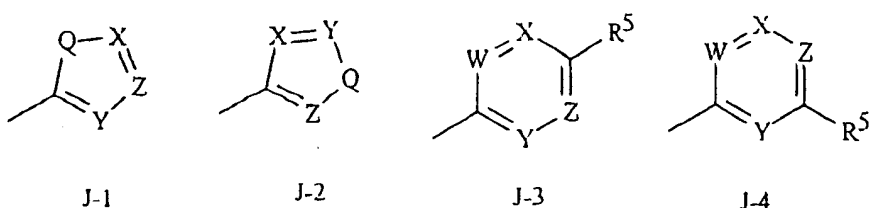
A 和 B 均为 0;

R^1 是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_2 - C_6$ 烷基羰基或 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基; 和

n 为 0 - 2。

5 优选 3. 优选 1 或优选 2 的化合物, 其中

J 是苯基环或选自如下 J-1、J-2、J-3 和 J-4 的 5 元或 6 元杂芳环, 每一 J 环任选地用 1 - 3 个 R^5 取代



10 Q 是 O、S 或 NR^5 ;

W、X、Y 和 Z 独立地是 N 或 CR^5 , 前提是在 J-3 和 J-4 中 W、X、Y 或 Z 至少之一是 N;

R^2 是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_2 - C_6$ 烷基羰基或 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基;

15 R^3 是 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_2 - C_6$ 链烯基、 $C_2 - C_6$ 炔基或 $C_3 - C_6$ 环烷基, 各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代: 卤素、CN、 $C_1 - C_2$ 烷氧基、 $C_1 - C_2$ 烷基硫代、 $C_1 - C_2$ 烷基亚硫酸基和 $C_1 - C_2$ 烷基磺酰基;

一个 R^4 基团在 2 位或 7 位连接苯基环体系, 且该 R^4 是 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$

20 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酸基或 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基;

每一 R^5 独立地是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$

25 $- C_4$ 卤代烷基磺酰基或 $C_2 - C_4$ 烷氧基羰基, $C_3 - C_8$ 二烷基氨基羰基; 或

每一 R^5 独立地是苯基、苄基或 5 元或 6 元杂芳环, 每一环任选地为下列的取代基取代: $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_2 - C_4$ 卤代链烯基、 $C_2 - C_4$ 卤代炔基、 $C_3 - C_6$ 卤代环烷

基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄烷基氧基、C₁-C₄卤代烷基氧基、C₁-C₄烷基硫代、C₁-C₄烷基亚硫酸基、C₁-C₄烷基磺酰基、C₁-C₄烷基氨基、C₂-C₈二烷基氨基、C₃-C₆环烷基氨基、C₃-C₆(烷基)环烷基氨基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₆烷基氧基羰基、C₂-C₆烷基氨基羰基、C₃-C₈二烷基氨基羰基或

5 C₃-C₆三烷基甲硅烷基；或

(R⁵)₂当与相邻碳原子连接时可以合在一起成为-OCF₂O-、-CF₂CF₂O-或-OCF₂CF₂O-；和

n为1-2。

10 优选4. 优选3的式I化合物，其中R²是H；R³是C₁-C₄烷基；和至少一个R⁵取代基与NR¹C(=B)部分邻位。

优选5. 优选4的化合物，其中R³是甲基。

优选6. 优选3的式II化合物，其中

R¹是H或C₁-C₄烷基；

R²是H或C₁-C₄烷基；

15 R³是任选地用卤素、CN、OCH₃或S(O)_pCH₃取代的C₁-C₄烷基；

一个R⁵基团在与C(=B)NR¹部分邻位的位置上与J相连，且该R⁵是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄烷基氧基、C₁-C₄卤代烷基氧基、C₁-C₄烷基硫代、C₁-C₄烷基亚硫酸基、C₁-C₄烷基磺酰基、C₁-C₄卤代烷基硫代、C₁-C₄卤代烷基亚硫酸基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基或C₂-C₄烷基氧基羰基；C₃-C₈二烷基氨基羰基或苯基、苄基，或5元或6元杂芳环，每一环任选地为下列的取代基取代：卤素、CN、NO₂、C₁-C₄烷基、C₂-C₄链烯基、C₂-C₄炔基、C₃-C₆环烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷基氧基或C₁-C₄卤代烷基氧基；

25 而任选的第二R⁵基团独立地是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄烷基氧基、C₁-C₄卤代烷基氧基、C₁-C₄烷基硫代、C₁-C₄烷基亚硫酸基、C₁-C₄烷基磺酰基、C₁-C₄卤代烷基硫代、C₁-C₄卤代烷基亚硫酸基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基或C₂-C₄烷基氧基羰基；C₃-C₈二烷基氨基羰基或苯基、苄基，或5元或6元杂芳环，每一环任选地为下列的取代基取代：卤素、CN、NO₂、C₁-C₄烷基、C₂-C₄链烯基、C₂-C₄炔基、C₃-C₆环烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷基氧基或C₁-C₄卤代烷基氧基。

30 优选7. 优选6的化合物，其中J是苯基、吡啶、吡咯、吡啶或嘧啶，每一个均被在与C(=B)NR¹部分邻位的位置上与J相连的一个R⁵和第二个

任选的 R^5 取代。

优选 8. 优选 7 的化合物, 其中

R^1 和 R^2 均是 H;

5 一个 R^4 在与 $NR^1C(=X)J$ 部分邻位的 7 位上连接, 并选自 $C_1 - C_3$ 烷基、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 和卤素, 而任选的第二 R^4 在与 $NR^1C(=X)J$ 部分对位的 5 位上连接, 并选自卤素、 $C_1 - C_3$ 烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷基。

优选 9. 优选 8 的化合物, 其中

J 是 J-1;

Q 是 NR^{5a} ;

10 X 是 N 或 CH;

Y 是 CH;

Z 是 CR^{5b} ;

R^{5a} 是用一个或两个选自卤素、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基或 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基所取代的苯基或 2-吡啶基; 和

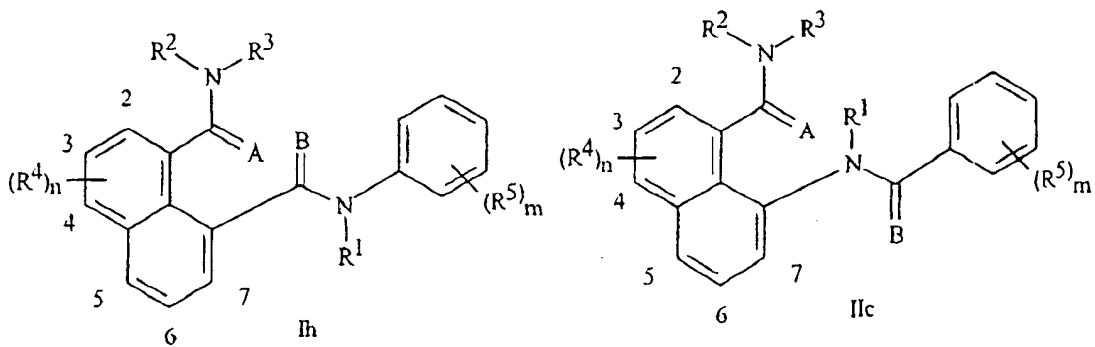
15 R^{5b} 是卤素或 CF_3 。

特别优选的化合物选自 N-甲基-N'-(2-溴-4-氟苯基)-1,8-萘-二甲酰、N-甲基 8-[(3,4-二氟苯基)羰基氨基]-1-萘甲酰和 N-甲基 8-[(2-噻吩基)羰基氨基]-1-萘甲酰。

20 本发明还涉及一种防治无脊椎动物的组合物, 包含生物有效量的式 I 或式 II 化合物和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的组分。本发明还涉及一种组合物, 包含生物有效量的式 I 或式 II 化合物和有效量的至少一种附加生物活性化合物或试剂。优选的组合物含有优选 1-9 中优选的式 I 或式 II 化合物以及上述特别优选的化合物。

25 本发明还涉及防治节肢动物的方法, 包括使节肢动物或其环境与对于杀灭节肢动物有效的量的式 I 或式 II 化合物、其 N-氧化物或农业适用盐 (例如以含式 I 或式 II 化合物的组合物的形式) 进行接触。本发明还涉及这样一种方法, 其中, 使无脊椎害虫或其环境与生物有效量的式 I 或式 II 化合物或含式 I 或式 II 化合物及生物有效量的至少一种附加化合物或试剂的组合物进行接触, 以防治无脊椎害虫。优选的方法包
30 括优选 1-9 中优选的式 I 或式 II 化合物以及上述特别优选的化合物。

重要的是某些下列的式 Ih 和式 IIc 化合物, 包括其所有的几何和立体异构体及农业适用盐:



其中:

A 和 B 独立地是 O 或 S;

5 m 为 1 - 5;

n 为 0 - 4;

R¹ 是 H; 或 C₁ - C₆ 烷基、C₂ - C₆ 链烯基、C₂ - C₆ 炔基或 C₃ - C₆ 环烷基, 各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代: 卤素、CN、NO₂、羟基、C₁ - C₄ 烷氧基、C₁ - C₄ 烷基硫代、C₁ - C₄ 烷基亚硫酰基、C₁ - C₄ 烷基磺酰基、C₂ - C₄ 烷氧基羰基、C₁ - C₄ 烷基氨基、C₂ - C₈ 二烷基氨基和 C₃ - C₆ 环烷基氨基; 或者

R¹ 是 C₂ - C₆ 烷基羰基、C₂ - C₆ 烷氧基羰基、C₂ - C₆ 烷基氨基羰基或 C₃ - C₈ 二烷基氨基羰基;

15 R² 是 H、C₁ - C₆ 烷基、C₂ - C₆ 链烯基、C₂ - C₆ 炔基、C₃ - C₆ 环烷基、C₁ - C₄ 烷氧基、C₁ - C₄ 烷基氨基、C₂ - C₈ 二烷基氨基、C₃ - C₆ 环烷基氨基、C₂ - C₆ 烷氧基羰基或 C₂ - C₆ 烷基羰基;

20 R³ 是 H; 或 C₁ - C₆ 烷基、C₂ - C₆ 链烯基、C₂ - C₆ 炔基或 C₃ - C₆ 环烷基, 各自任选地为一个或多个选自下列的取代基取代: 卤素、CN、NO₂、羟基、C₁ - C₄ 烷氧基、C₁ - C₄ 烷基硫代、C₁ - C₄ 烷基亚硫酰基和 C₁ - C₄ 烷基磺酰基; 或者

R² 和 R³ 可通过与它们相连的氮而在一起形成环, 该环含 2 - 6 个碳原子并任选地含有一个另外的氮、硫或氧原子, 该环可任选地被选自 C₁ - C₂ 烷基、卤素、CN、NO₂ 和 C₁ - C₂ 烷氧基的 1 - 4 个取代基取代; 和

25 每一 R⁴ 和每一 R⁵ 独立地是 H、C₁ - C₆ 烷基、C₂ - C₆ 链烯基、C₂ - C₆ 炔基、C₃ - C₆ 环烷基、C₁ - C₆ 卤代烷基、C₂ - C₆ 卤代链烯基、C₂ - C₆ 卤代炔基、C₃ - C₆ 卤代环烷基、卤素、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、羟基、C₁ - C₄ 烷氧基、

- $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基、 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1 - C_4$ 烷基氨基、 $C_2 - C_8$ 二烷基氨基、 $C_3 - C_6$ 环烷基氨基、 $C_2 - C_6$ 烷基羰基、 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基、 $C_2 - C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_3 - C_8$ 二烷基氨基羰基、或 $C_3 - C_6$ 三烷基甲硅烷基；或者
- 5 每一 R^4 和每一 R^5 独立地是任选地为下列取代基取代的苯基： $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_2 - C_4$ 卤代链烯基、 $C_2 - C_4$ 卤代炔基、 $C_3 - C_6$ 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 烷基氨基、 $C_2 - C_8$ 二烷基氨基、 $C_3 - C_6$ 环烷基氨基、 $C_3 - C_6$ (烷基) 环烷基氨基、 $C_2 - C_4$ 烷基羰基、 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基、 $C_2 - C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_3 - C_8$ 二烷基氨基羰基或 $C_3 - C_6$ 三烷基甲硅烷基。
- 10

同样重要的是杀灭节肢害虫的组合物，包含对于杀灭节肢害虫有效的量的上述式 I h 或式 II c 化合物及至少一种选自表面活性剂、固体稀

15 释剂或液体稀释剂的组分。

本发明还涉及防治节肢动物的方法，包括使节肢动物或其环境与对于杀灭节肢动物有效的量的上述式 I h 或式 II c 化合物进行接触。

部分 1. 重要的是式 I h 的经选择的化合物，其中

A 和 B 均为 0；

20 m 为 1 - 3；

n 为 0 - 2；

R^1 是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_2 - C_6$ 烷基羰基或 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基；和

每一 R^4 和每一 R^5 独立地是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酸基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基或 $C_2 - C_4$ 烷氧基羰基。

25

部分 2. 重要的是部分 1 的经选择的化合物，其中

R^2 是 H；

30 R^3 是 $C_1 - C_4$ 烷基；

每一 R^4 和每一 R^5 独立地是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、卤素、CN、NO₂、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚

硫酰基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基或 $C_2 - C_4$ 烷氧基羰基；和至少一个 R^5 取代基是在酰胺键的邻位；

部分 3. 重要的是部分 2 的经选择的化合物，其中 R^3 是甲基。

5 部分 4. 重要的是式 IIc 的经选择的化合物，其中

A 和 B 均未 0；

m 为 1 - 3；

n 为 0 - 2；

10 R^1 是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_2 - C_4$ 链烯基、 $C_2 - C_4$ 炔基、 $C_3 - C_6$ 环烷基、 $C_2 - C_6$ 烷基羰基或 $C_2 - C_6$ 烷氧基羰基；和

每一 R^4 和每一 R^5 独立地是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酰基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基或 $C_2 - C_4$ 烷氧基羰基。

15 部分 5. 重要的是部分 4 的经选择的化合物，其中

R^2 是 H；

R^6 是任选地为 $C_1 - C_4$ 烷氧基或 $C_1 - C_4$ 烷基硫代取代的 $C_1 - C_6$ 烷基；

每一 R^4 和每一 R^5 独立地是 H、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 烷基亚硫酰基、 $C_1 - C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基硫代、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基亚硫酰基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基磺酰基或 $C_2 - C_4$ 烷氧基羰基；和

至少一个 R^5 取代基是在酰胺键的邻位。

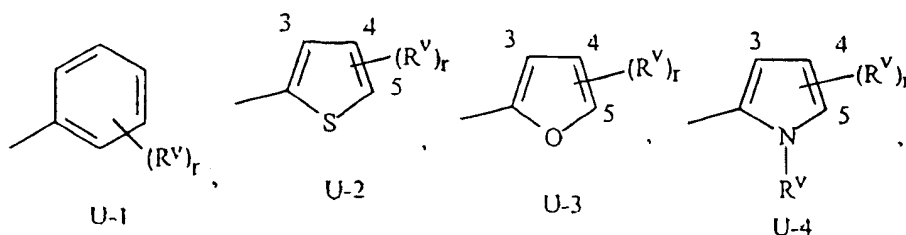
25 如上所指出的，每一 J 独立地是苯基环、萘基环体系、5 或 6 元杂芳环或芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系，其中，每一环或环体系任选地是用 1 - 5 个 R^5 取代的。与这些 J 基团相关联的术语“任选地取代”是指未被取代的基团或具有至少一个非氢取代基，其不使未取代的类似物所具有的杀灭节肢害虫的活性消失。任选地用 1 - 5 个 R^5 取代的苯基的例子是在陈列 1 中以 U-1 表示的环，其中 R^v 是 R^5 ，而 r 为 1 - 5 的整数。任选地用 1 - 5 个 R^5 取代的萘基的例子是在陈列 1 中以 U-85 表示的环，

30 其中 R^v 是 R^5 ，而 r 为 1 - 5 的整数。任选地用 1 - 5 个 R^5 取代的 5 元或 6 元杂芳环的例子包括在陈列 1 中 U-2 至 U-53 表示的环，其中 R^v 是 R^5 ，而 r 为 1 - 5 的整数。注意下述 J-1 至 J-4 也表示 5 元或 6 元杂芳环。

