



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102548973 A

(43) 申请公布日 2012. 07. 04

(21) 申请号 201080044648. 9	(51) Int. Cl.
(22) 申请日 2010. 08. 03	<i>C07D 239/54</i> (2006. 01)
(30) 优先权数据	<i>C07D 401/06</i> (2006. 01)
61/231, 464 2009. 08. 05 US	<i>C07D 417/06</i> (2006. 01)
(85) PCT申请进入国家阶段日	<i>C07D 471/04</i> (2006. 01)
2012. 04. 05	<i>C07D 487/04</i> (2006. 01)
(86) PCT申请的申请数据	<i>C07D 498/04</i> (2006. 01)
PCT/US2010/044274 2010. 08. 03	<i>C07D 513/04</i> (2006. 01)
(87) PCT申请的公布数据	<i>A01N 43/54</i> (2006. 01)
W02011/017342 EN 2011. 02. 10	<i>A01N 43/56</i> (2006. 01)
(71) 申请人 杜邦公司	<i>A01N 43/647</i> (2006. 01)
地址 美国特拉华	<i>A01N 43/78</i> (2006. 01)
(72) 发明人 张文明 C·W·小霍利奥克	
K·A·休斯 G·P·拉姆	
T·F·小帕胡茨基 M-H·T·东	
徐鸣	
(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司	
72002	
代理人 张晓威	

权利要求书 12 页 说明书 252 页

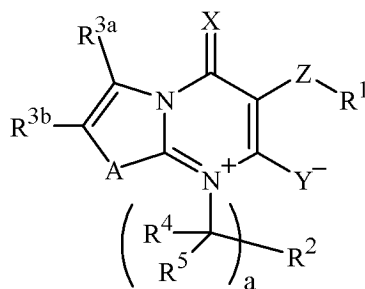
(54) 发明名称  
介离子杀虫剂

(57) 摘要

本发明公开了式 1 的化合物、其 N- 氧化物及其盐,其中 ( 式 1)X 为 O 或 S ;Y 为 O 或 S ;A 为 O、S、NR<sup>3e</sup>或 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>) ;Z 为直接键、O、S(O)<sub>n</sub>、191、NR<sup>6</sup>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C( = X<sup>1</sup>)、C( = X<sup>1</sup>)E、EC( = X<sup>1</sup>)、C( = NOR<sup>8</sup>) 或 C( = NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>) ;a 为 1、2 或 3 ;并且 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3a</sup>-R<sup>3e</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、X<sup>1</sup>和 E 如在本公开中所定义。本发明还公开了包含式 1 的化合物的组合物和用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的本发明的化合物或组合物接触。

CN 102548973 A

1. 式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐,



1

其中

X 为 O 或 S ;

Y 为 O 或 S ;

A 为 O、S、NR<sup>3e</sup> 或 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>), 前提条件是所述

C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>) 部分为取向的, 以便键合到 R<sup>3d</sup> 上的碳原子直接连接到式 1 的嘧啶环上 ;

Z 为直接键、O、S(O)<sub>n</sub>、NR<sup>6</sup>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、

C(=X<sup>1</sup>)E、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>) 或 C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>) ;

X<sup>1</sup> 为 O、S 或 NR<sup>9</sup> ;

E 为 O、S 或 NR<sup>9a</sup> ;

R<sup>1</sup> 为 H、卤素、氰基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub> 或 C(=S)NH<sub>2</sub> ; 或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub> 和 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup> ; 或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系, 每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N, 其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S), 并且所述硫原子环成员独立地选自 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>2</sub>, 每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代, 所述取代基独立地选自 R<sup>14</sup> ; 前提条件是当 R<sup>1</sup> 为卤素时, 则 Z 为直接键、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>) 或 C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>) ;

R<sup>2</sup> 为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup> 或 Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>) ; 或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯

基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ ;

$R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $SF_5$ 、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;或  $R^{3a}$  和  $R^{3b}$ 、或  $R^{3b}$  和  $R^{3c}$ 、或  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环,每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ,每个环任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基;

$R^{3e}$  为 H、羟基、氨基、 $CHO$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{18}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;或  $R^{3e}$  和  $R^{3b}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环,每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,

并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ , 每个环任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基;

每个  $R^4$  和  $R^5$  独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$  或  $SO_2NH_2$ ; 或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{12}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_8$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_3-C_6$  环烷氧基、 $C_4-C_8$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_6$  烯氧基或  $C_2-C_6$  炔氧基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ; 或

$R^4$  和  $R^5$  与它们连接的碳原子合在一起形成 3 元至 7 元环, 所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N, 其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员选自 S、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ , 所述环任选地被至多 4 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基和  $C_1-C_4$  烷基;

每个  $R^6$  独立地为 H; 或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ; 或

两个  $R^6$  取代基与它们连接的氮原子合在一起形成 3 元至 7 元环, 所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N, 其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员选自 S、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ , 所述环任选地被至多 4 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基和  $C_1-C_4$  烷基;

每个  $R^7$  和  $R^8$  独立地为 H; 或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;

每个  $R^9$  独立地为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;

每个  $R^{9a}$  独立地为 H; 或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$



烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>;