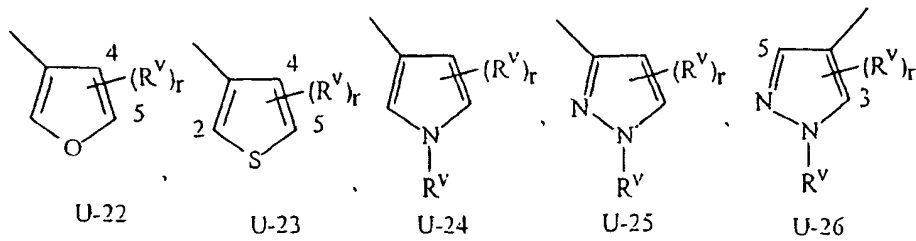
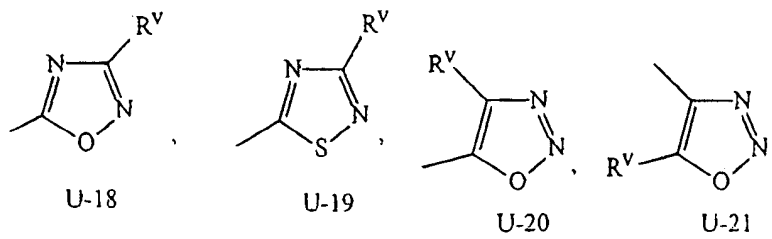
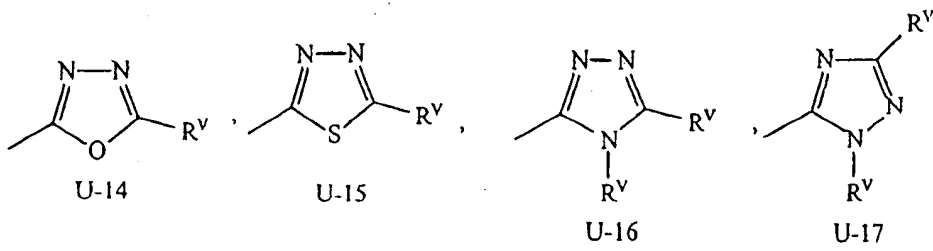
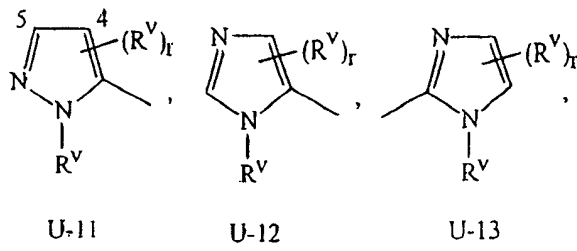
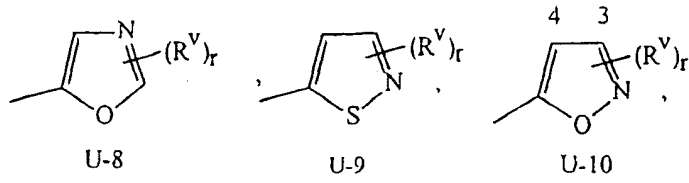
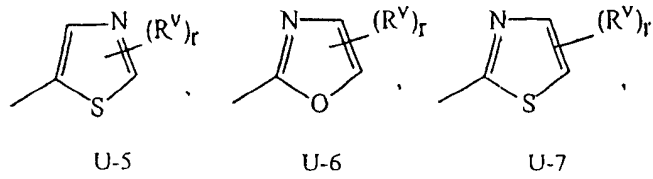
注意 U-2 至 U-20 是 J-1 的例子, U-21 至 U-35 以及 U-40 是 J-2 的例子, U-41 至 U-48 是 J-3 的例子, 而 U-49 至 U-53 是 J-4 的例子。任选地以 1-4 个 R^3 取代的芳香 8、9 或 10 元杂双环稠环体系的例子包括陈列 1 中图示的 U-54 至 U-84, 其中 R^v 是 R^5 , 而 r 为 1-5 的整数。

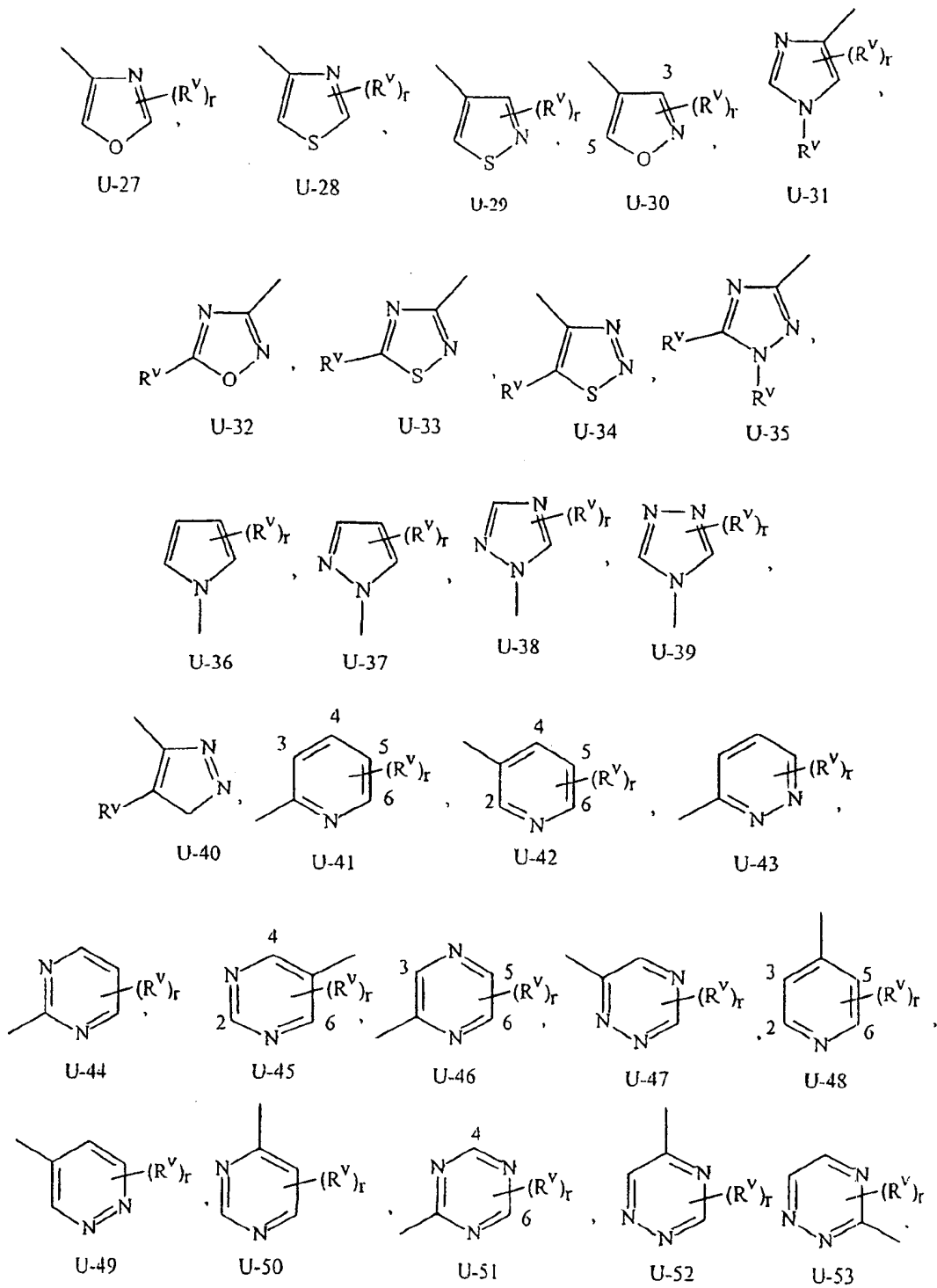
- 5 尽管 R^v 基团出现在 U-1 至 U-85 的结构中, 但应注意的是它们不是必须存在, 这是因为它们是任选的取代基。应注意的是, 当与原子相连时 R^v 是 H 时, 其等同于好像该原子未被取代。需要通过取代来填充其化合价的氮原子用 H 或 R^v 进行取代。应注意的是, 一些 U 基团只能用少于 5 个的 R^v 基团进行取代 (例如 U-14、U-15、U-18 至 U-21 和 U-32 至 U-34 只能用一个 R^v 进行取代)。应注意的是, 当 $(R^v)_r$ 和 U 基团间的连接点被表示为不固定时, $(R^v)_r$ 可与 U 基团上任何可以使用的碳原子连接。应注意的是, 当 U 基团上的连接点被表示为不固定时, U 基团可通过取代氢原子而与式 I 的其余部分通过 U 基团上任何可供使用的碳进行连接。

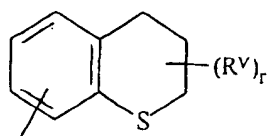
陈列 1



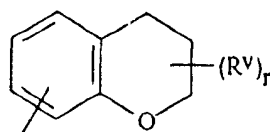
15



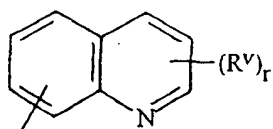




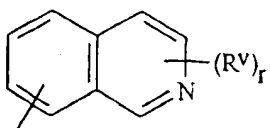
U-54



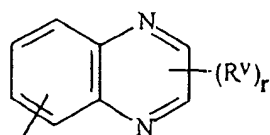
U-55



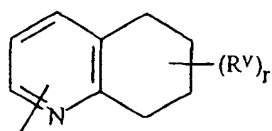
U-56



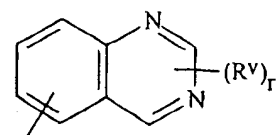
U-57



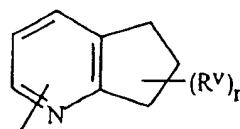
U-58



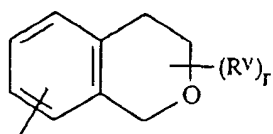
U-59



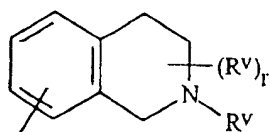
U-60



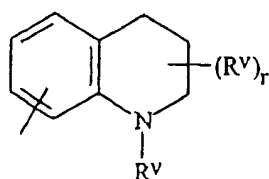
U-61



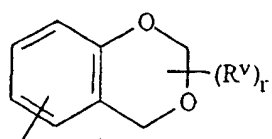
U-62



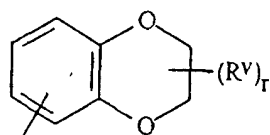
U-63



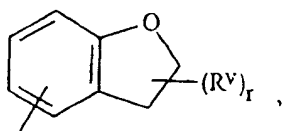
U-64



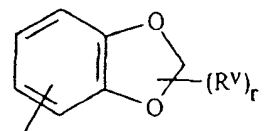
U-65



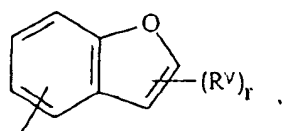
U-66



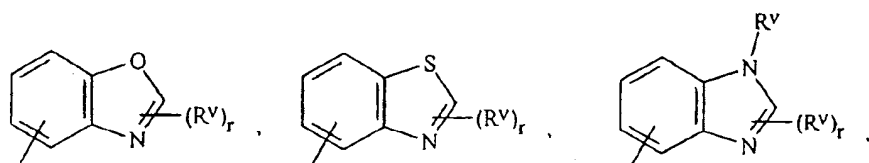
U-67



U-68



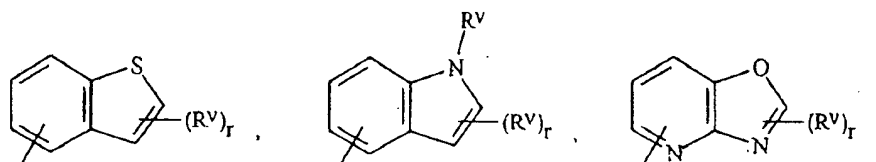
U-69



U-70

U-71

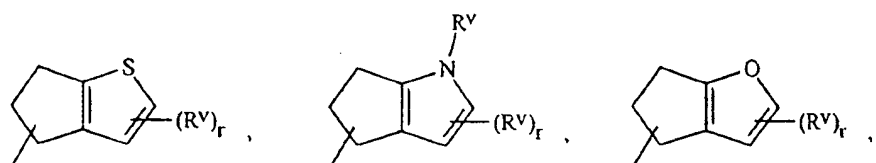
U-72



U-73

U-74

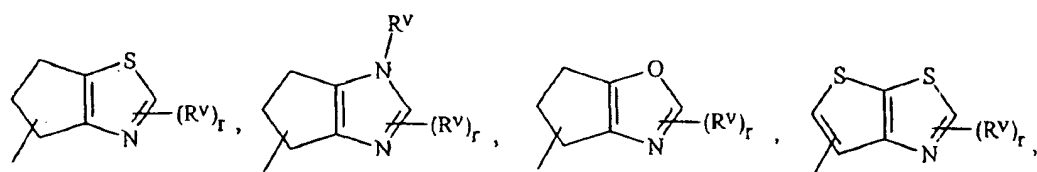
U-75



U-76

U-77

U-78

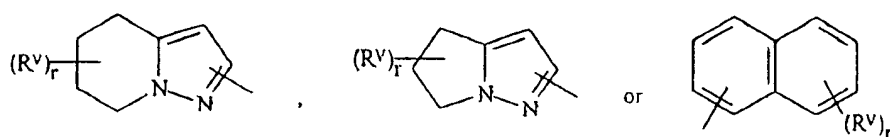


U-79

U-80

U-81

U-82



U-83

U-84

U-85

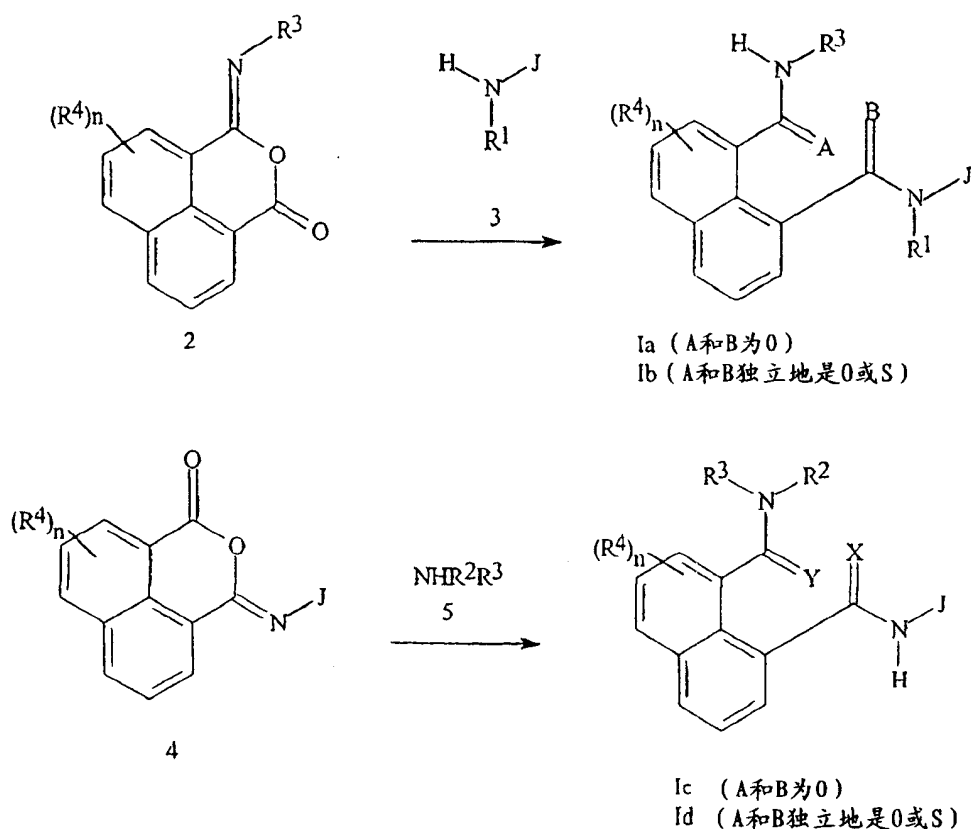
式 I 和式 II 的化合物可通过如反应方案 1-21 所描述的下述一种或多种方法或变更方法进行制备。在下述反应方案中所述的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、5 A、B、m 和 n 的定义如在上述发明概述或其附属部分中所定义。

式 I 的化合物可通过反应方案 1-9 所概述的程序进行制备。式 Ia-h 的化合物为式 I 化合物的各种子集。

典型程序描述于反应方案 1 中，并涉及在碱存在或不存在的情况下

式 2 的异萘亚甲基酰亚胺 (isonaphthalimide) 与式 3 的胺的连接或式 4 的化合物与式 5 的胺的连接。典型的碱包括胺碱, 如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。在某些情况下, 使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。式 3 和式 5 的胺类是市售的、在化学文献中已充分描述的, 或是由已确立的文献步骤易于得到的。利用各种的标准硫代转移剂包括五硫化磷和 Lawesson 试剂, 可将式 Ia 的酰胺转化为式 Ib 的硫代酰胺。

反应方案 1

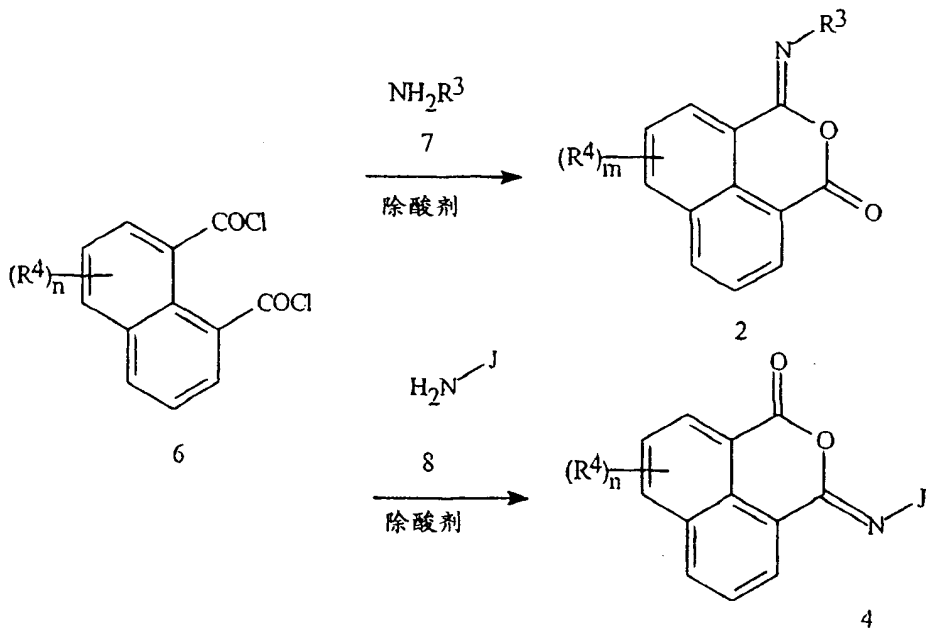


10

式 2 和式 4 的化合物通常是通过将式 6 的 1,8-萘酰氯 (1,8-naphthaloyl chloride) 分别与式 7 的胺或式 8 的胺连接而制备的 (反应方案 2)。典型的除酸剂包括胺碱, 如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。在某些情况下, 使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。在一些情况下, 式 7 的胺当过量使用时可用作除酸剂。式 6 的 1,8-萘酰氯化合物已在化学文献中进行了充分描述, 并通常是由相应的 1,8-萘二甲酸或酸酐、使用通常