每个 R<sup>10</sup> 和 R<sup>11</sup> 独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基和 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基;或苯基或 5 元或 6 元杂芳环,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基和 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基;

每个 R<sup>12</sup> 和 R<sup>13</sup> 独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基和 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基;或

R<sup>12</sup> 和 R<sup>13</sup> 与它们连接的氮原子合在一起形成 3 元至 7 元环,所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S),并且所述硫原子环成员选自 S、S(O) 或 S(O)<sub>2</sub>,所述环任选地被至多 4 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基;

每个 R<sup>14</sup> 独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、SF<sub>5</sub>、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=

O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>)、C(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NOR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NNR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>)R<sup>23</sup>、C(=NN(C(=O)R<sup>19</sup>)R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NN(C(=O)OR<sup>19</sup>)R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、ON=CR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、ONR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>C(=O)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、P(=X<sup>2</sup>)R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)(OR<sup>18</sup>)R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)(OR<sup>18</sup>)OR<sup>19</sup>、N=CR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>N=CR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>C(=X<sup>2</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>C(=NR<sup>21</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>21</sup>C(=X<sup>2</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup> 或 Z<sup>1</sup>Q<sup>i</sup>Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup> ;或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基亚磺酰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup> ;或

在相邻环原子上的两个 R<sup>14</sup> 取代基与相邻环原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环,每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自 S(=O)<sub>n</sub>,每个环任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> 环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> 卤代环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 卤代烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 卤代环烷基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基和 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基羰基 ;

每个 X<sup>2</sup> 独立地为 O 或 S ;

每个 Z<sup>1</sup> 独立地为直接键、O、S(O)<sub>n</sub>、NR<sup>6</sup>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(R<sup>7</sup>)=C(R<sup>7</sup>)、C≡C、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、C(=X<sup>1</sup>)E、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>) 或 C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>) ;

每个 Q<sup>i</sup> 独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub>,每个环或环系任选地被至多 4 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub> 和 R<sup>16</sup> ;

每个 Q<sup>t</sup> 独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub>,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub> 和 R<sup>16</sup> ;

每个  $R^{15}$  独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $SF_5$ 、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}NR^{22}R^{23}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $S(=O)(=NR^{21})R^{22}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ；或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；或

在相邻环原子上的两个  $R^{15}$  取代基与相邻环原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基；

每个  $R^{16}$  独立地为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷硫基、 $C_1-C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  烷氨基、 $C_2-C_8$  二烷基氨基、 $C_3-C_6$  环烷基氨基、 $C_2-C_4$  烷氧基烷基、 $C_2-C_4$  烷基羰基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰氧基、 $C_2-C_6$  烷基羰硫基、 $C_2-C_6$  烷氨基羰基、 $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基和  $C_3-C_6$  三烷基甲硅烷基；或苯基或 5 元或 6 元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷硫基、 $C_1-C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  烷氨基、 $C_2-C_8$  二烷基氨基、 $C_3-C_6$  环烷基氨基、 $C_2-C_4$  烷氧基烷基、 $C_2-C_4$  烷基羰基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰氧基、 $C_2-C_6$  烷基羰硫基、 $C_2-C_6$  烷氨基羰基、 $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基和  $C_3-C_6$  三烷基甲硅烷基；

每个  $R^{17}$  独立地为卤素、氰基、硝基、 $OH$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  或  $Z^1Q^t$ ；

每个  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  和  $R^{20}$  独立地为  $Q^t$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$

烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup>；

每个 R<sup>21</sup> 独立地为 Q<sup>t</sup> 或 H；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup>；

每个 R<sup>22</sup> 和 R<sup>23</sup> 独立地为 Q<sup>t</sup> 或 H；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup>；或

R<sup>22</sup> 和 R<sup>23</sup> 与它们连接的氮原子合在一起形成 3 元至 7 元环，所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S)，并且所述硫原子环成员选自 S、S(O) 或 S(O)<sub>2</sub>，所述环任选地被至多 4 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基；

每个 R<sup>24</sup> 独立地为 H、氰基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>) 或 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基亚磺酰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup>；

a 为 1、2 或 3；

每个 n 独立地为 0、1 或 2；并且

在每个 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub> 的实例中，u 和 z 独立地为 0、1 或 2，前提条件是在每个 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub> 的实例中，u 和 z 之和为 0、1 或 2；

前提条件是当 A 为 O、S、NCH<sub>3</sub> 或 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>)，R<sup>3c</sup> 为 H 或 F 且 R<sup>3d</sup> 为 H、F、CF<sub>2</sub>H 或 CF<sub>3</sub> 时，则 R<sup>3a</sup> 或 R<sup>3b</sup> 中的至少一个不是 H。

2. 权利要求 1 的化合物，其中

X 为 0；

Y 为 0；

Z 为直接键、C(=X<sup>1</sup>) 或 C(=X<sup>1</sup>)E；

X<sup>1</sup> 为 0；

E 为 0；

A 为 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>) 或 NR<sup>3e</sup>；

R<sup>1</sup> 为任选地被卤素取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基；或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多

2 个 S 和至多 4 个 N, 其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ , 每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代, 所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;

$R^2$  为  $C(=O)OR^{18}$ ; 或任选地被卤素取代的  $C_1-C_8$  烷基; 或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系, 每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N, 其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ , 每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代, 所述取代基独立地选自  $R^{15}$ ;

$R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{3c}$  独立地为 H 或卤素;

$R^{3d}$  为卤素、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_1-C_8$  卤代烷基或  $C_1-C_8$  卤代烷氧基; 或

$R^{3c}$  和  $R^{3d}$  合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环, 每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N, 其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ , 每个环任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基;

$R^{3e}$  为  $C_1-C_4$  烷基;

$R^4$  和  $R^5$  为 H; 并且

a 为 1。

3. 权利要求 2 的化合物, 其中

$R^1$  为苯基或 5 元或 6 元杂芳环, 各自任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;

$R^{14}$  为卤素、氰基、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=NOR^{21})R^{22}$  或  $Z^1Q^t$ ; 或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基或  $C_1-C_8$  烷硫基, 各自任选地被卤素取代;

$R^{21}$  为  $C_1-C_4$  烷基;

$R^{22}$  为  $C_1-C_4$  烷基;

Z 为直接键;

每个  $Z^1$  独立地为直接键或 O; 并且

每个  $Q^t$  独立地为苯基或 5 元或 6 元杂芳环, 各自任选地被至多

5 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $C(=O)NR^{21}NR^{22}R^{23}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $S(=O)(=NR^{21})R^{22}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $R^{16}$ 。

4. 权利要求 3 的化合物, 其中

$R^2$  为吡啶基、嘧啶基、噁唑基或噻唑基, 各自任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素和  $C_1-C_4$  烷基。

5. 权利要求 4 的化合物, 其中

$R^1$  为苯基或吡啶基, 各自任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ; 并

且

每个  $Q^1$  独立地为苯基、吡啶基或嘧啶基,各自任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基和  $C_1-C_4$  卤代烷氧基。

6. 权利要求 5 的化合物,其中

A 为  $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$ ;

$R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;并且

$R^{3d}$  为卤素、 $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  烷氧基。

7. 权利要求 1 的化合物,所述化合物选自:

9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-溴-3-(3-溴苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-溴-3-[3-氯-2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-氯-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2,6-二氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-[(三氟甲基)硫代]苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,

2-a] 嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(4-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲氧基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲氧基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-[2-甲氧基-5-(三氟甲氧基)苯基]-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(2-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

3-[3-氯-2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[4-[(三氟甲基)硫代]苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2,4-二氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

3-(3-氯-2-氟苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

7-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-3-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-碘苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

3-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

3-[3-溴-5-(三氟甲氧基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-碘-5-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

3-(3-溴苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3'-(三氟甲氧基)[1,1'-联苯]-3-基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2',5'-二氟[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

3-[3-(6-氯-3-吡啶基)-5-(三氟甲氧基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2',4'-二氯[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐;

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-苯基-4H-嘧啶并[2,1-a]异喹啉鎓内盐;和

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(3-乙烯基苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐。

8. 组合物,所述组合物包含权利要求1的化合物和至少一种附加组分,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

9. 权利要求8的组合物,所述组合物还包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

10. 权利要求9的组合物,其中所述至少一种附加的生物学活性化合物或试剂选自:阿巴美丁、高灭磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印苦楝子素、甲基谷硫磷、杀虫磺、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、扑虱灵、硫线磷、西维因、克百威、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、定虫隆、氯吡硫磷、甲基氯吡硫磷、可芬诺、螨死净、可尼丁、氰虫酰胺、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 $\gamma$ -三氟氯氰菊酯、 $\lambda$ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 $\alpha$ -氯氰菊酯、 $\zeta$ -氯氰菊酯、赛灭净、溴氰菊酯、丁醚脒、敌匹硫磷、迪厄尔丁、除虫脒、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、呋虫胺、二苯丙醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、顺式氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨唑、苯丁锡、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、啉虫胺、氟虫脒、氟胺氰菊酯(fluvalinate/tau-fluvalinate)、大福松、伐虫脒、噻唑磷、氯虫酰胺、氟铃脒、噻螨酮、氟蚁脒、吡虫啉、茚虫威、杀虫皂、异柳磷、虱螨脒、马拉硫磷、氰氟虫脒、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、灭虫威、乙肟威、甲氧普烯、甲氧滴滴涕、甲氧卞氟菊酯、久效磷、甲氧虫酰胺、烯啶虫胺、硝乙脒噻唑、双苯氟脒、多氟虫酰胺、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、克螨特、拟除虫菊酯醚类杀虫剂、吡蚜酮、



吡嗪氟虫腈、除虫菊酯、哒螨酮、啶虫丙醚、新啶啉类杀虫剂、吡啶氟虫腈、蚊蝇醚、鱼藤酮、理阿诺碱、多菌虫素、多杀菌素、季酮螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、硫丙磷、氟啶虫胺腈、虫酰肼、吡螨胺、伏虫脲、七氟菊酯、特丁硫磷、杀虫畏、似虫菊、噻虫啉、噻虫嗪、硫双灭多威、杀虫双、啮虫酰胺、四溴菊酯、啮蚜威、敌百虫、杀虫脒、苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素、昆虫病原细菌、昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。