用于羧酸到羧酰氯 (carboxylic acid chloride) 的转换的氯化试剂制备的。这些通常使用的氯化试剂包括氯氧化磷和五氯化磷。

反应方案 2

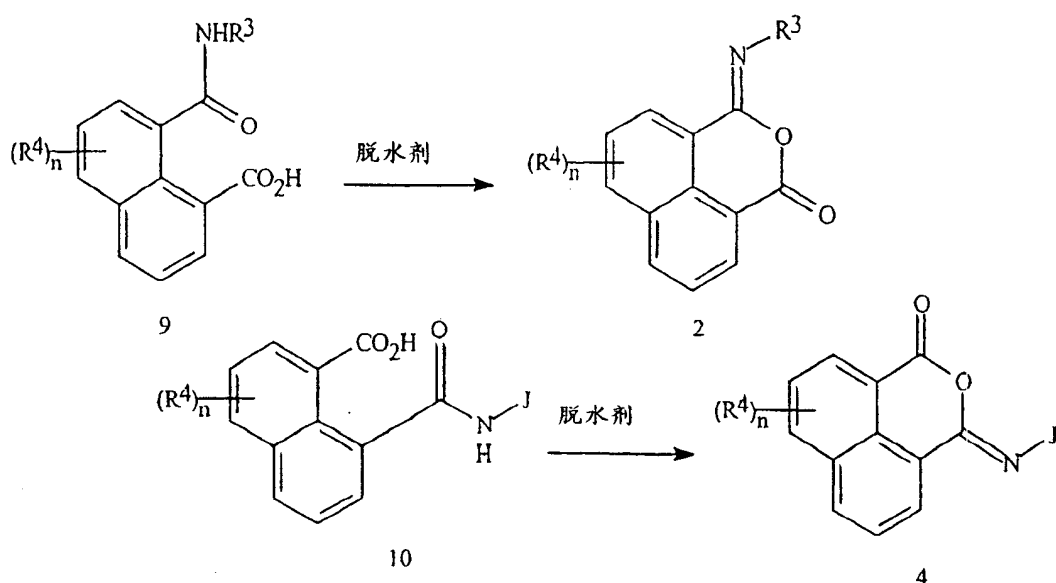


5

一个供选择的制备式 2 和式 4 化合物的程序分别涉及式 9 和式 10 的 8-氨基羰基-1-萘甲酸的环化作用 (反应方案 3)，它是利用脱水试剂、在惰性溶剂中、 -30 至 $30^\circ C$ 的温度范围内、除酸剂存在或不存在的条件下进行的。典型的脱水试剂包括二环己基碳二亚胺和三氟醋酸酐。聚合物支持的试剂如聚合物结合的二环己基碳二亚胺是有用的。典型的除酸剂包括胺碱，如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。在某些情况下，使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。典型的惰性试剂包括非质子溶剂，如二氯甲烷和 1-氯丁烷。典型反应稳定范围为 -5 至 $25^\circ C$ 。

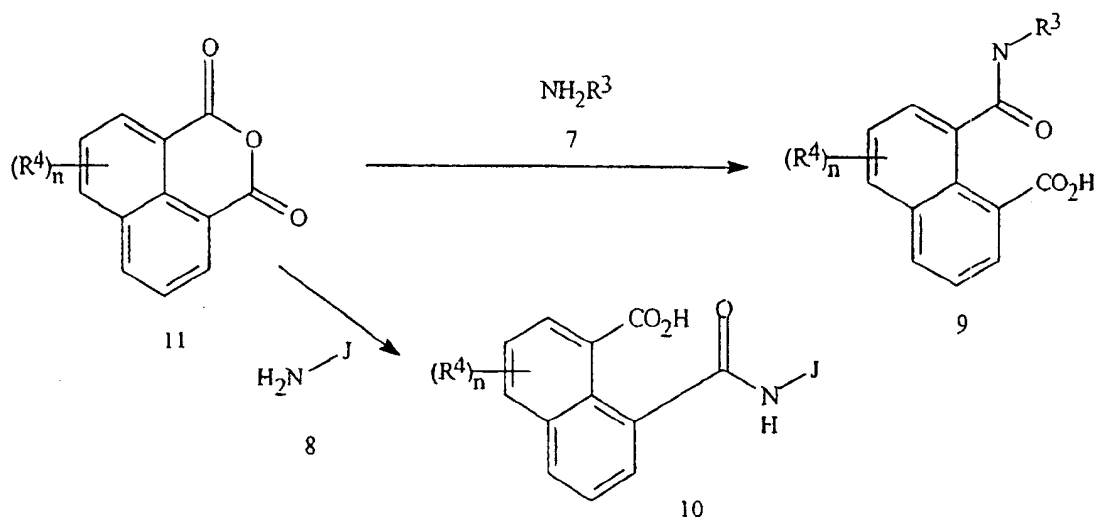
15

反应方案 3



式 9 和式 10 的 8-氨基羰基-1-萘甲酸的制备涉及在惰性溶剂中、0-30℃的温度范围内，使式 11 的 1,8-萘二甲酸酐分别与式 7 的胺或式 8 的胺连接（反应方案 4）。典型的惰性试剂是二甲基甲酰胺。反应 5 通常是在 5-10℃的稳定范围内进行。

反应方案 4

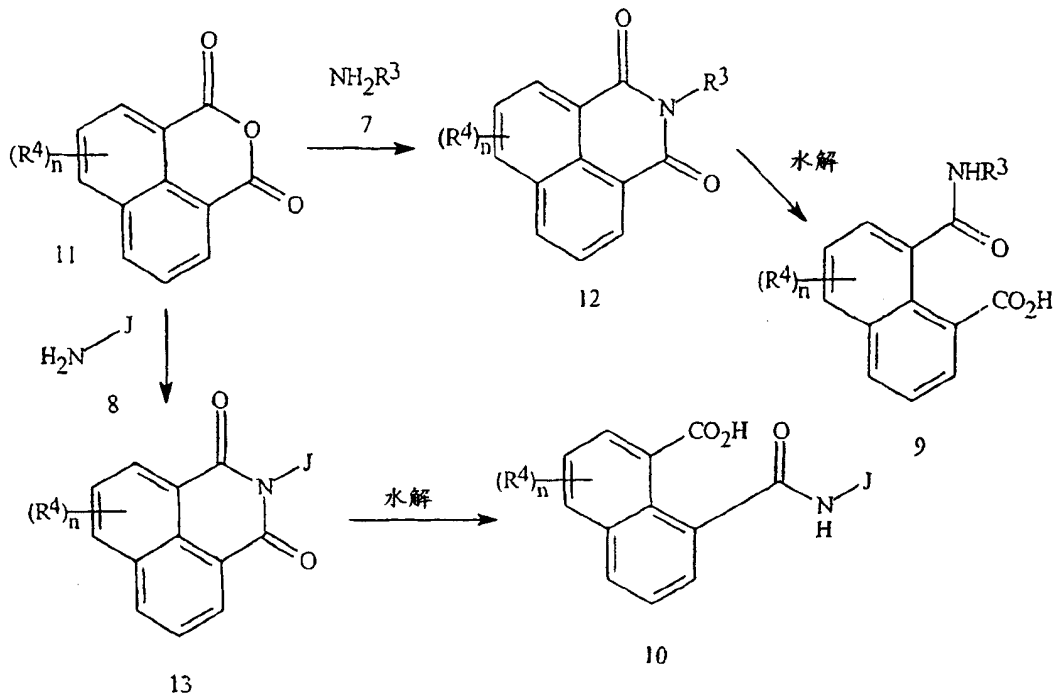


一个供选择的制备式 9 和式 10 的 8-氨基羰基-1-萘甲酸的程序分别涉及式 12 和式 13 的 1,8-萘亚甲基酰亚胺的水解（反应方案 5），该水解利用氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾，在质子溶剂体系如水-甲醇或水-二恶烷中、在高温下进行。该反应通常是在反应混合物的回流温度下进行。式 12 和式 13 的 1,8-萘亚甲基酰亚胺化合物通常是如下

制备的：即通常在酸的存在下，在高温下使式 11 的 1,8-萘二甲酸酐分别与式 7 或式 8 的胺缩合。典型反应涉及使式 11 的 1,8-萘二甲酸酐和式 7 或式 8 的胺在醋酸中进行回流。

反应方案 5

5

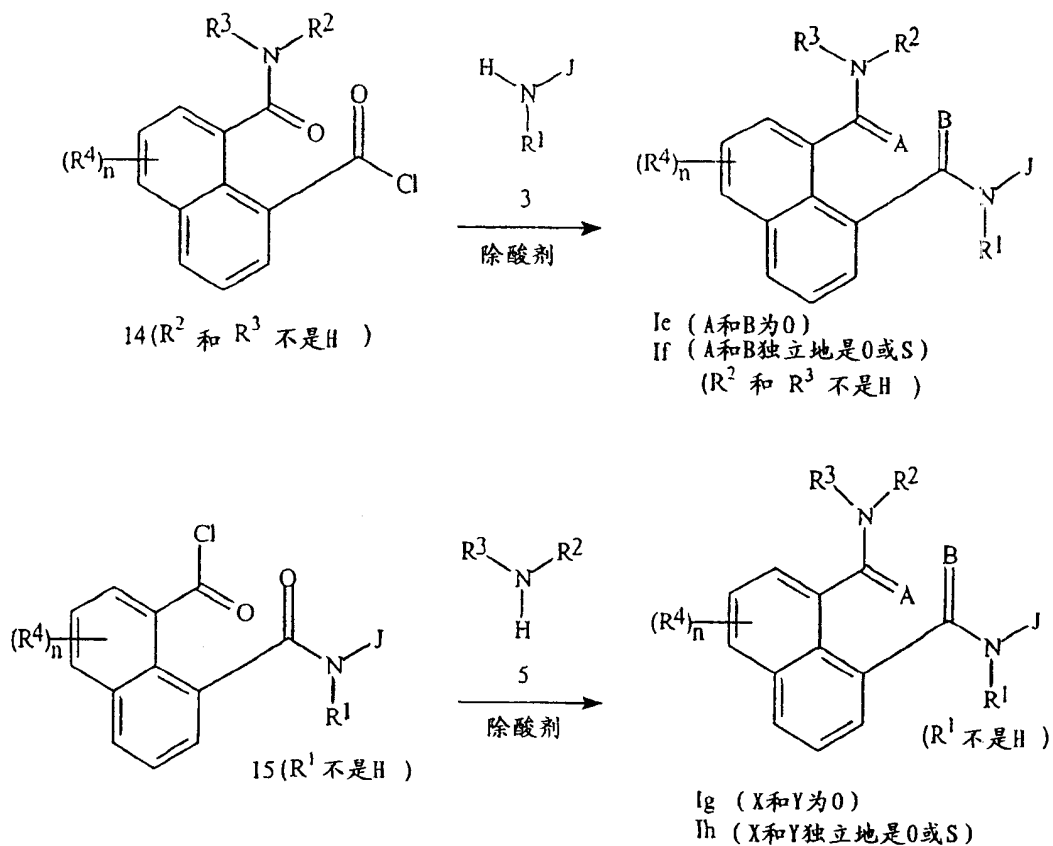


一个供选择的制备式 I 化合物的程序涉及在除酸剂的存在下使式 14 和式 15 的 8-氨基羰基-1-萘甲酰氯分别与式 3 的胺或式 5 的胺连接 (反应方案 6)。典型的除酸剂包括胺碱，如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。在某些情况下，使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。通常反应温度范围为 0-25°C。

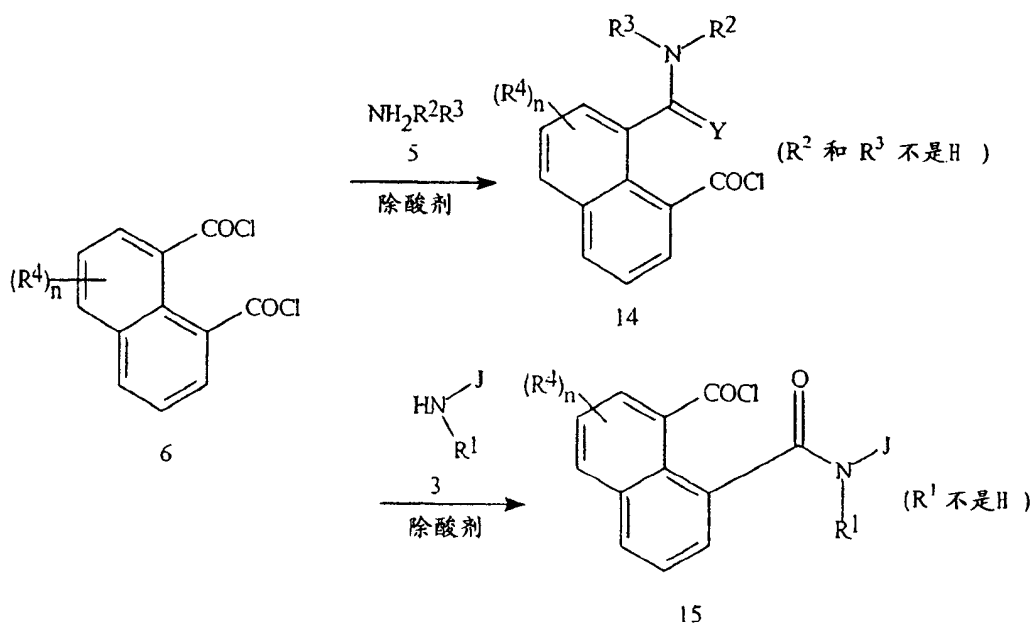
由在除酸剂的存在下使相应的式 6 的 1,8-萘甲酰二氯 (1,8-naphthaloyl dichloride) 分别与式 5 或式 3 的胺进行连接，可以得到式 14 和式 15 的 8-氨基羰基-1-萘甲酰氯 (反应方案 7)。典型的除酸剂包括胺碱，如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。在某些情况下，使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。

反应方案 6

20



反应方案 7



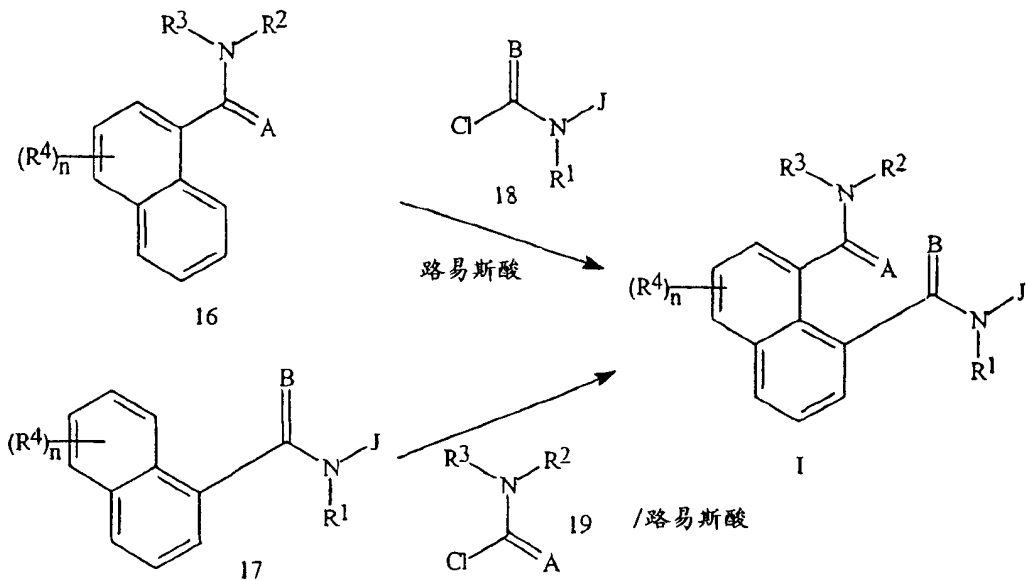
5

制备式 I 化合物的另一程序涉及式 20 的萘的分步进行的甲氨酰化或

硫代甲氨酰化（反应方案 8 和 9）。在弗瑞德-克来福特反应的条件下用路易斯酸进行处理时，式 16 或式 17 的 1-萘甲酰胺或 1-萘硫代甲酰胺（1-naphthalenethiocarboxamide）与式 18 或式 19 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯连接，提供式 I 的化合物（反应方案 8）。常用的路易斯酸包括氯化铝和氯化锡。

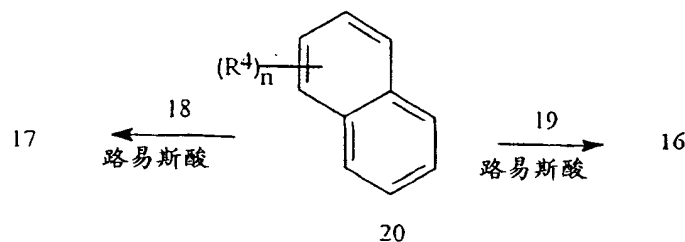
式 16 或式 17 的 1-萘甲酰胺或 1-萘硫代甲酰胺的制备（反应方案 9）涉及在弗瑞德-克来福特反应的条件下、在路易斯酸如氯化铝和氯化锡存在下，使式 20 的萘分别与式 19 或式 18 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯进行连接。式 20 的萘、式 18 和式 19 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯均为市售可得，在化学文献中已充分进行了描述，或者遵照已确立的文献程序进行制备。