11. 用于保护动物免受无脊椎寄生害虫的侵害的组合物,所述组合物包含至少一种载体和杀寄生虫有效量的权利要求 1 的化合物。

12. 用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的权利要求 1 的化合物接触。

13. 经处理的种子,所述经处理的种子包含按处理前所述种子的重量计约 0.0001%至 1%的量的权利要求 1 的化合物。

## 介离子杀虫剂

## 发明领域

[0001] 本发明涉及适于农学、非农学和动物健康用途的某些嘧啶~~噻~~化合物、其 N-氧化物、其盐和它们的组合物,在农学和非农学环境中使用它们来防治诸如节肢动物无脊椎害虫的方法,以及在一般环境中使用它们来处理动物寄生虫感染或侵染的方法。

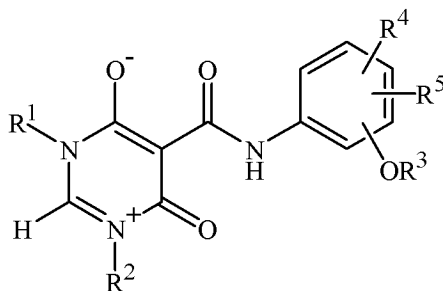
## [0002] 发明背景

[0003] 为获得高作物效率,防治无脊椎害虫是极为重要的。无脊椎害虫对农作物生长和储存的损害会导致产量显著降低,从而造成消费者成本上升。对于林业、温室作物、观赏植物、苗圃作物、贮藏食物和纤维产品、牲畜、居室、草皮、木制品以及公共卫生,防治无脊椎害虫也是重要的。为此目的,有许多产品可商购获得,但是持续需要更有效、更经济、毒性更小、对环境更安全或具有不同作用位点的新型化合物。

[0004] 在动物健康中,尤其是在食物产品和伴侣动物领域,防治动物寄生虫是非常必要的。由于对当前许多商业化驱虫剂日益增强的抗性,因此现有的处理方法和寄生虫防治方法效果并不理想。因此发现更有效防治动物寄生虫的方法是当务之急。

[0005] 美国专利公开 5,151,427 公开了作为驱肠虫剂的式 i 的介离子嘧啶~~噻~~化合物,

## [0006]



i

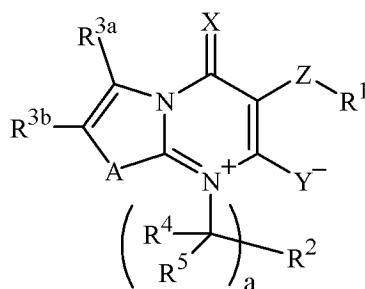
[0007] 其中特别是, R<sup>1</sup> 和 R<sup>2</sup> 独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基, R<sup>3</sup> 为 6 元杂芳环,并且 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为氢或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。

[0008] 本发明的嘧啶~~噻~~化合物未公开于此公布中。

## [0009] 发明概述

[0010] 本发明涉及式 1 的化合物(包括所有立体异构体)、其 N-氧化物及其盐和包含它们的组合物以及它们用于防治无脊椎害虫的用途:

## [0011]



1

[0012] 其中

[0013] X 为 O 或 S；

[0014] Y 为 O 或 S；

[0015] A 为 O、S、NR<sup>3e</sup> 或 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>)，前提条件是所述 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>) 部

[0016] 分为取向的，以便键合到 R<sup>3d</sup> 上的碳原子直接连接到式 1 的嘧啶鎓环上；

[0017] Z 为直接键、O、S(O)<sub>n</sub>、NR<sup>6</sup>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、

[0018] C(=X<sup>1</sup>)E、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>) 或 C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>)；

[0019] X<sup>1</sup> 为 O、S 或 NR<sup>9</sup>；

[0020] E 为 O、S 或 NR<sup>9a</sup>；

[0021] R<sup>1</sup> 为 H、卤素、氰基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub> 或 C(=S)NH<sub>2</sub>；或

[0022] C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)O、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub> 和 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S)，并且所述硫原子环成员独立地选自 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub>，每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自 R<sup>14</sup>；前提条件是当 R<sup>1</sup> 为卤素时，则 Z 为直接键、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>) 或 C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>)；

[0023] R<sup>2</sup> 为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup> 或 Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>)；或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基亚磺酰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、

$C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ；或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n(=NR^{24})_z$ ，每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自  $R^{15}$ ；

[0024]  $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $SF_5$ 、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ；或  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_3$ - $C_{10}$  环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6$ - $C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5$ - $C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_3$ - $C_8$  环烷氧基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2$ - $C_8$  烯氧基、 $C_2$ - $C_8$  炔氧基、 $C_1$ - $C_8$  烷硫基、 $C_1$ - $C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_8$  烷基磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷硫基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯硫基、 $C_2$ - $C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  炔硫基、 $C_2$ - $C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2$ - $C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；或  $R^{3a}$  和  $R^{3b}$ 、或  $R^{3b}$  和  $R^{3c}$ 、或  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、 $C_2$ - $C_4$  卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$  炔基、 $C_2$ - $C_4$  卤代炔基、 $C_3$ - $C_7$  环烷基、 $C_3$ - $C_7$  卤代环烷基、 $C_4$ - $C_8$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4$ - $C_8$  环烷基烷基、 $C_4$ - $C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_6$  卤代烷氧基、 $C_2$ - $C_6$  烷氧基羰基、 $C_2$ - $C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2$ - $C_6$  烷基羰基和  $C_2$ - $C_6$  卤代烷基羰基；