反应方案 8



15

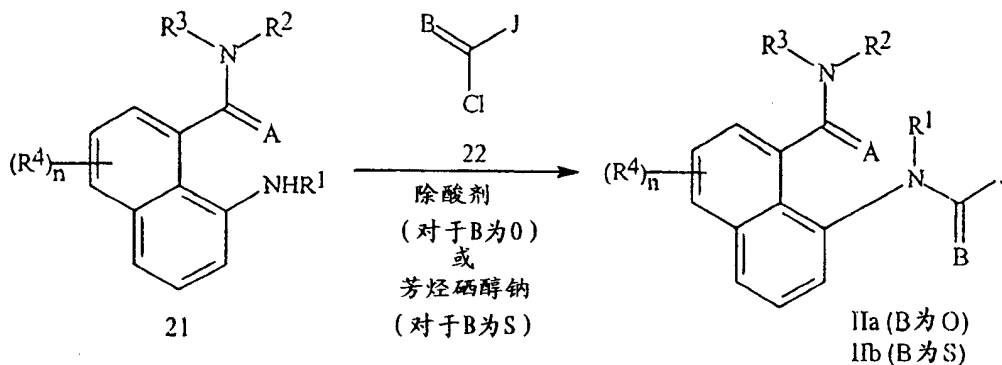
反应方案 9



式 II 的化合物可通过下述反应方案 10-13 中所描述的方法或改变方案中的一种或多种制备。式 IIa-b 的化合物是式 II 化合物的子集。

典型程序描述于反应方案 10 中并涉及使式 21 的 8-氨基-萘-1-氨甲酰在除酸剂的存在下与式 22 的碳酰氯进行连接，以提供式 IIa 的化合物，或者在芳烃硒醇盐 (areneselenolate) 的存在下与式 22 的硫代碳酰氯进行连接，以提供式 IIb 的化合物。典型的除酸剂包括胺碱，如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶，其它除酸剂包括氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾，以及碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾。在某些情况下，使用聚合物支持的除酸剂如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶是有用的。典型的芳烃硒醇盐包括芳烃硒醇钠。式 22 的碳酰氯和硫代碳酰氯为市售可得，在化学文献中已充分进行了描述，或者遵照已确立的文献程序易于进行制备。利用标准硫代转移剂如五硫化磷和 Lawesson 试剂可将式 IIa 的酰胺转化为 IIb 的硫代酰胺。

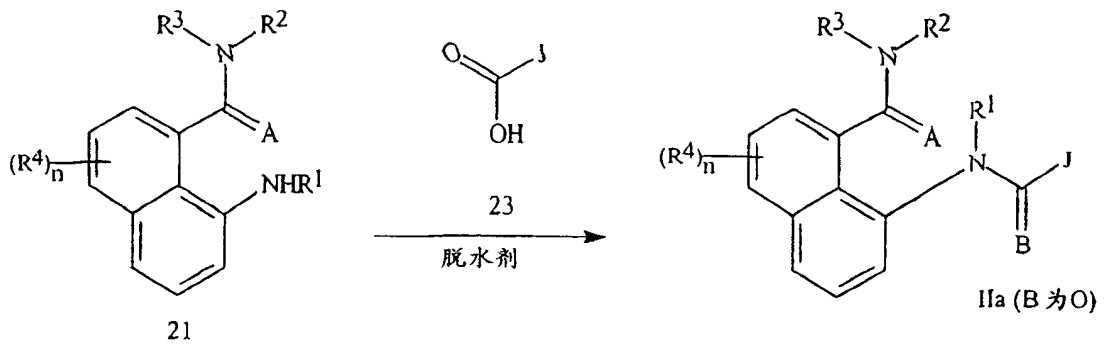
反应方案 10



制备式 IIa 化合物的另一程序涉及在脱水试剂如二环己基碳二亚胺 (DCC) 的存在下使式 21 的 1-氨基-萘-8-氨甲酰或 1-氨基-萘-8-硫代氨甲酰与式 23 的羧酸进行连接。聚合物支持的试剂如聚合物结合的二环己基碳二亚胺是有用的。式 23 的苯甲酸为市售可得，在化学文献中已充分进行了描述，或者遵照已确立的文献程序易于进行制备。因为用于制备氨甲酰的文献很广泛，所以反应方案 10 和反应方案 11 的程序仅为制备式 II 化合物的有用方法的代表性例子。

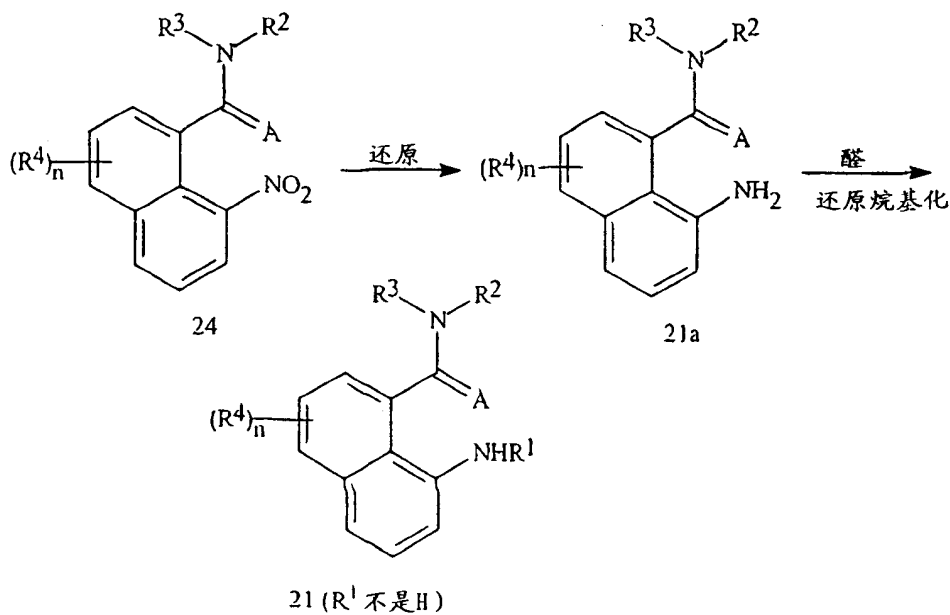
反应方案 11

25



式 21a 的 8-氨基-萘-1-氨甲酰或 8-氨基-萘-1-硫代氨甲酰通常是通过还原硝基基团而分别由式 24 的相应的 8-硝基-萘-1-氨甲酰和 8-硝基-萘-1-硫代氨甲酰得到的。典型程序涉及在碳或氧化铂上的金属催化剂如钯的存在下、在羟基溶剂如乙醇和异丙醇中用氢进行的还原作用。这些方法已在化学文献中作了充分记载。通过已知的方法，包括直接烷基化或通过通常优选的胺的还原烷基化，可通常在这一阶段引入 R^1 取代基如烷基、取代烷基等。通常使用的方法是在还原剂如氰基氢硼化钠的存在下，使氨基萘 21a 与醛结合，以产生式 21 的化合物，其中 R^1 不是 H。

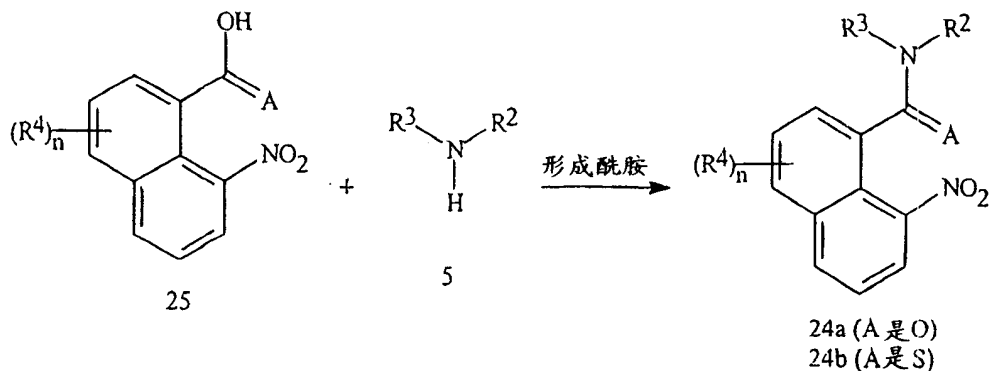
反应方案 12



由 8-硝基-萘-1-甲酸易于制备式 24 的中间酰胺，8-硝基-萘-1-甲酸为市售、文献中已知，或通过已在文献中确立的、用于萘或通用于芳组的衍生作用而制备。形成酰胺的典型方法在此可以使用。这

些包括式 25 的酸和式 5 的胺利用例如 DCC 进行的脱水连接，以及使酸转化为活性形式如酰基氯或酸酐，随后与胺连接，形成式 24a 的酰胺。另外，氰基磷酸二乙酯是用于这类涉及酸活化作用的有用试剂。对于这类反应，化学文献很充分。利用市售硫代转移剂如五硫化磷和 Lawesson 试剂，式 24a 的酰胺易于转化为式 24b 的硫代酰胺。

反应方案 13

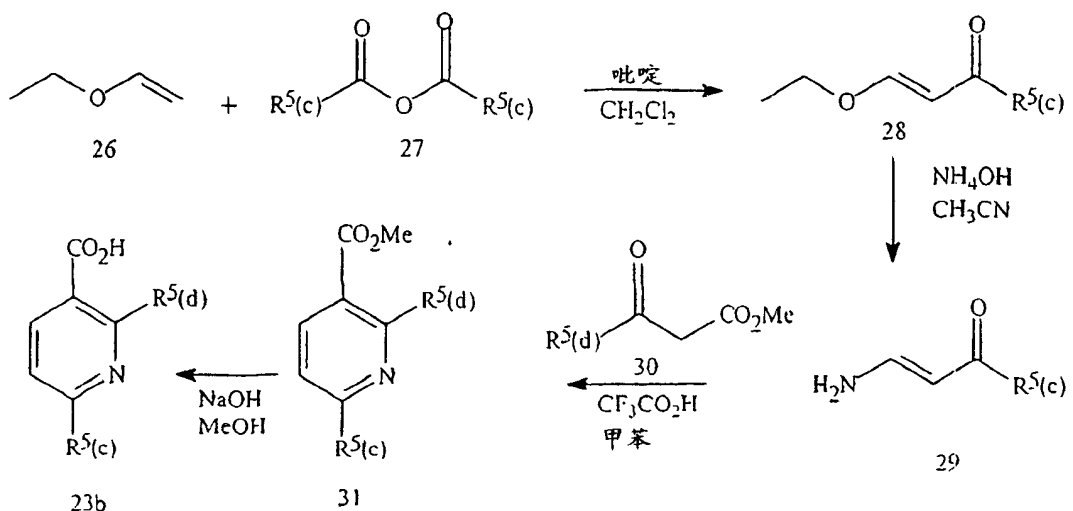


式 23a 的苯甲酸（式 23 的化合物，其中 J 任选地被取代的苯基环）在本领域中是众所周知的。式 4 的某些杂环酸的制备描述于反应方案 14 - 21 中。各种杂环酸及其通常合成方法可见于 WO 98/57397 中。

反应方案 14 描述了具有代表性的吡啶酸（23b）的合成。所述方法涉及已知的由β-酮酸酯和 4-氨基丁烯酮（29）合成吡啶。取代基 R⁵(c) 和 R⁵(d) 包括例如烷基和卤代烷基。

15

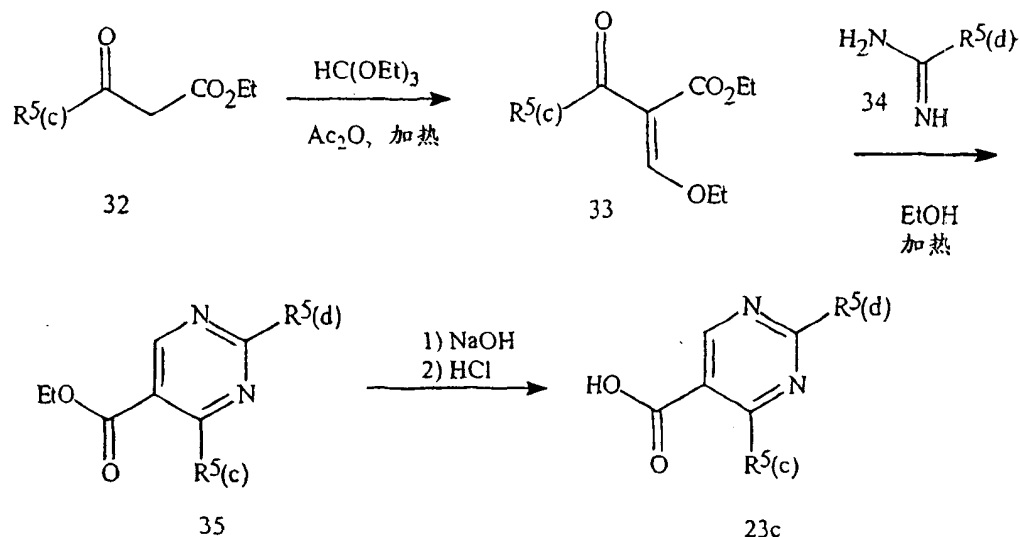
反应方案 14



反应方案 15 描述了具有代表性的嘧啶酸 (23c) 的合成。所述方法涉及已知的由亚乙烯基-β-酮酸酯 (33) 和脒 (34) 合成嘧啶。取代基 R^s(c) 和 R^s(d) 包括例如烷基和卤代烷基。

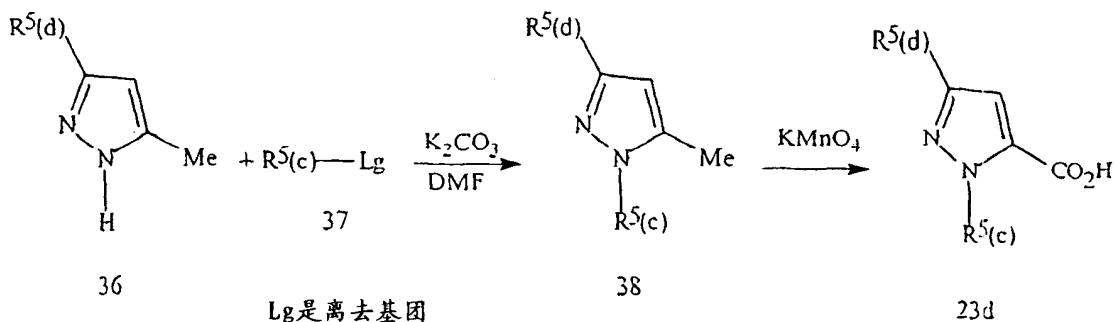
反应方案 15

5



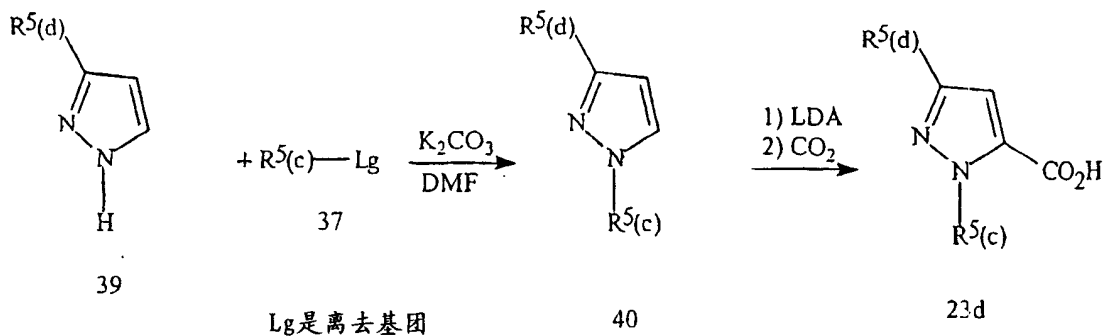
反应方案 16-21 描述了具有代表性的吡唑酸 (23d) 的合成。反应方案 16 中 23d 的合成的关键步骤涉及通过吡唑的芳基化或烷基化引入 R^s(c) 取代基。芳基化剂或烷基化剂 R^s(c)-Lg (其中 Lg 是离去基团, 如 Cl、Br、I, 磺酸根如对甲苯磺酸根或甲磺酸根, 或硫酸根如-SO₂OR^s(c)) 包括 R^s(c) 基团, 如 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基; 或苯基、苄基、苯甲酰基、每一环或环体系被任选地取代的 5 元或 6 元杂芳环。甲基基团的氧化作用产生吡唑羧酸。一些更优选的 R^s(d) 基团包括硫代烷基。

反应方案 16



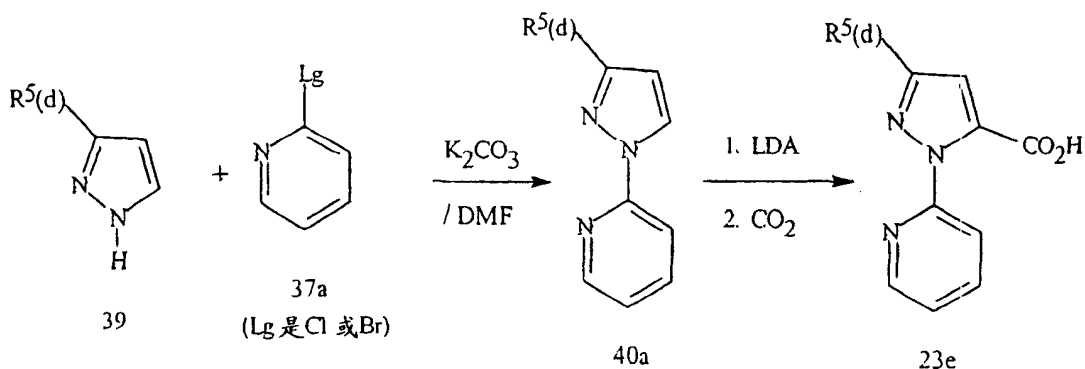
反应方案 17 描述了式 23d 的吡唑的合成。这些酸可以如下合成：通过利用二异丙基酰胺锂 (LDA) 使式 40 的化合物金属化，然后通过用二氧化碳使锂盐羧化，产生了利用二异丙基酰胺锂 (LDA) 的金属化作用，式 40 化合物的羧化作用是关键步骤。R⁵(c) 基团的引入类似于反应方案 16 中的方式，即通过用式 37 的化合物进行烷基化或芳基化。具代表性的 R⁵(d) 基团包括例如氰基、硫代烷基和卤素。