[0025]  $R^{3e}$  为 H、羟基、氨基、 $CHO$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ；或  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_3$ - $C_{10}$  环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6$ - $C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5$ - $C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_3$ - $C_8$  环烷氧基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2$ - $C_8$  烯氧基、 $C_2$ - $C_8$  炔氧基、 $C_1$ - $C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_8$  烷基磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2$ - $C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；或  $R^{3e}$  和  $R^{3b}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷基、

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> 环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> 卤代环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 卤代烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 卤代环烷基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基和 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基羰基；

[0026] 每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub> 或 SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯氧基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔氧基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0027] R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 与它们连接的碳原子合在一起形成 3 元至 7 元环，所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S)，并且所述硫原子环成员选自 S、S(O) 或 S(O)<sub>2</sub>，所述环任选地被至多 4 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基；

[0028] 每个 R<sup>6</sup> 独立地为 H；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0029] 两个 R<sup>6</sup> 取代基与它们连接的氮原子合在一起形成 3 元至 7 元环，所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自 C(=O) 和 C(=S)，并且所述硫原子环成员选自 S、S(O) 或 S(O)<sub>2</sub>，所述环任选地被至多 4 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基；

[0030] 每个 R<sup>7</sup> 和 R<sup>8</sup> 独立地为 H；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0031] 每个 R<sup>9</sup> 独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0032] 每个 R<sup>9a</sup> 独立地为 H；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独

立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>和Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0033] 每个R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>独立地为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；或苯基或5元或6元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；

[0034] 每个R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>独立地为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；或苯基或5元或6元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；或

[0035] R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>与它们连接的氮原子合在一起形成3元至7元环，所述环包含选自碳原子和至多2个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自一个O、一个S和至多2个N，其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S)，并且所述硫原子环成员选自S、S(O)或S(O)<sub>2</sub>，所述环任选地被至多4个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

[0036] 每个R<sup>14</sup>独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、SF<sub>5</sub>、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)

$\text{NR}^{21}\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{OR}^{18}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{OSO}_2\text{R}^{18}$ 、 $\text{OSO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{SO}_2\text{R}^{18}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{Si}(\text{R}^{18}\text{R}^{19}\text{R}^{20})$ 、 $\text{C}(=\text{NR}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}(=\text{NOR}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}(=\text{NNR}^{21}\text{R}^{22})\text{R}^{23}$ 、 $\text{C}(=\text{NN}(\text{C}(=\text{O})\text{R}^{19})\text{R}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}(=\text{NN}(\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{19})\text{R}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{ON}=\text{CR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{ONR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{S}(=\text{O})(=\text{NR}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{P}(=\text{X}^2)\text{R}^{18}\text{R}^{19}$ 、 $\text{OP}(=\text{X}^2)\text{R}^{18}\text{R}^{19}$ 、 $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{OR}^{18})\text{R}^{19}$ 、 $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{OR}^{18})\text{OR}^{19}$ 、 $\text{N}=\text{CR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{N}=\text{CR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{C}(=\text{X}^2)\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{C}(=\text{NR}^{21})\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{NR}^{21}\text{C}(=\text{X}^2)\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{NR}^{21}\text{SO}_2\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{Z}^1\text{Q}^t$  或  $\text{Z}^1\text{Q}^i\text{Z}^1\text{Q}^t$ ；或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_{10}$  环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基、 $\text{C}_6$ - $\text{C}_{14}$  环烷基环烷基、 $\text{C}_5$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烯基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷氧基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基磺酰基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷硫基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷基亚磺酰基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷基磺酰基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷硫基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯硫基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基亚磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔硫基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基亚磺酰基或  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $\text{R}^{17}$ ；或

**[0037]** 在相邻环原子上的两个  $\text{R}^{14}$  取代基与相邻环原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $\text{C}(=\text{O})$  和  $\text{C}(=\text{S})$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $\text{S}(=\text{O})_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤代烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  卤代烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  炔基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  卤代炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_7$  环烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_7$  卤代环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_8$  烷基环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_8$  卤代烷基环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_8$  环烷基烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_8$  卤代环烷基烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  卤代烷氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  烷氧基羰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  卤代烷氧基羰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  烷基羰基和  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  卤代烷基羰基；

**[0038]** 每个  $\text{X}^2$  独立地为 O 或 S；

**[0039]** 每个  $\text{Z}^1$  独立地为直接键、O、 $\text{S}(\text{O})_n$ 、 $\text{NR}^6$ 、 $\text{C}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(\text{R}^7)=\text{C}(\text{R}^7)$ 、 $\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{C}(\text{R}^7)_2\text{O}$ 、 $\text{OC}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(=\text{X}^1)$ 、 $\text{C}(=\text{X}^1)\text{E}$ 、 $\text{EC}(=\text{X}^1)$ 、 $\text{C}(=\text{NOR}^8)$  或  $\text{C}(=\text{NN}(\text{R}^6)_2)$ ；

**[0040]** 每个  $\text{Q}^i$  独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $\text{C}(=\text{O})$  和  $\text{C}(=\text{S})$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^{24})_z$ ，每个环或环系任选地被至多 4 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $\text{CHO}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ 、 $\text{OR}^{11}$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ 、 $\text{Si}(\text{R}^{10})_3$  和  $\text{R}^{16}$ ；

**[0041]** 每个  $\text{Q}^t$  独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $\text{C}(=\text{O})$  和  $\text{C}(=\text{S})$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^{24})_z$ ，每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $\text{CHO}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ 、 $\text{OR}^{11}$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ 、 $\text{S}(=\text{O})(=\text{NR}^{21})\text{R}^{22}$ 、 $\text{Si}(\text{R}^{10})_3$  和  $\text{R}^{16}$ ；

**[0042]** 每个  $\text{R}^{15}$  独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $\text{SF}_5$ 、 $\text{OCN}$ 、 $\text{SCN}$ 、 $\text{CHO}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(=$

O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>)或Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基亚磺酰基或C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自R<sup>17</sup>；或

[0043] 在相邻环原子上的两个R<sup>15</sup>取代基与相邻环原子合在一起形成5元至7元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多3个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N，其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S)，并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)<sub>n</sub>，每个环任选地被至多3个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>卤代环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基和C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基；

[0044] 每个R<sup>16</sup>独立地为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；或苯基或5元或6元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；

[0045] 每个R<sup>17</sup>独立地为卤素、氰基、硝基、OH、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>或Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；

[0046] 每个R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>和R<sup>20</sup>独立地为Q<sup>t</sup>；或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环



烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;

[0047] 每个  $R^{21}$  独立地为  $Q^t$  或 H;或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;

[0048] 每个  $R^{22}$  和  $R^{23}$  独立地为  $Q^t$  或 H;或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;或

[0049]  $R^{22}$  和  $R^{23}$  与它们连接的氮原子合在一起形成 3 元至 7 元环,所述环包含选自碳原子和至多 2 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自一个 O、一个 S 和至多 2 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员选自 S、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ,所述环任选地被至多 4 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基和  $C_1-C_4$  烷基;

[0050] 每个  $R^{24}$  独立地为 H、氰基、OCN、SCN、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;

[0051] a 为 1、2 或 3;

[0052] 每个 n 独立地为 0、1 或 2;并且

[0053] 在每个  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$  的实例中, u 和 z 独立地为 0、1 或 2,前提条件是在每个  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$  的实例中, u 和 z 的和为 0、1 或 2。

[0054] 本发明还涉及式 1 的此类化合物(包括所有的立体异构体)、其 N-氧化物及其盐、以及包含它们的组合物和它们用于防治如上所述无脊椎害虫的用途,并且本文进一步的前提条件是当 A 为 O、S、 $NCH_3$  或  $C(R^{3c})=C(R^{3d})$ 、 $R^{3c}$  为 H 或 F,并且  $R^{3d}$  为 H、F、 $CF_2H$  或  $CF_3$  时,则  $R^{3a}$  或  $R^{3b}$  中的至少一个不是 H。

[0055] 本发明还提供了包含式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐和至少一种附加组分的组合物,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。在一个实施方案中,本发明还提供了用于防治无脊椎害虫的组合物,所述组合物包含式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐和至少一种附加组分,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂,所述组合物还包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0056] 本发明提供了用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐(例如作为本文所述组合物)接触。本发明还涉及此类方法,其中使无脊椎害虫或其环境与组合物接触,所述组合物包含生物

学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐和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,所述组合物还任选地包含生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0057] 本发明还提供用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的任何上述组合物接触,其中所述环境为植物。

[0058] 本发明还提供用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的任何上述组合物接触,其中所述环境为动物。

[0059] 本发明还提供用于防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的任何上述组合物接触,其中所述环境为种子。

[0060] 本发明还提供了用于保护种子免受无脊椎害虫的侵害的方法,所述方法包括使种子与生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐(例如作为本文所述的组合物)接触。本发明也涉及经处理的种子。

[0061] 本发明还提供了用于保护动物免受无脊椎寄生害虫的侵害的组合物,所述组合物包含杀寄生虫有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐和至少一种载体。

[0062] 本发明还提供了处理、预防、抑制和/或杀灭体外和/或体内寄生虫的方法,所述方法包括向动物和/或在动物上施用杀寄生虫有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐(例如为本文所述的组合物)。本发明还涉及此类方法,其中将杀寄生虫有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐(例如为本文所述的组合物)施用到动物居住的环境中(例如畜栏或毛毯)。

[0063] 发明详述

[0064] 如本文所用,术语“包括”(comprises, comprising, includes, including)、“包含”(comprises, comprising)、“具有”(has, having)、“含有”(contains, containing)、“特征在于”或者其任何其它变型旨在涵盖非排他性的包括,以任何明确指明的限定为条件。例如,包含一系列元素的组合物、混合物、工艺或方法不必仅限于那些元素,而是可包括未明确列出的其它元素,或此类组合物、混合物、工艺或方法的其它固有元素。