反应方案 17



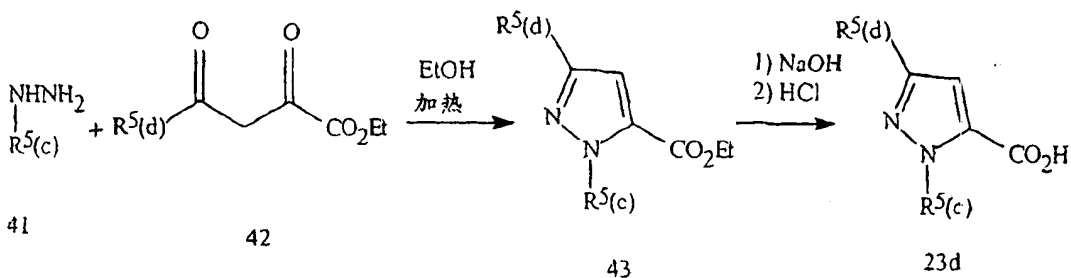
如反应方案 18 所示，所述方法对于制备式 23e 的 1-(2-吡唑基)吡唑羧酸尤其有用。式 39 的吡唑与式 37a 的 2,3-二卤代吡唑反应，产生具有良好产率的式 40a 的 1-吡唑基吡唑，其具有良好的所需区域化学特性。如上所述的式 40a 化合物的金属化和羧化产生式 23e 的 1-(2-吡唑基)吡唑羧酸。

反应方案 18



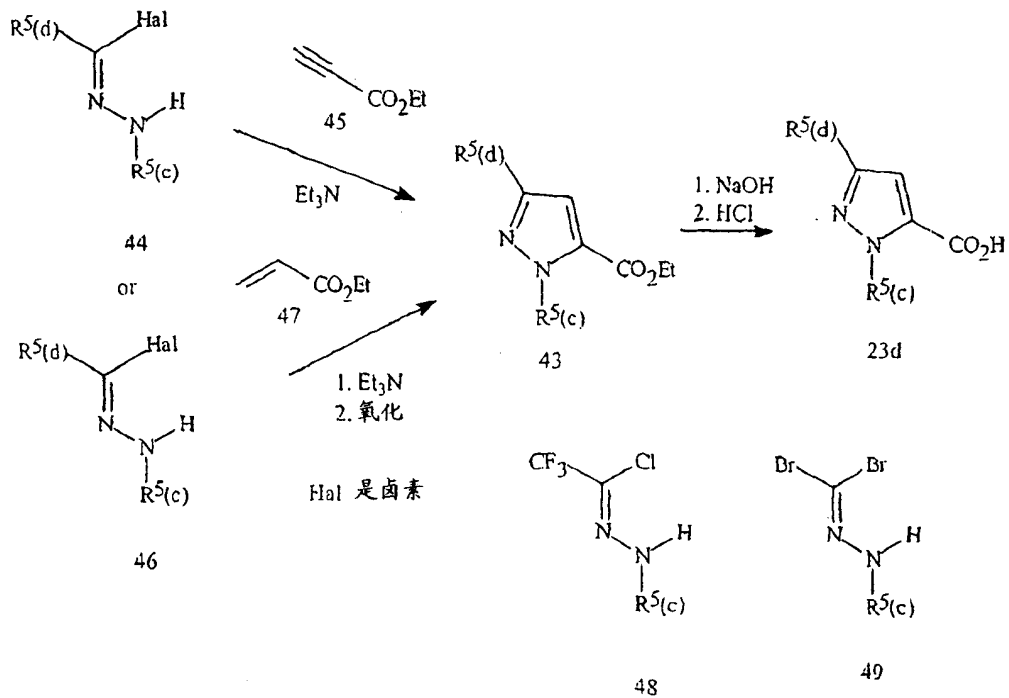
反应方案 19 描述了式 4c 的吡唑的合成。它们可通过式 41 的任选被取代的苯基胍与式 42 的酮基丙酮酸盐反应生成式 43 的吡唑酯而制备。所述酯的水解产生式 23d 的吡唑酸。此方法对于制备其中的 $R^5(c)$ 是任选被取代的苯基而 $R^5(d)$ 是卤代烷基的化合物尤其有用。

反应方案 19



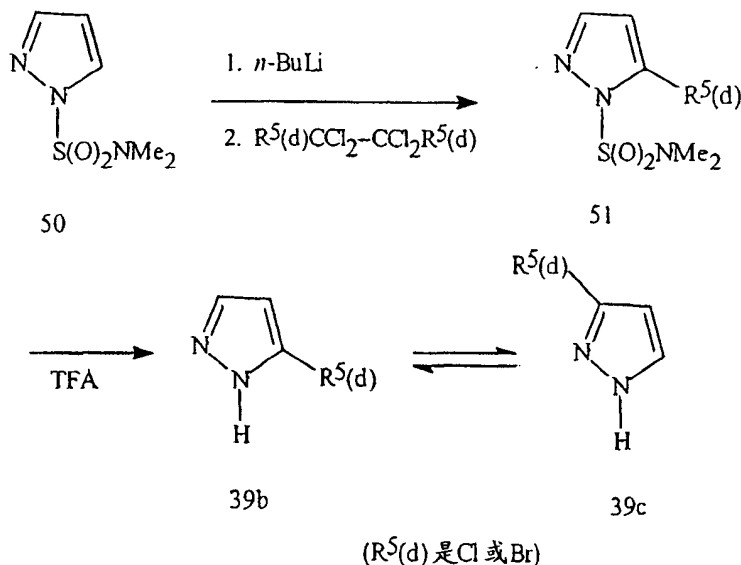
反应方案 20 描述了式 23d 的吡唑酸的另一供选择的合成方法。它们可通过适当取代的 nitrilimine 与式 45 的取代丙炔酸酯或式 47 的丙烯酸酯的 3 + 2 环加成而制备。与丙烯酸酯的环加成需要附加的氧化作用，使中间体安替吡啉氧化为吡唑。酯水解产生式 23d 的吡唑酸。用于此反应的优选偕卤代亚胺包括式 48 的三氟甲基偕氯代亚胺和式 49 的偕二溴代亚胺 (iminodibromide)。化合物如 48 是已知的 (*J. Heterocycl. Chem.* 1985, 22 (2), 565-8)。化合物如 49 可通过已知方法获得 (*Tetrahedron Letters* 1999, 40, 2605)。此方法对于制备其中的 $R^5(c)$ 是任选被取代的苯基而 $R^5(d)$ 是卤代烷基或溴的化合物尤其有用。

反应方案 20



式 39 的起始吡唑是已知的化合物。式 39a 的吡唑（式 39 的化合物，其中 $\text{R}^5(\text{d})$ 是 CF_3 ）为市售。式 39c 的吡唑（式 39 的化合物，其中 $\text{R}^5(\text{d})$ 是 Cl 或 Br ）可通过文献方法制备（*Chem. Ber.* 1966, 99(10), 3350-7）。在反应方案 21 中描述了制备化合物 39c 的另一供选择的有用方法。用正丁基锂使氮磺酰吡唑金属化，随后用六氯乙烷（ $\text{R}^5(\text{d})$ 为 Cl ）或 1,2-二溴四氯乙烷（ $\text{R}^5(\text{d})$ 为 Br ）进行直接卤化，即产生式 51 的卤化衍生物。用三氟醋酸（TFA）在室温下除去氮磺酰基团进行得很完全，产率良好，从而产生式 39c 的吡唑。本领域的技术人员将知道，式 39c 是式 39b 的互变异构体。

反应方案 21



应认识到的是，上述用于制备式 I 和式 II 化合物的一些试剂和反应条件可能与中间体中存在的某些官能基团并不相容。在这些情况下，在合成过程中引入保护/脱保护程序或官能基团相互转换将有助于获得所需产物。保护基团的使用和选择对于化学合成的技术人员而言是显而易见的（参见例如 Greene, T.W.; Wuts, P.G.M 所著《Protective Groups in Organic Synthesis》（有机合成中的保护基团）第二版；Wiley: New York, 1991）。本领域的技术人员将知道，在某些情况下，在引入特定试剂之后（如在任何单独的反应方案中所描述的），可能需要进行另外的为加以详细描述

5 的常规合成步骤，以完成式 I 和 II 的化合物的合成。本领域的技术人员还应认识到，为了制备式 I 和 II 的化合物，可能需要将上述反应方案中所描述的步骤结合进行，而其顺序可与所述的具体顺序不同。

本领域的技术人员还应认识到，在此所述的式 I 和 II 的化合物及中间体可进行各种亲电、亲核、自由基、金属有机、氧化和还原反应，以加成取代基或对现有取代基进行改性。

15

无需进一步详述，具信利用上述描述的本领域的技术人员能够在其最完全的范围内应用本发明。因此，以下的实施例只应视为例示性的，并不以任何方式对发明内容进行限制。¹H NMR 光谱以 ppm 由四甲基硅烷的低磁场记录得到：s 为单一态，d 为双重态，t 为三重态，q 为四重态，m 为多重态，dd 为双重态的双重态，dt 为三重态的双重态，br 为宽单一态，m. p. 熔点。

20

实施例 1

制备 N-甲基-N'-(2-溴-4-氟苯基)-1,8-萘-二甲酰胺

步骤 A: 制备 8-[(甲氨基)羰基]-1-萘甲酸

在室温下, 向经搅拌的 1,8-萘二甲酸酐 (5g, 25.3mmol) 的 N,N-二甲基甲酰胺 (50mL) 溶液中加入甲胺 (0.82g, 26.5mmol) 的 N,N-二甲基甲酰胺 (5mL) 溶液。将反应混合物搅拌 2.5 小时。在减压下除去溶剂。用小量的二乙醚洗涤由此而得到的粗固体, 并进行空气干燥, 以生成产物 (5g), 其经 NMR 分析确定含 8-[(甲氨基)羰基]-1-萘甲酸和 1,8-萘二甲酸酐, 比例为约 7:1。此物质不经进一步纯化而用于随后的反应中。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.77 (双重态, 3H), 7.55-7.65 (多重态, 3H), 7.83 (双重态, 1H), 8.03-8.12 (多重态, 2H), 8.39 (四重态, 1H)。

步骤 B: 制备 N-甲基-N'-(2-溴-4-氟苯基)-1,8-萘-二甲酰胺

向经搅拌的、在氮气氛下冷却至约 5°C 的按步骤 A 所述制备的 8-[(甲氨基)羰基]-1-萘甲酸 (22.3g, 97.4mmol) 和吡啶 (15.4g, 0.195mol) 的二氯甲烷 (300ml) 溶液中, 滴加在二氯甲烷 (50ml) 中稀释的三氟醋酸酐 (22.5g, 0.107mol)。滴加后, 在常温下将反应混合物进一步搅拌半小时。滤除小量的固体。在减压下将滤液浓缩为固体, 用热己烷 (3 × 250ml) 对该固体进行萃取。将己烷萃取液合并, 并在减压下进行浓缩, 产生 3-(甲基亚氨基)-1H,3H-萘并[1,8-cd]吡喃-1-酮粗品 (15g)。

将由此获得的 3-(甲基亚氨基)-1H,3H-萘并[1,8-cd]吡喃-1-酮 (0.25g, 1.19mmol) 溶解于二氯甲烷 (3ml) 中, 并加入 2-溴-4-氟苯胺 (0.17g, 1.45mmol)。在室温下搅拌反应混合物 48 小时。对固体进行过滤、收集, 并用小量甲醇在二氯甲烷中进行洗涤和进行空气干燥, 以产生 N-甲基-N'-(2-甲基-4-氟苯基)-1,8-萘-二甲酰胺 (0.12g, 熔点为 249°C)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.37 (单一态, 3H), 2.72 (双重态, 3H), 7.05-7.12 (多重态, 2H), 7.54-7.64 (多重态, 3H), 7.75-7.83 (多重态, 2H), 8.05-8.10 (多重态, 2H), 8.33 (四重态, 1H),

9.84 (单一态, 1H)。

实施例 2

制备 N-甲基 8-[(3,4-二氟苯基)羰基氨基]-1-萘甲酰胺

步骤 A: 制备 N-甲基 8-硝基 1-萘甲酰胺

- 5 向经搅拌的室温下的 8-硝基-1-萘甲酸 (1.5g, 6.9mmol)、甲胺 (0.22g, 7.3mmol) 和咪唑 (0.68g, 8.3mmol) 的 N,N-二甲基甲酰胺 (12mL) 溶液中, 加入氰基磷酸二乙酯 (1.24g, 7.6mmol)。将反应混合物彻夜搅拌, 倒入水 (100mL) 中, 并用醋酸乙酯 (3×100mL) 萃取。合并醋酸乙酯萃取液, 在无水硫酸镁上干燥, 过滤, 和在减压下进行浓
10 缩, 以产生固体, 该固体用小量甲醇洗涤, 生成产物 (0.64g), 该产物不经进一步纯化而被利用。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.76 (双重态, 3H), 7.72-8.37 (多重态, 6H), 8.66 (宽四重态, 1H)。

步骤 B: 制备 N-甲基 8-胺基 1-萘甲酰胺

- 15 在 30psi 氢压下, 用催化量的钨 (10%, 在活性炭上) 氢化 N-甲基 8-硝基-1-萘甲酰胺 (0.5g, 2.17mmol) 1 小时。通过 C 盐对反应混合物进行吸滤, 并在减压下进行浓缩, 以生成产物 (0.42g), 该产物不经进一步纯化而被利用。

20 $^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.82 (双重态, 3H), 5.46 (单一态, 2H), 6.81-7.85 (多重态, 6H), 8.59 (宽四重态, 1H)。

步骤 C: 制备 N-甲基 8-[(3,4-二氟苯基)羰基氨基]-1-萘甲酰胺

- 25 向经搅拌的 N-甲基 8-胺基 1-萘甲酰胺 (0.2g, 1mmol) 和吡啶 (0.24g, 3mmol) 的二氯甲烷 (10mL) 溶液中, 分批加入在二氯甲烷 (2mL) 中的 acetyl chloride (94.2mg, 1.2mmol)。混合物搅拌 3 小时。用吸滤收集固体 (110mg, 熔点高于 250°C)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.43 (双重态, 3H), 7.46-8.10 (多重态, 9H), 8.51 (宽四重态, 1H), 10.13 (单一态, 1H), 。

实施例 3

制备 N-甲基 8-[(2-噻吩基)羰基氨基]-1-萘甲酰胺

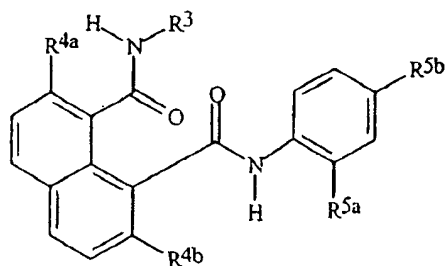
- 30 向经搅拌的 N-甲基 8-胺基 1-萘甲酰胺 (0.2g, 1mmol) 和吡啶 (0.24g, 3mmol) 的二氯甲烷 (10mL) 溶液中, 分批加入在二氯甲烷 (2mL) 中的 2-噻吩羧酰氯 (176mg, 1.2mmol)。混合物搅拌 3 小时。用稀盐

酸、饱和碳酸氢钠水溶液和水顺序洗涤反应混合物。在减压下部分除去溶剂。用吸滤收集由此而形成的固体 (36mg, 熔点为 210°C)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.53 (双重态, 3H), 7.26 - 8.10 (多重态, 9H), 8.66 (宽四重态, 1H), 10.07 (单一态, 1H), 。

- 5 通过在此所述的程序和本领域中已知的方法, 可制备出以下的表 1 - 10 的化合物。在各表中使用了下列缩写: *t* 为叔, *s* 为仲, *n* 为正, *i* 为异, *c* 为环, Me 为甲基, Et 为乙基, Pr 为丙基, *i*-Pr 为异丙基, *t*-Bu 为叔丁基, Ph 为苯基, OMe 为甲氧基, OEt 为乙氧基, SMe 为甲基硫代, SEt 为乙基硫代, CN 为氰基, NO₂ 为硝基, TMS 为三甲基甲硅烷基, 10 S(O)Me 为甲基亚硫酸基, 而 S(O)₂Me 为甲基磺酰基。

表 1



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃

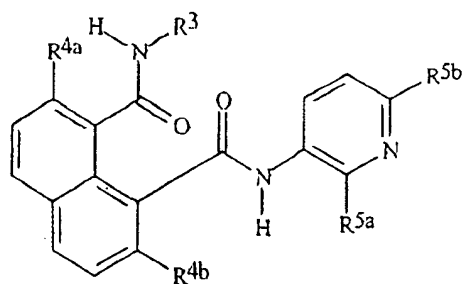
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-CIPh	CF ₃	Me	H	H	2-CIPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	H	2-CIPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	Br	Me	H	H	2-CIPh	Br
Me	H	Me	2-CIPh	Cl	Me	H	H	2-CIPh	Cl
Me	H	Me	2-CIPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-CIPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	Me	OMe
Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅					

表2



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

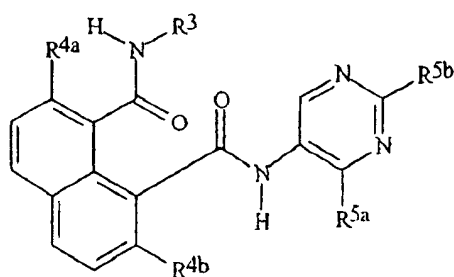
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-CIPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-CIPh	Cl
Me	Me	H	2-CIPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

表3



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl

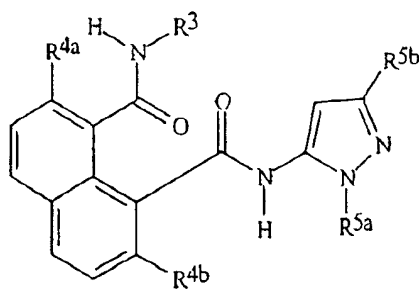
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

表4



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂

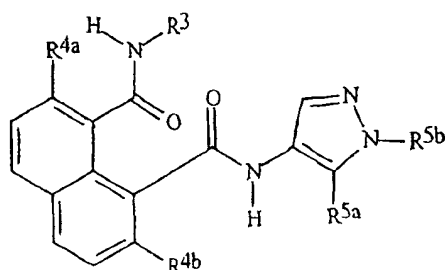
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CHF ₂	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-CIPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	CF ₃	Me	H	H	2-CIPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	H	2-CIPh	Br
Me	H	Me	2-CIPh	Br	Me	H	H	2-CIPh	Cl
Me	H	Me	2-CIPh	Cl	Me	H	H	2-CIPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-CIPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	Et	Br