[0065] 连接短语“由...组成”不包括任何没有指定的元素、步骤或成分。如果是在权利要求中,则此类词限制权利要求,以不包含除了通常与之伴随的杂质以外不是所述那些的物质。当短语“由...组成”出现在权利要求的主体的子句中,而非紧接前序时,其仅限制在该子句中提到的元素;其它元素总体上不从权利要求中被排除。

[0066] 连接短语“基本上由...组成”用于定义组合物或方法,所述组合物或方法除了字面公开的那些以外,还包括物质、步骤、部件、组分或元素,前提条件是这些附加的物质、步骤、部件、组分或元素没有在很大程度上影响受权利要求书保护的本发明的基本特征和一种或多种新型特征。术语“基本上由...组成”居于“包含”和“由...组成”的中间。

[0067] 当申请人已经用开放式术语如“包含”定义了本发明或其一部分时,则应易于理解(除非另外指明),说明书应被解释为,还使用术语“基本上由...组成”或“由...组成”描述本发明。

[0068] 此外,除非有相反的确切说明,“或”是指包含性的“或”,而不是指排他性的“或”。例如,以下任何一种情况均满足条件 A 或 B:A 是真实的(或存在的)并且 B 是虚假的(或不存在的)、A 是虚假的(或不存在的)并且 B 是真实的(或存在的),以及 A 和 B 都是真

实的（或存在的）。

[0069] 同样，涉及元素或组分实例（即次数）的数目在本发明元素或组分前的不定冠词“一个”或“一种”旨在是非限制性的。因此，应将“一个”或“一种”理解为包括一个或至少一个，并且元素或组分的词语单数形式也包括复数指代，除非有数字明显表示单数。

[0070] 如本公开中所涉及的，术语“无脊椎害虫”包括具有经济学重要性的作为害虫的节肢动物、腹足动物和线虫动物。术语“节肢动物”包括昆虫、螨虫、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、马陆（millipede）、球潮虫（pill bug）和综合纲（symphylans）动物。术语“腹足动物”包括蜗牛、蛞蝓以及其它柄眼目（Stylommatophora）动物。术语“线虫动物”是指线虫动物门的生物体。术语“蠕虫”包括蛔虫、犬恶丝虫病、植食性线虫（线虫纲）、吸虫（吸虫纲）、棘头虫纲和绦虫（绦虫纲）。

[0071] 在本发明公开上下文中，“防治无脊椎害虫”是指抑制无脊椎害虫的生长（包括死亡、摄食量下降、和 / 或交配干扰），并且可类似定义相关的表达。

[0072] 术语“农学”是指大田作物产品，诸如食物和纤维，并且包括玉米、大豆和其它豆类、稻米、谷类食物（例如小麦、燕麦、大麦、裸麦、稻米、玉米）、叶菜（例如莴苣、卷心菜以及其它菜荚作物）、果菜（例如番茄、辣椒、茄子、十字花科植物和葫芦科植物）、马铃薯、甘薯、葡萄、棉花、木本果（例如梨果、硬质种子和柑橘）、小果（浆果、樱桃）以及其它特殊作物（例如低芥酸菜籽、向日葵、橄榄）的生长。

[0073] 术语“非农学的”是指不是大田作物的，诸如园艺作物（例如不在田地中生长的温室植物、苗圃植物或观赏植物）、居住结构、农学结构、商业结构和工业结构、草皮（例如草场、牧场、高尔夫球场、草坪、运动场等）、木制品、储藏产品、农林间作和植被管理、公共卫生（即人）和动物卫生（例如驯养动物诸如宠物、牲畜和家禽、未驯化的动物诸如野生动物）应用。

[0074] 非农学应用包括通过向要保护的动物施用杀寄生虫有效（即生物有效）量的本发明的化合物（通常为配制供兽用的组合物形式），保护动物免受无脊椎寄生害虫的侵害。如本公开和权利要求中所涉及的，术语“杀寄生虫的”和“杀寄生虫性”涉及观察得到的对无脊椎寄生害虫的效果以向动物提供保护，使其免受害虫的侵害。杀寄生虫效果通常涉及减少目标无脊椎寄生害虫的出现或活动。对害虫的此类效果包括坏死、致死、延缓生长、减少移动性或降低保留在宿主动物之上或之中的能力、摄食量下降以及抑制繁殖。对无脊椎寄生害虫的这些效果提供了对动物寄生侵染或感染的控制（包括预防、减少或消除）。

[0075] 在上文详述中，单独使用或在复合词如“卤代烷基”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。“烯基”包括直链或支链烯烃，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“烯基”还包括多烯，如 1,2-丙二烯基和 2,4-己二烯基。“炔基”包括直链或支链炔烃，如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、以及不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。“炔基”还包括由多个三键构成的部分，如 2,5-己二炔基。

[0076] “环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。术语“环烷基烷基”表示在烷基部分上取代的环烷基。“环烷基烷基”的实例包括环丙基甲基、环戊基乙基、以及键合到直链或支链烷基上的环烷基部分。“环烯基”包括如环戊烯基和环己烯基的基团、以及具有一个双键以上的基团，如 1,3-和 1,4-环己二烯基。术语“环烷氧基”表示环烷基连接并通