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-CIPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Br
Me	Me	H	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Cl
Me	Me	H	2-CIPh	Br	Me	H	Cl	2-CIPh	SCHF ₂

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMe
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	OEt
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃

表5



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂

<u>R3</u>	<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>	<u>R3</u>	<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Allyl	Me	H	H	Me	Allyl
Me	H	Me	Et	CF ₃ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₃ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂

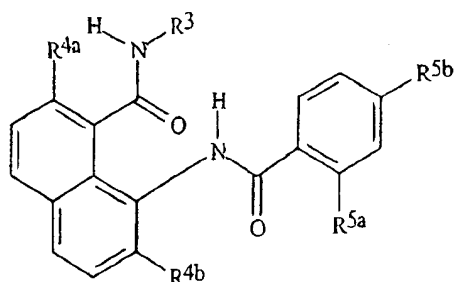
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-吡啶基	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBrF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Et	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	CBrF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBrF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	Allyl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	Allyl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CHF ₂
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Et	Me	H	Cl	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Et
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CBrF ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CBrF ₂
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CClF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CBrF ₂	Me	Cl	H	Me	Allyl
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CF ₃ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	Me
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	Me	Cl	H	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Et	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CBrF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃					

表6



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

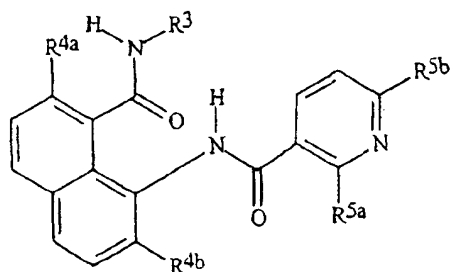
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

表7



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	CCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl

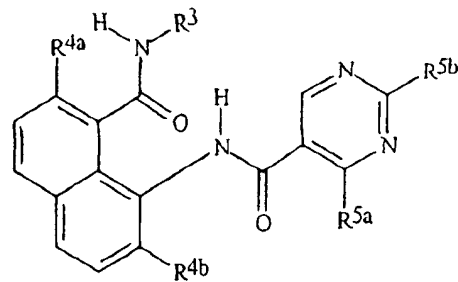
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-CIPh	CF ₃	Me	H	H	2-CIPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	H	2-CIPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-CIPh	Br	Me	H	H	2-CIPh	Br
Me	H	Me	2-CIPh	Cl	Me	H	H	2-CIPh	Cl
Me	H	Me	2-CIPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-CIPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-CIPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-CIPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-CIPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-CIPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-CIPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

表8



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

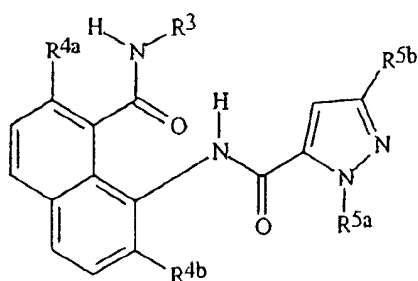
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-CIPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Br
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-CIPh	Cl
Me	Me	H	2-CIPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-McPh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OBt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

表9



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

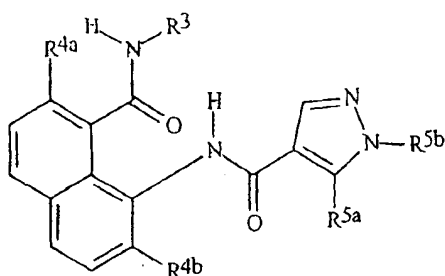
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CHF ₂	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	2-吡啶基	Cl	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	OEt

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Br
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMe
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	OEt
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-吡啶基	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	Cl	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

表10



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Allyl	Me	H	H	Me	Allyl

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Et	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-吡啶基	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBrF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-McPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-McOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	2-McOPh	CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Et	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CBrF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBrF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	Allyl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	Allyl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-吡啶基	CHF ₂
Me	Me	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	Et	Me	H	Cl	2-CIPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	CBrF ₂	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Et
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CBrF ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-吡啶基	CBrF ₂
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CBrF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	2-ClPh	Et
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	2-ClPh	CBrF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CClF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-吡啶基	CBrF ₂
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-F-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-吡啶基	CClF ₂
Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	Me	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	烯丙基
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃					

配制剂/效用

本发明的化合物通常与包含液体稀释剂、固体稀释剂或表面活性剂中至少之一的农业适用载体一起用作配制剂或组合物。配制剂或组合物的成分选择要与活性成分的物理性能、施用方式及环境因素（如土壤类型、湿度的稳定）相一致。有用的配制剂包括液体如溶液（包括可乳化的浓缩液）、悬浮液、乳化液（包括微滴乳状液和/或 suspoemulsions（悬浮乳状液））等，它们可被任选地稠化为凝胶。有用的配制剂还包括固体，如粉剂、粉末、颗粒剂、丸剂、片剂、膜剂等，它们可分散于水（“可湿润的”）或可溶于水。活性成分可被（微）胶囊化和进一步形成悬浮或固体制剂；或者，活性成分的整个制剂可被胶囊化（或“涂刷”）。胶囊可以控制或延缓活性成分的释放。可喷洒的制剂可在合适的介质中通过，且喷用量为每公顷约一至几百升。强力组合物主要用作进一步制剂的中间体。

15 所述组合物通常含有有效量的活性成分、以及下列大致范围的稀释剂和表面活性剂，各量之和为 100 重量%。

	重量%		
	活性成分	稀释剂	表面活性剂
可分散于水和可溶于水的颗粒剂、片剂和粉末剂	5-90	0-94	1-15
悬浮液, 乳化液, 溶液 (包括可乳化的浓缩液)	5-50	40-95	0-15
粉剂	1-25	70-99	0-5
颗粒剂和丸剂	0.01-99	5-99.99	0-15
强力组合物	90-99	0-10	0-2

在 Watkins 等的《Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers》(杀虫剂粉末吸收剂和载体手册)第二版(Dorland Books, Caldwell, New Jersey)中对典型的固体稀释剂作了描述。在 Marsden 的《Solvents Guide》(溶剂指南)第二版(Interscience, New York, 1950)中对典型的液体稀释剂作了描述。在《McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual》(McCutcheon 洗涤剂 and 乳化剂年报, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey)以及 Sisely 和 Wood 的《Encyclopedia of Surface Active Agents》(表面活性剂百科全书, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964)中列举了表面活性剂和推荐的应用。所有的制剂可含有小量的添加剂,以减缓泡沫、结块、腐蚀、微生物生长等,或含有增稠剂,以增加粘度。

表面活性剂包括例如:聚乙氧基化醇,聚乙氧基化烷基酚,聚乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯,磺基琥珀酸二烷基酯,烷基硫酸酯,烷基苯磺酸酯,有机硅氧烷, N, N - 二烷基牛磺酸酯,木质素磺酸酯,萘磺酸盐甲醛缩合物,聚羧酸酯,和聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物。固体稀释剂包括例如:粘土(如膨润土、蒙脱土、硅镁土和高岭土),淀粉,糖,二氧化硅,滑石,硅藻土,尿素,碳酸钙,碳酸钠和碳酸氢钠,和硫酸钠。液体稀释剂包括例如:水, N, N - 二甲基甲酰胺,二甲亚砷, N - 烷基吡咯烷酮,乙二醇,聚丙二醇,石蜡,烷基苯,烷基萘,橄榄油,蓖麻油,亚麻子油,桐油,芝麻油,玉米油,花生油,棉籽油,豆油,油菜籽油,椰子油,脂肪酸酯,酮类(如环己酮, 2 - 庚酮, 异佛尔酮和 4 - 羟基 - 4 - 甲基 - 2 - 戊酮),以及醇类(如甲醇,环己醇,癸醇和四氢糠醇)。

溶液（包括可乳化的浓缩液）可通过简单地对成分进行混合而制备。粉剂和粉末剂可通过混合和通常如在锤磨机或流体能碾压机中进行的研磨而制备。悬浮液通常通过湿磨制备，参见例如 U. S. 3, 060, 084。颗粒剂和丸剂可通过将活性物质喷在预制颗粒状载体上或通过附聚技术而制备。参见：Browning 的“Agglomeration”，*Chemical Engineering*，1967 年 12 月 4 日，第 147-48 页；《Perry's Chemical Engineer's Handbook》第 4 版（McGraw-Hill, New York, 1963）第 8-57 页及以下；和 PCT 出版物 WO 91/13546。丸剂可如 U. S. 4, 172, 714 所述而制备。可分散于水和可溶于水的颗粒剂可根据 U. S. 4, 144, 050、U. S. 3, 920, 442 和 DE 3, 246, 493 制备。片剂可根据 U. S. 5, 180, 587、U. S. 5, 232, 701 和 U. S. 5, 208, 030 制备。膜剂可根据 GB 2, 095, 558 和 U. S. 3, 299, 566 制备。

有关制剂领域的进一步信息，参见 T. S. Woods 的“The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture（制剂工作者工具箱 - 现代农业的产品形式）”，收于《Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food - Environment Challenge》（杀虫剂化学和生物科学，食品 - 环境挑战），T. Brooks 和 T. R. Roberts 编辑，第 9 届国际杀虫剂化学大会科研报告集，剑桥，1999 年，第 120-133 页。另外参见：U. S. 3, 235, 361 第 6 栏第 16 行至第 7 栏第 19 行及实施例 10-41；U. S. 3, 309, 192 第 5 栏第 43 行至第 7 栏第 62 行及实施例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167 和 169-182；U. S. 2, 891, 855 第 3 栏第 66 行至第 5 栏第 17 行及实施例 1-4；Klingman 著《Weed Control as a Science》（杂草控制科学），John Wiley and Sons 公司出版，纽约，1961 年，第 81-96 页；和 Hance 等著《Weed Control Handbook》（杂草控制手册）第 8 版，Blackwell Scientific Publications 出版，牛津，1989 年。

在以下实施例中，所有百分比均为重量百分比，且所有制剂均以常规方式制备。化合物号参见索引表 A 中的化合物。

实施例 A

可湿润的粉末剂

化合物 1	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木质素磺酸钠	4.0%
硅铝酸钠	6.0%
蒙脱土（经煅烧）	23.0%

实施例 B颗粒剂

化合物 7	10.0%
硅镁土颗粒（低挥发性物质，0.71/0.30mm； U. S. S. No. 25-50 筛）	90.0%

实施例 C5 挤压成形的丸剂

化合物 1	25.0%
无水硫酸钠	10.0%
粗木质素磺酸钙	5.0%
烷基萘磺酸钠	1.0%
钙/镁膨润土	59.0%

实施例 D可乳化的浓缩液

化合物 7	20.0%
油溶性磺酸盐和聚氧乙烯醚 的掺合物	10.0%
异佛尔酮	70.0%

实施例 E颗粒剂

化合物 1	0.5%
纤维素	2.5%
乳糖	4.0%
玉米粉	93.0%

- 10 本发明化合物的特征在于有利的代谢和/或土壤基型式，且显示对一定范围的农业和非农业无脊椎害虫的防治活性。（在本发明的说明书范

围内,“无脊椎害虫防治”意味着抑制无脊椎害虫的生长(包括致死),显著减少其摄食量或害虫引起的其它伤害;相关的表述定义类似)。就本说明书而言,术语“无脊椎害虫”包括具有经济重要性的节肢类、腹足类、线虫类害虫。术语“节肢类”包括昆虫、螨、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、百足虫、球潮虫和总和纲(symphylans)。术语“腹足类”包括蜗牛、蛞蝓(slugs)和其它柄眼目(Stylommatophora)。术语“线虫类”包括所有的蠕虫,如:蛔虫,犬心虫,植食性线虫类(线虫纲),吸虫(Tematoda),棘头虫纲,以及绦虫(多节绦虫纲)。本领域的技术人员应认识到,并非所有的化合物对于所有的害虫具有相同的效力。本发明的化合物显示了对经济上具重要性的农业、林业、温室、苗圃、观赏性植物、食品和纤维、公共健康和动物健康、家用和商用建筑、家用品和贮存品等方面的害虫的活性。这些包括鳞翅目的幼虫,如夜蛾科族的粟蚕蛾幼虫(armyworms),切根虫(cutworms),尺蠖(loopers),以及heliothines(例如:秋粟蚕蛾幼虫(*Spodoptera fugiperda* J.E. Smith),甜菜粟蚕蛾幼虫(*Spodoptera exigua*. Hübner),黑切根虫(*Agrotis ipsilon* Hufnagel),卷心菜尺蠖(粉斑夜蛾,*Trichoplusia ni* Hübner),烟草蚜虫(*Heliothis virescens* Fabricius));螟蛾科族的蛀虫,鞘蛾,结网毛虫,锥形虫(coneworms),卷叶菜虫和骨化虫(skeletonizers)(例如:欧洲玉米钻孔虫(*Ostrinia nubilalis* Hübner),脐橙虫(*Amyelois transitella* Walker),玉米根结网毛虫(*Crambus caliginosellus* Clemens),草地结网毛虫(*Herpetogramma licarsisllis* Walker));卷蛾科族的叶滚虫(leafrollers),蚜虫,种子虫(seed worms),以及果虫(fruit worms)(例如:苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus),葡糖浆果蠹蛾(*Endopiza viteana* Clemens),东方果蠹蛾(*Grapholita molesta* Busck));以及许多其它经济上重要的鳞翅目(例如菱纹背蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus),红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders),舞毒蛾(*Lymantria dispar* Linnaeus));Blattodea目的稚虫和成虫,包括Blattellidae和蜚蠊科族的蟑螂(例如东方蟑螂(*Blatta orientalis* Linnaeus),亚洲蟑螂(*Blattella asahinai* Mizukubo),德国蟑螂(*Blattella germanica* Linnaeus),褐带蟑螂(*Supella longipalpa* Fabricius),美洲蟑螂(*Periplaneta americana* Linnaeus),褐色

蟑螂 (*Periplaneta brunnea* Burmeister), 马得拉岛蟑螂 (*Leucophaea maderae* Fabricius); 鞘翅目的摄叶幼虫和成虫, 包括长角象虫科、豆象科和象虫科族的象鼻虫 (例如棉籽象鼻虫 (*Anthonomus grandis* Boheman), 米水象鼻虫 (rice water weevil, *Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), 谷象鼻虫 (*Sitophilus granarius* Linnaeus), 米象鼻虫 (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); 叶甲科族的跳甲、黄瓜甲虫、根虫、叶甲、马铃薯甲虫和甜菜麦蛾 (例如科罗拉多马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata* Say), 西方玉米根虫 (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); 金龟子科族的金龟子和其它甲虫 (例如日本甲虫 (*Popillia japonica* Newman) 和欧洲金龟子 (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); 皮蠹科族的地毯圆皮蠹; 叩头虫科的铁线虫 (wireworms); Scolytidae 族的棘胫小蠹 (bark beetles) 和拟步行虫科的粉甲虫。另外包括: 革翅目的成虫和幼虫, 包括秋螽科的地蜈蚣 (例如欧洲地蜈蚣 (*Forficula auricularia* Linnaeus), 黑地蜈蚣 (*Chelisoche morio* Fabricius)); 半翅目和同翅目的成虫和稚虫, 如盲蝽科族的盲蝽, Cicadidae 族的蝉, 大叶蝉科族的叶蝉 (例如 *Empoasca* spp.), 樗鸡科族和飞虱科族的 planthopper, 角蝉科族的角蝉, 木虱科族的木虱, 粉虱科族的粉虱, 蚜科族的蚜虫, 根瘤蚜科族的根瘤蚜, 粉蚧科族的粉蚧, 蜡蚧科族、盾蚧科族和硕蚧科族的介壳虫 (scales), 网蝽科族的网蝽, 椿象科族的椿象, 长椿科族的麦长椿 (例如 *Blissus* spp.) 和其它 seed bugs, 沫蝉科族的沫蝉, 缘蝽科族的南瓜缘蝽, 以及红椿科族的恙螨 (red bugs) 和棉椿象。还包括螨目的成虫和稚虫, 如叶螨科族的红蜘蛛和茶红叶螨 (例如欧洲茶红叶螨 (*Panonychus ulmi* Koch), 两点红蜘蛛 (two spotted spider mite, *Tetranychus urticae* Koch), McDaniel 螨 (*Tetranychus mcdaniele* McGregor)), 毛足蛛科族的 flat mite (例如柑橘 flat mite (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), 瘿螨科族的锈螨和芽螨 (bud mites), 以及其它摄叶螨和对人和动物健康重要的螨, 即 Epidermoptidae 族的尘螨 (dust mites), 蠕形螨科族的腺囊螨, 食甜螨科族的谷螨, 硬蜱科类的扁虱 (例如鹿虱 (deer tick, *Ixodes scapularis* Say), 澳洲瘫痪虱 (Australian paralysis tick, *Ixodes holocyclus* Neumann), 美洲犬虱 (*Dermacentor variabilis* Say),

孤星虱 (lone star tick, *Amblyomma americanum* Linnaeus)) , 以及瘿螨虱科族、蒲螨科族和疥螨科族的马瘿螨和疥螨; 直翅目的成虫和未成虫, 包括蚱蜢、蝗虫和蟋蟀 (例如迁徙蚱蜢 (例如 *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. Differentialis* Thomas), 美洲蚱蜢 (例如 *Schistocerca americana* Drury), 沙漠蝗虫 (*Schistocerca gregaria* Forskal), 迁徙蝗虫 (*Locusta migratoria* Linnaeus), 家蟋蟀 (*Acheta domesticus* Linnaeus), 蝼蛄 (*Gryllotalpa* Spp.)); 双翅目类的成虫和未成虫, 包括: 甜菜麦蛾, 蠓, 果蝇 (实蝇科), 麦秆蝇 (例如 *Oscinella frit* Linnaeus), 土壤蛆, 家蝇 (例如 *Musca domestica* Linnaeus), 小家蝇 (例如 *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), 厩螫蝇 (例如 *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), 面蝇 (face flies), 角蝇, 丽蝇 (blow flies, 例如 *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), 和其它蝇状蝇害虫 (muscoïd fly pests), 马蝇 (例如 *Tabanus* spp.), 肤蝇 (例如 *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), 牛蝇 (例如 *Hypoderma* spp.), 鹿蝇 (例如 *Chrysops* spp.), keds (例如 *Melophagus ovinus* Linnaeus), 以及其它短角亚目, 蚊 (例如 *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), 黑蝇 (例如 *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), 蠓, 沙蝇, sciarids, 和其它长角亚目; 缨翅目类的成虫和未成虫, 包括葱蓟马 (*Thrips tabaci* Lindeman) 和其它摄叶蓟马; 膜翅目类的昆虫类害虫, 包括: 蚁 (例如红工木蚁 (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), 黑工木蚁 (*Camponotus pennsylvanicus* DeGeer), 法老蚁 (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), 小火蚁 (*Wasmannia auropunctata* Roger), 火蚁 (*Solenopsis geminata* Fabricius), 红外来火蚁 (*Solenopsis invicta* Latreille), 阿根廷蚁 (*Iridomyrmex humilis* Mayr), 褐狂蚁 (*Paratrechina longicornis* Latreille), 铺道蚁 (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), 美洲草地蚁 (*Lasius alienus* Föster), 臭家蚁 (*Tapinoma sessile* Say)), 蜜蜂 (包括木蜂), 胡蜂, 鲜黄色胡蜂褐黄峰; 等翅目的昆虫害虫, 包括: 东美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes* Kollar), 西美散白蚁 (*Reticulitermes hesperus* Banks), 台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus* Shiraki), 移栖楹白蚁 (*Incisitermes immigrans* Snyder) 和其它经济上具重要性的白蚁; 缨尾目的昆虫害虫, 如蠹鱼 (*Lepisma saccharina* Linnaeus) 和家衣

鱼 (*Thermobia domestica* Packard); 食毛目的昆虫害虫, 并包括头虱 (*Pediculus humanus capitis* De Geer), 体虱 (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), 雏鸡羽虱 (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), 狗咬虱 (dog biting louse, *Trichodectes canis* De Geer), 绒毛虱 (fluff louse, *Goniocotes gallinae* De Geer), 羊体虱 (sheep body louse, *Bovicola ovis* Schrank), 阔胸血虱 (short-nosed cattle louse, *Haematopinus eurysternus* Nitzsch), 牛颞虱 (long-nosed cattle louse, *Linognathus vituli* Linnaeus) 和其它攻击人和动物的吮吸寄生虱 (sucking parasitic lice) 和咀嚼寄生虱 (chewing parasitic lice); 蚤目的昆虫害虫, 包括东方鼠蚤 (oriental rat flea, *Xenopsylla cheopis* Rothschild), 猫蚤 (*Ctenocephalides felis* Bouche), 犬蚤 (*Ctenocephalides canis* Curtis), 母鸡蚤 (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), 鬼针草蚤 (sticktight flea, *Echidnophaga gallinacea* Westwood), 人蚤 (*Pulex irritans* Linnaeus) 和其它折磨哺乳动物和鸟类的虱子。其它涵盖的节肢害虫包括: 蜘蛛目的蜘蛛, 如褐色隐居蜘蛛 (brown recluse spider, *Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) 和黑寡妇蛛 (*Latrodectus mactans* Fabricius), 以及 Scutigera 目的蜈蚣, 如家蜈蚣 (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。活性还包括线虫纲、多节绦虫纲、吸虫纲和棘头虫纲的成员, 包括经济上重要的 Strongylida 目、Ascaridida 目、蛲虫目 (Oxyurida)、Rhabditida 目、Spirurida 目和 Enoplida 目的成员, 如 (但不限于) 经济上重要的农业害虫 (例如 *Meloidogyne* 属的马氏异皮线虫, *Pratylenchus* 属的小线虫, *Trichodorus* 属的黄麻根瘤线虫等) 以及动物和人的健康害虫 (例如, 所有经济上重要的吸虫, 绦虫, 和蛔虫, 如马的 *Stongylus vulgaris*, 狗的 *Toxocara canis*, 羊的 *Haemonchus contortus*, 狗的 *Dirofilaria immitis* Leidy, 马的 *Anoplocephala perfoliata*, 反刍动物的 *Fasciola hepatica* Linnaeus, 等)。

本发明的化合物对下列各目的害虫具有特别高的活性: 鳞翅目 (例如 *Alabama argillacea* Hübner (棉叶波纹夜蛾), *Archips argyrospila* Walker (果黄卷蛾), *A. rosana* Linnaeus (European leaf roller) 和其它 *Archips* 种类, *Chilo suppressalis* Walker (二化螟), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (rice leafroller), *Crambus*

caliginosellus Clemens (玉米根网螟), *Crambus teterrellus* Zincken (早熟禾草螟), *Cydia pomonella* Fabricius (苹蠹蛾), *Earias insulana* Boisduval (棉斑实蛾), *Earias vittella* Fabricius (spotted bollworm), *Helicoverpa virescens* Hübner (American bollworm),
5 *Helicoverpa zea* Boddie (玉米穗蛾), *Heliothis virescens* Fabricius (烟芽夜蛾), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sod webworm), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (葡糖小卷蛾), *Pectinophora gossypiella* Saunders (pink bollworm), *Phyllocnistis citrella* Stainton (橘红潜叶甲), *Pieris brassicae* Linnaeus (大菜粉蝶),
10 *Pieris papae* Linnaeus (小菜粉蝶), *Plutella xylostella* Linnaeus (小菜蛾), *Spodoptera exigua* Hübner (甜菜夜蛾), *Spodoptera litura* Fabricius (斜纹夜蛾, cluster caterpillar), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (草地粘虫), *Trichoplusia ni* Hübner (粉纹夜蛾) 和 *Tuta absoluta* Meyrick (tomato leafminer)。本发明的化合物对同翅目
15 的成员也有商业上明显的活性, 包括: *Acyrtosiphon pisum* Harris (豌豆蚜), *Aphis craccivora* Koch (豇豆蚜), *Aphis fabae* Scopoli (黑豆蚜), *Aphis gossypii* Glover (棉蚜, 瓜蚜), *Aphis pomi* De Geer (苹蚜), *Aphis spiraecola* Patch (绣线菊蚜), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (指顶花无网蚜), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell
20 (草莓中瘤钉毛蚜), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (俄罗斯麦长管蚜), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (车前圆尾蚜), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (苹绵蚜), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (桃大尾蚜), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (芜菁蚜), *Metopolophium dirrhodum* Walker (谷蚜), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (马铃薯
25 长管蚜), *Myzus persicae* Sulzer (peach-potato aphid, 桃蚜), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (莴苣长管蚜), *Pemphigus* spp. (根蚜和葡糖根疣蚜), *Phopalosiphum maidis* Fitch (玉米蚜), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (bird cherry-oat aphid), *Schizaphis graminum* Rondani (麦二叉蚜), *Sitobion avenae* Fabricius (麦长
30 管蚜), *Therioaphis maculata* Buckton (苜蓿斑蚜), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (桔声蚜), 和 *Toxoptera citricida* Kirkaldy (热带桔二岔蚜); *Adelges* spp. (球蚜); *Phylloxera devastatrix*

Pergande (美核桃根瘤蚜); *Bemisia tabaci* Gennadius (烟草粉虱, 甘薯粉虱); *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (silverleaf whitefly), *Dialeurodes citri* Ashmead (柑桔粉虱) 和 *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (温室粉虱); *Empoasca fabae* Harris (蚕豆
 5 微叶蝉), *Laodelphax striatellus* Fallen (小褐稻虱), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (六点叶蝉), *Nephotettix cincticeps* Uhler (茶微叶蝉), *Nephotettix nigropictus* Stål (黑尾叶蝉), *Nilaparvata lugens* Stål (稻褐飞虱), *Peregrinus maidis* Ashmead (玉米蜡蝉), *Sogatella furcifera* Horvath (白背稻虱), *Sogatodes orizicola* Muir
 10 (rice delphacid), *Typhlocyba pomaria* McAtee (茛白小叶蝉), *Erythroneoura* spp. (葡糖斑叶蝉); *Magiciada septendecim* Linnaeus (期蝉); *Icerya purchasi* Maskell (吹绵蚧), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (梨圆盾蚧); *Planococcus citri* Risso (柑桔粉蚧); *Pesudococcus* spp. (其它粉蚧复合体); *Cacopsylla pyricola*
 15 Foerster (梨黄木虱), *Trioza diospyri* Ashmead (柿木虱)。这些化合物还对半翅目的成员具有活性, 包括: *Acrosternum hilare* Say (稻绿蝽), *Anasa tristis* De Geer (南瓜绿蝽), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (麦长蝽), *Corythuca gossypii* Fabricius (棉网蝽 (cotton lace bug)), *Cyrtopeltis modesta* Distant (tomato bug),
 20 *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (棉黑翅红蝽), *Euchistus servus* Say (褐臭蝽), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (一点褐蝽), *Graptosthetus* spp. (蚜虫复合体), *Leptoglossus corculus* Say (松籽喙缘蝽), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (牧草盲蝽), *Nezara viridula* Linnaeus (稻绿蝽), *Oebalus pugnax*
 25 Fabricius (稻褐蝽), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (大马利筋长蝽), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (棉跳盲蝽)。其它被本发明化合物防治的害虫目包括: 缨翅目 (例如 *Frankliniella occidentalis* Pergande (苜蓿蓟马), *Scirtothrips citri* Moulton (桔实蓟马), *Sericothrips variabilis* Beach (大豆蓟马), 和 *Thrips tabaci*
 30 Lindeman (葱蓟马)), 和鞘翅目 (例如 *Leptinotarsa decemlineata* Say (马铃薯甲虫), *Epilachna varivestis* Mulsant (墨西哥豆瓢虫), 以及 *Agriotes*、*Athous* 和 *Limonius* 种的铁线虫)。

本发明的化合物还可与一种或多种其它生物活性化合物或试剂混合，以形成多成分的杀虫剂，产生更广的农用范围，所述其它生物活性化合物或试剂包括：杀虫剂，杀真菌剂，杀线虫剂，杀菌剂，杀螨剂，生长调节剂（如扎根刺激剂（rooting stimulants）），化学灭菌剂，化学信息物（semiochemicals），驱虫剂，诱引剂，信息素，摄食刺激剂（feeding stimulants），其它生物活性化合物或昆虫病原细菌、病毒或真菌。因此，本发明的组合物可进一步包含生物有效量的至少一种附加生物活性化合物或试剂。本发明的化合物可与如下各例生物活性化合物或试剂进行配制：杀虫剂，如齐墩螨素（abamectin），高灭磷，吡虫清，齐墩螨素（avermectin），艾扎丁，谷硫磷，氟氯菊酯，联苯肼酯，噻嗪酮，虫螨威，氟唑虫清，定虫隆，毒死蜱，甲基毒死蜱，chromafenozide, clothianidin, 氯氟氰菊酯，β-氯氟氰菊酯，(RS) 氯氟氰菊酯，λ-氯氟氰菊酯，氯氟菊酯，灭蝇胺，溴氰菊酯，杀螨硫隆，二嗪农，氟脲杀，乐果，噁茂醚，emamectin, 硫丹，高氟戊菊酯，ethiprole, 苯硫威，双氧威，甲氰菊酯，唑螨酯，杀灭菊酯，锐劲特，flonicamid, 氟氟戊菊酯，氟胺氰菊酯，氟虫脲，地虫磷，特丁苯酰胺，氟铃脲，吡虫啉，噁二唑虫，丙胺磷，氟丙氧脲，马拉松，蜗牛敌，甲胺磷，杀扑磷，灭多虫，蒙五一五，甲氧滴滴涕，久效磷，甲氧苯酰胺，硝虫噻嗪，双苯氟脲，甲氧叉威，一六零五，甲基一六零五，氯菊酯，三九一一，伏杀磷，亚胺硫磷，磷胺，抗蚜威，丙溴磷，拒嗪酮，pyridalyl, 蚊蝇醚，鱼藤酮，艾克敌 105, 乙丙硫磷，双苯酰胺，伏虫隆，七氟菊酯，特丁磷，杀虫畏，thiacloprid, thiamethoxam, 硫双灭多威，杀虫双，四溴菊酯，敌百虫，和杀虫隆；杀真菌剂，如噻二唑素，腈嘧菊酯，苯菌灵，灭瘟素，波尔多液（碱式硫酸铜），糠菌唑，氯环丙酰胺，captafol, 克菌丹，多菌灵，地茂散，百菌清，王铜，铜盐，cyflufenamid, 清菌脲，环唑醇，环丙嘧啶，(S)-3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧丙基)-4-甲基苯甲酰胺（RH 7281），diclocymet（S-2900），啞菌清，氯硝胺，噁茂唑，(S)-3,5-二氢-5-甲基-2-甲基硫代-5-苯基-3-苯氨基-4H-咪唑-4-酮（RP 407213），烯酰吗啉，dimoxystrobin, 烯唑醇，烯唑醇-M，多果定，克瘟散，氧唑菌，噁唑铜菌，fenamidone, 异嘧菌醇，腈苯唑，fencaramide（SZX0722），拌种咯，苯锈啶，丁苯吗啉，薯瘟锡，毒菌锡，氟啶胺，氟联苯菌（RPA 403397），喹唑菌酮，氟硅唑，氟酰胺，粉唑醇，灭菌丹，藻菌磷，

呋氧丙灵, 呋吡唑灵 (S-82658), 己唑醇, 环戊唑醇, 异丙定, 富士一号, 春雷霉素, 亚胺菌, 代森锰锌, 代森锰, mefenoxam, 丙氧灭锈胺, 甲霜灵, 环戊唑菌, 又氧苯酰胺 (SSF-126), 腈菌唑, 甲肿铁铵 (甲基肿酸铁), 噁霜灵, 戊菌唑, 戊菌隆, 丙氧灵, 百维灵, 环丙唑, 啶斑肟, pyraclostrobin, 二甲噻菌胺, 咯嗉酮, 嗉氧灵, 螺噁茂胺, 硫磺粉, 戊唑醇, 氟醚唑, 涕必灵, 溴氟唑菌, 甲基托布津, 福美双, tiadinil, 三唑酮, 唑菌醇, 三环唑, trifloxystrobin, 戊叉唑菌, 有效霉素, 和烯菌酮; 杀线虫剂, 如涕灭威, 甲氧叉威, 和克线磷; 杀菌剂, 如链霉素; 杀螨剂, 如虫螨脒, 灭螨猛, 乙酯杀螨醇, 三环锡, 开乐散, 除螨灵, 特苯噁唑, 嗉螨醚, 杀螨锡, 甲氧菊酯, 唑螨酯, 噁螨酮, 克螨特, 啞螨酮, 和吡螨胺; 以及生物试剂, 如苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*), 包括 泽亚种 (*aizawai*) 和库尔斯塔克亚种 (*kurstaki*), 苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素 (delta endotoxin), 杆状病毒, 以及食虫细菌、病毒和真菌。

有关这些农用防护剂的通用参考文献是: 《The Pesticide Manual》(杀虫剂手册), 第十二版, C. D. S. Tomlin 出版, British Crop Protection Council (英国作物保护委员会), Farnham, Surrey, U. K., 2000。

用于与本发明的化合物混合的优选杀虫剂和杀蟑剂包括: 合成除虫菊酯类, 如氟氟菊酯, (RS) 氟氟氟菊酯, 氟氟氟菊酯, β -氟氟氟菊酯, 高氟戊菊酯, 杀灭菊酯和四溴菊酯; 氨基甲酸酯类, 如 fenothicarb, 灭多虫, 甲氧叉威, 和硫双灭多威; neonicotinoids, 如 clothianidin, 吡虫啉, 和 thiacloprid; 二乙基溴乙酰胺钠通道堵塞剂 (neuronal sodium channel blockers), 如噁二唑虫; 杀虫大环内酯类, 如艾克敌 105, 齐墩螨素 (abamectin), 齐墩螨素 (avermectin), 和 emamectin; γ -氨基丁酸 (GABA) 对抗剂 (antagonists), 如硫丹, ethiprole, 和锐劲特; 杀虫剂尿素, 如氟虫脲和杀虫隆; 保幼激素, 如噁茂醚和蚊蝇醚; 拒嗉酮; 以及虫螨脒。用于与本发明的化合物混合的优选生物试剂包括苏云金芽孢杆菌和苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素, 以及天然存在的和遗传改良的病毒杀虫剂, 包括杆状病毒目 (baculoviridae) 的成员以及食昆虫的真菌。

最优选的混合物包括: 本发明的化合物与 (RS) 氟氟氟菊酯的混合物; 本发明的化合物与氟氟氟菊酯的混合物; 本发明的化合物与 β -氟氟氟菊酯的混合物; 本发明的化合物与高氟戊菊酯的混合物; 本发明的化合物与灭多虫的混合物; 本发明的化合物与吡虫啉的混合物; 本发明

的化合物与 thiacloprid 的混合物；本发明的化合物与噁二唑虫的混合物；本发明的化合物与齐墩螨素 (abamectin) 的混合物；本发明的化合物与硫丹的混合物；本发明的化合物与 ethiprole 的混合物；本发明的化合物与锐劲特的混合物；本发明的化合物与氟虫脲的混合物；本发
5 明的化合物与蚊蝇醚的混合物；本发明的化合物与拒嗪酮的混合物；本发
明的化合物与虫螨脒的混合物；本发明的化合物与苏云金芽孢杆菌的
混合物；以及本发明的化合物与苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素的混合物。

在某些情况下，与具有相似防治范围但不同作用方式的其它无脊椎害虫防治化合物或试剂的结合对于抗力控制 (resistance management)
10 是特别有利的。因此，本发明的组合物可进一步包含生物有效量的至少
一种附加的具有相似防治范围但不同作用方式的无脊椎害虫防治化合
物或试剂。使遗传改良以表达植物防护化合物 (例如蛋白质) 的植物或
该植物的处所与生物有效量的本发明化合物相接触，也可提供更广的植物
防护范围，并对于抗力控制是特别有利的。

15 通过向害虫的环境 (包括害虫出现的农业和/或非农业处所)、向需
防护的区域、或直接向需要防治的害虫以生物有效量施用一种或多种本
发明的化合物，无脊椎害虫可被防治，并实现对农作物、园艺作物和特
殊作物、以及动物和人类健康的保护。因此，本发明进一步包括一种防
治叶居和土居无脊椎害虫及保护农业和/或非农业作物的方法，包括使
20 无脊椎害虫或其环境与生物有效量的一种或多种本发明的化合物接
触，或与含至少一种所述化合物的组合物或含至少一种所述化合物和至
少一种附加生物活性化合物或试剂的组合物接触。优选的接触方法是通
过喷洒。或者，可向植物叶或土壤施用含本发明化合物的颗粒状组合
物。通过由植物与含本发明化合物的组合物接触而引起的植物吸收，本
25 发明的化合物得以有效释放，所述组合物是作为液体配制剂的土壤浸
润、用于土壤的颗粒制剂、保育箱处理或移植浸渍而施用的。其它接触
方法包括通过直接或滞留性喷雾、航空喷洒、种皮、微胶囊、系统吸收、
饵诱、耳标 (ear tags)、大丸药、喷雾器、熏蒸剂、气溶胶、粉尘和
许多其它方法而施用本发明的化合物或组合物。

30 可将本发明的组合物掺入无脊椎害虫食用的诱饵，或掺入装置如捕集器
等中。颗粒或诱饵含有 0.01 - 5% 的活性成分、0.05 - 10% 的含试剂 (一种
或多种) 的水份以及 40 - 99% 的植物粉，能以很低的施用率有效地防治土壤

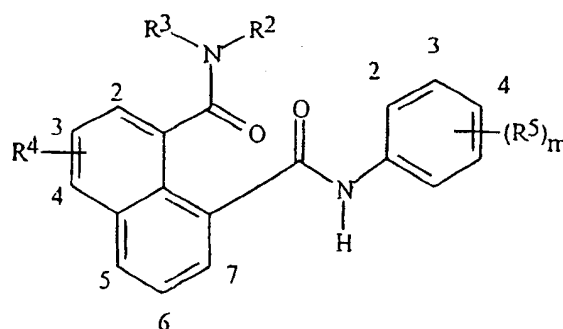
害虫，特别是对于通过摄食而非直接接触而致命的活性成分剂量而言。

本发明的化合物可以以其纯净态施用，但更为经常施用的是一种配制剂，其含有合适的载体、稀释剂和表面活性剂，且根据所考虑的终用途可能与食物结合。优选的施用方法涉及所述化合物的水分散体或精制油溶液。与喷淋油、喷淋油浓缩物、粘展剂、辅料、其它溶剂以及增效剂如增效醚结合通常增强化合物的效力。

有效防治所需的施用率（即“生物有效量”）将取决于诸如下列因素：需防治的无脊椎害虫的种类，害虫的生活周期，生活期，害虫的大小，季节，宿主作物或动物，摄食习性，周围环境湿度，稳定，等。在一般情况下，每公顷约 0.01 - 2kg 活性成分的施用率足以防治农业生态系统中的害虫，但少至 0.0001 千克/公顷可以足够，而也可以需要多达 8 千克/公顷。对于非农用，有效用量范围约为 1.0 - 50mg/m²，但少至 0.1mg/m² 可以足够，而也可以需要多达 150mg/m²。本领域的技术人员可容易地确定所期望程度的无脊椎害虫防治所必需的生物有效量。

下列本发明的生物实施例中的试验说明了本发明化合物对于特定害虫的防治效力。“防治效力”表示阻止引起大量降低供给的节肢动物的发育。然而，所述化合物提供的害虫防治保护作用并不局限于这些种类。对于化合物的描述，参见索引表 A-E。在下列索引表中使用了以下缩写：*t* 为叔，*n* 为正，*i* 为异，*s* 为仲，Me 为甲基，Et 为乙基，Pr 为丙基，Br 为丁基；相应地，*i*-Pr 为异丙基，*s*-Bu 为仲丁基，等等，Ac 为 COCH₃。缩写“Ex.”代表“实施例”，其后的数字表明所述化合物是在那个实施例中制备的。

索引表 A



化合物	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	熔点 °C
1 (Ex. 1)	Me	H	H	2	2-Me-4-F	249
2	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	>250
3	<i>n</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	212

4	<i>i</i> -Bu	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
5	Me	Me	H	2	2-Me-4-Cl	***
6	Et	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
7	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	244
8	allyl	H	H	2	2,4-di-Me	243
9	环-Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	246
10	H	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
11	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	>250
12	Me	H	H	1	4-OCF ₃	>250
13	Me	H	H	2	2,4-di-Cl	>250
14	Me	H	H	2	2-Me-5-Cl	241
15	Me	H	H	2	2-Me-3-Cl	>250
16	Me	H	H	1	2-Me	236
17	Me	H	H	2	2-Me-4-Br	234
18	Me	H	H	1	4- <i>i</i> -Pr	>250
19	Me	H	H	1	4-NHAc	224
20	Me	H	H	1	2-Br	210
21	Me	H	H	1	2-OPh	193
22	Me	H	H	1	4-OMe	188
23	Me	H	H	1	4-(吗啉-4-基)	246
24	Me	H	H	1	2-F	177
25	Me	H	H	1	4-I	235
26	Me	H	H	2	2-Me-4-NO ₂	242
27	Me	H	H	1	3-CF ₃	235
28	Me	H	H	1	3-I	216
29	Me	H	H	2	2-Me-4-OMe	205
30	Me	H	H	1	3-Br	230
31	Me	H	H	1	4-Ac	226
32	Me	H	H	1	4-Br	220
33	Me	H	H	1	4-CN	216
34	Me	H	H	1	3-NO ₂	242
35	Me	H	H	1	4-Cl	197
36	Me	H	H	1	3-CH ₃	220
37	Me	H	H	1	3-Cl	209
38	Me	H	H	2	2,5-di-Me	204
39	Me	H	H	2	2-Me-6-OMe	223
40	Me	H	H	2	2,3-di-Me	187
41	Me	H	H	1	2-OMe	192

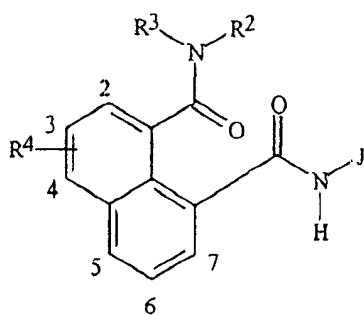
42	Me	H	H	1	4-CO ₂ Et	202
43	Me	H	H	1	4-NMeAc	210
44	Me	H	H	2	2,6-di-Me	>250
45	Me	H	H	1	2-(吡咯-1-基)	208
46	Me	H	H	1	4-NO ₂	224
47	Me	H	H	1	3-OCH ₂ Ph	214
48	Me	H	H	2	2,4-di-Me	213
49	Me	H	H	1	3-CN	200
50	Me	H	H	1	3-OCF ₃	>250
51	Me	H	H	2	2-Me-3-NO ₂	233
52	Me	H	H	1	2-OEt	224
53	Me	H	H	1	4-(4-ClPhO)	224
54	Me	H	H	1	4-CH ₃	248
55	Me	H	H	1	4-O- <i>i</i> -Pr	183
56	Me	H	H	1	4-F	247
57	Me	H	H	1	2-SMe	204
58	Me	H	H	1	2- <i>t</i> -Bu	248
59	Me	H	H	1	3-SMe	218
60	Me	H	H	1	4-OEt	195
61	Me	H	H	1	2-CH ₂ CN	191
62	Me	H	H	1	2-Et	200
63	<i>i</i> -Pr	H	4-NO ₂ / 5-NO ₂	2	2-Me-4-Cl	***
			(1/1 混合)			
64	Me	H	4-Br/ 5-Br	2	2-Me-4-Cl	***
			(1/1 混合)			
65	Me	H	H	1	2-CONH(<i>i</i> -Pr)-6-Me	248
66*	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
67*	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	***
68	Me	H	H	2	2-Me-5-NO ₂	242
69	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	250
70	Me	H	H	1	4-CF ₃	246
71	Me	H	H	1	2-Ph	163
72	Me	H	H	2	2-(1-Me-四唑-5-基)-6-Me	202
73	Me	H	H	1	2-CONHMe	235
74	Me	H	H	2	2-Me-6-Cl	231
75	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-Me	223

76	Me	H	H	3	2-F-4-Cl-5-NO ₂	250
77	Me	H	H	2	2-Br-4-Me	198
78	Me	H	H	3	2-Br-4,6-di-F	197
79	Me	H	H	2	2,5-di-NO ₂	223
80	Me	H	H	2	2-F-4-Cl	250
81	Me	H	H	2	2-Me-3-F	242
82	Me	H	H	2	2-Br-4-F	126.5
83	Me	H	H	1	2-(吗啉-4-基)	193
84	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-F	248
85	Me	H	H	2	3,4-di-F	110
86	Me	H	H	2	2-Cl-4-F	250
87	Me	H	H	1	2-CF ₃	217
88	Me	H	H	2	2-CN-4-Cl	250
89	Me	H	H	1	2-Ac	237
90	Me	H	H	1	2-OCF ₃	209
91	Me	H	H	1	2-SCF ₃	211
92	Me	H	H	2	2-CF ₃ -4-Br	250

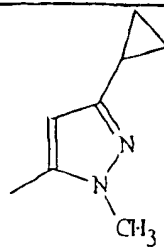
* 该试样含25重量%的1,8-萘二甲酸酐

*** 参见索引表E的NMR数据

索引表B

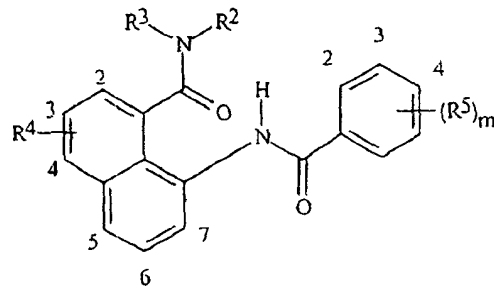


化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	熔点 °C
93	Me	H	H		199



化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	熔点 °C
94	Me	H	H		175
95	Me	H	H		126.5
96	Me	H	H		217
97	Me	H	H		171

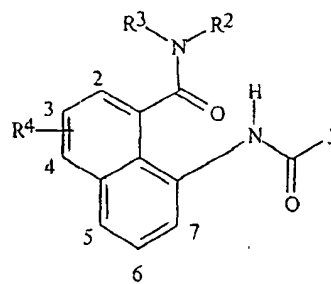
索引表C

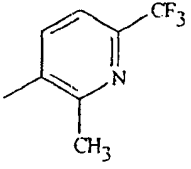
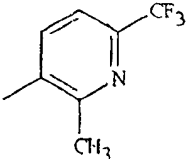


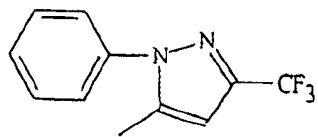
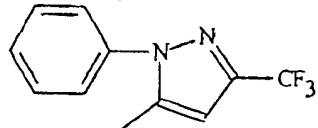
化合物	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	熔点 °C
98 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	H	H	2	3,4-di-F	227
99	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,3-di-Me	242
100	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,4-di-F	204
101	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-OCF ₃	186
102	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Cl	218
103	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Et	206

104	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-CF ₃	165
105	Me	H	H	2	3,4-di-F	250
106	Me	H	H	2	2,3-di-Me	184.5
107	Me	H	H	2	2,4-di-F	207
108	Me	H	H	1	4-Cl	250
109	Me	H	H	1	4-Et	250
110	Me	H	H	1	4-CF ₃	208
111	Me	H	H	1	4-OCF ₃	144
112	Me	H	H	1	2-Me	173.5
113	<i>i</i> -Pr	H	H	1	2-Me	176.5
114	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-O-CF ₃	173.5
115	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	194.5
116	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	173.5
117	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	204.5

索引表D



化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	熔点 °C
118	<i>i</i> -Pr	H	H	1-萘基	210
119	<i>i</i> -Pr	H	H	2-噻吩基	208
120 (Ex. 3)	Me	H	H	2-噻吩基	215
121	Me	H	H	1-萘基	214
121	<i>i</i> -Pr	H	H		210
123	Me	H	H		210

124	Me	H	H		215.5
125	i-Pr	H	H		186

索引表E

化合物号 ¹H NMR 数据 (为 CDCl₃ 溶液, 除非另作说明)^a

4	(DMSO-d ₆) δ: 0.9 (m, 6H), 2.37 (s, 3H), 3.01 (m, 1H), 3.96 (d, 2H), 7.27-8.48 (m, 10H), 9.84 (br s, 1H).
5	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 7.28-8.08 (m, 10H), 9.99 (s, 1H).
6	(DMSO-d ₆) δ: 1.07 (t, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.22 (m, 2H), 7.30-8.06 (m, 9H), 8.40 (t, 1H), 9.86 (s, 1H).
10	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 7.25-8.08 (m, 11H), 9.88 (s, 1H).
63	(DMSO-d ₆) δ: 1.09 (d, 6H), 2.36 (s, 3H), 4.03 (m, 1H), 7.27-8.52 (m, 9H), 10.04 (s, 1H).
64	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.69 (d, 3H), 7.33-8.84 (m, 8H), 8.45 (br q, 1H), 9.98 (s, 1H).
66	(DMSO-d ₆) δ: 2.37 (s, 3H), 2.71 (d, 3H), 7.27-8.10 (m, 9H), 8.34 (br q, 1H), 9.88 (s, 1H).
67	(DMSO-d ₆) δ: 2.41 (s, 3H), 2.72 (d, 3H), 7.26-8.08 (m, 9H), 8.36 (br q, 1H), 9.95 (s, 1H).

^a ¹H NMR 数据单位为 ppm, 四甲基硅烷低磁场。耦合标记为: (s) 为单
一态, (d) 为双重态, (t) 为三重态, (q) 为四重态, (m) 为多重
态, (dd) 为双重态的双重态, (dt) 为三重态的双重态, (br s) 为
5 宽单一态, (br q) 为宽四重态。

本发明的生物实施例

试验 A

为了评估对草地粘虫 (*Spodoptera frugiperda*) 的防治, 试验装置
由小开口容器组成, 其中装有已放置 4-5 天的玉米植物。已用 10-15
10 条 1 天龄的幼虫对该玉米预先进行了害虫感染, 幼虫是在一片害虫饵料
上, 用取样器从有许多幼虫在其上生长的硬化了的害虫饵料片上移取一
小块试样, 然后将该含幼虫和饵料的试样转移到试验装置中。作为饵料
试样而移到试验设备上的幼虫将变干。

除非另作说明, 用含下列物质的溶液配制试验化合物: 10% 的丙酮,
15 90% 的水和 300ppm 的 X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非离子型表面
活性剂, 该表面活性剂含有烷基芳基聚氧乙烯、游离脂肪酸、二醇和异
丙醇 (Loveland Industries, Inc.)。通过 SUJ2 雾化喷嘴施用 1ml 的
所述配制化合物液体, 该雾化喷嘴位于各试验装置上方 1.27cm (0.5 英

寸)处,带有 1/8 JJ 定制的箱体 (Spraying System Co.)。在这一屏蔽中的所有实验化合物均以 250ppm 喷洒,并重复喷洒 3 次。在喷洒所述配制的试验化合物后,使各试验装置干燥 1 小时,然后在顶部加盖黑色遮蔽盖。在 25℃、70% 相对湿度的成长室中将试验装置放置 6 天。然后目测植物摄食损坏度。

在所试验的化合物中,下列通过了极佳的植物防护程度(10%或更低的摄食损坏): 1、7、11、16、48、66 和 67。

试验 B

为了评估对烟草夜蛾幼虫 (*Heliothis virescens*) 的防治,试验装置由小开口容器组成,其中装有已放置 6-7 天的棉花植物。已用 8 条 2 天龄的幼虫对该棉花预先进行了害虫感染,幼虫是在一片害虫饵料上,使用了如试验 A 所述的取样器。

试验化合物的配制和以 250ppm 进行喷洒均如试验 A 所述。重复喷洒 3 次。喷洒后,将试验装置放置在成长室中,然后如试验 A 所述进行目测评定。

在所试验的化合物中,下列通过了极佳的植物防护程度(10%或更低的摄食损坏): 1、7 和 16。

试验 C

为了评估对菱纹背蛾 (*Plutella xylostella*) 的防治,试验装置由小开口容器组成,其中装有已放置 12-14 天的萝卜植物。已用 10-15 条新生幼虫对该萝卜预先进行了害虫感染,幼虫是在一片害虫饵料上,使用了如试验 A 所述的取样器。

试验化合物的配制和以 250ppm 进行喷洒均如试验 A 所述。重复喷洒 3 次。喷洒后,将试验装置放置在成长室中,然后如试验 A 所述进行目测评定。

在所试验的化合物中,下列通过了极佳的植物防护程度(10%或更低的摄食损坏): 1、7、11、12、14、16、20、24、37、48、51、54、55、56、61、66、67、69、70、72、75、81、85、86、89、90、91、93 和 97。

试验 D

为了评估对甜菜黏虫 (*Spodoptera exigua*) 的防治,试验装置由小开口容器组成,其中装有已放置 4-5 天的玉米植物。已用 10-15 条 1

天龄的幼虫对该玉米预先进行了害虫感染，幼虫是在一片害虫饵料上，使用了如试验 A 所述的取样器。

5 试验化合物的配制和以 250ppm 进行喷洒均如试验 A 所述。重复喷洒 3 次。喷洒后，将试验装置放置在成长室中，然后如试验 A 所述进行目测评定。

在所试验的化合物中，下列通过了极佳的植物防护程度（10% 或更低的摄食损坏）：1、40 和 54。