过氧原子连接,如环戊基氧和环己基氧。“烷基环烷基烷基”表示被烷基环烷基取代的烷基。“烷基环烷基烷基”的实例包括 1-、2-、3- 或 4- 甲基或乙基环己基甲基。术语“环烷基环烷基”表示在另一个环烷基环上取代的环烷基,其中每个环烷基环独立地具有 3 至 7 个碳原子环成员。环烷基环烷基的实例包括环丙基环丙基(如 1,1'-联环丙烷-1-基、1,1'-联环丙烷-2-基)、环己基环戊基(如 4-环戊基环己基)和环己基环己基(如 1,1'-双环己烷-1-基)和不同的顺式和反式环烷基环烷基异构体(如 (1R,2S)-1,1'-联环丙烷-2-基和 (1R,2R)-1,1'-联环丙烷-2-基)。“环烷氨基”表示被环烷基取代的 NH 基团。“环烷氨基”的实例包括环丙基氨基和环己基氨基。术语“环烷氨基烷基”表示在烷基上取代的环烷氨基。“环烷氨基烷基”的实例包括环丙基氨基甲基、环戊基氨基乙基、以及与直链或支链烷基键合的其它环烷氨基部分。

[0077] 单独的或在复合词如“卤代烷基”中的或者当在描述如“用卤素取代的烷基”中使用的术语“卤素”包括氟、氯、溴或碘。此外,当用于复合词如“卤代烷基”中时,或者当用于描述如“用卤素取代的烷基”中时,所述烷基可以用卤原子(其可以是相同的或不同的)部分地或完全地取代的。“卤代烷基”或“被卤素取代的烷基”的实例包括  $\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$  和  $\text{CCl}_2\text{CF}_3$ 。术语“卤代烯基”、“卤代炔基”、“卤代烷氧基”、“卤代烷硫基”、“卤代烷氨基”、“卤代烷基亚磺酰基”、“卤代烷基磺酰基”、“卤代环烷基”等的定义与术语“卤代烷基”类似。“卤代烯基”的实例包括  $(\text{Cl})_2\text{C} = \text{CHCH}_2$  和  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH} = \text{CHCH}_2$ 。“卤代炔基”的实例包括  $\text{HC} \equiv \text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C} \equiv \text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C} \equiv \text{C}$  和  $\text{FCH}_2\text{C} \equiv \text{CCH}_2$ 。“卤代烷氧基”的实例包括  $\text{CF}_3\text{O}$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$  和  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。“卤代烷硫基”的实例包括  $\text{CCl}_3\text{S}$ 、 $\text{CF}_3\text{S}$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$  和  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。“卤代烷氨基”的实例包括  $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{CHNH}$ 、 $(\text{CF}_3)_2\text{CHNH}$  和  $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{NH}$ 。“卤代烷基亚磺酰基”的实例包括  $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$  和  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})$ 。“卤代烷基磺酰基”的实例包括  $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$  和  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 。“卤代环烷基”的实例包括 2-氯环丙基、2-氟环丁基、3-溴环戊基和 4-氯环己基。单独的或复合词如“卤代二烷氨基”中的术语“卤代二烷基”是指两个烷基中的至少一个被至少一个卤素原子取代,并且每个卤代烷基可独立地被相同或不同的卤素原子部分或完全取代。“卤代二烷氨基”的实例包括  $(\text{BrCH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$  和  $\text{BrCH}_2\text{CH}_2(\text{ClCH}_2\text{CH}_2)\text{N}$ 。

[0078] “烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基以及不同的丁氧基、戊氧基和己氧基异构体。“烷氧基烷基”表示在烷基上取代的烷氧基。“烷氧基烷基”的实例包括  $\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 。“链烯氧基”包括连接在氧原子上并且通过氧原子连接的直链或支链烯基。“烯氧基”的实例包括  $\text{H}_2\text{C} = \text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C} = \text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH} = \text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH} = \text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$  和  $\text{CH}_2 = \text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。“炔氧基”包括直链或支链的炔氧基部分。“炔氧基”实例包括  $\text{HC} \equiv \text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C} \equiv \text{CCH}_2\text{O}$  和  $\text{CH}_3\text{C} \equiv \text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。

[0079] 术语“烷硫基”包括直链或支链烷硫基部分,诸如甲硫基、乙硫基和不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基异构体。“烷基亚磺酰基”包括烷基亚磺酰基的两种对映体。“烷基亚磺酰基”的实例包括  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})$  以及不同的丁基亚磺酰基、戊基亚磺酰基和己基亚磺酰基异构体。“烷基磺酰基”的实例包括  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2$  和不同的丁基磺酰基、戊基磺酰基和己基磺酰基异构体。如本文所用的化学缩写  $\text{S}(\text{O})$  和  $\text{S}(=\text{O})$  代表亚磺酰基部分。如本文所用的化学缩写  $\text{SO}_2$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$  和  $\text{S}(=\text{O})_2$  代表磺酰基部分。

[0080] “烷氨基”表示被直链或支链烷基取代的 NH 基团。“烷氨基”的实例包括  $\text{NHCH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。“二烷氨基”表示独立地被两个直链或支链烷基取代的 N 基团。“二烷氨基”的实例包括  $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{N}(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$  和  $\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ 。“卤代二烷氨基”表示一个直链或支链烷基部分和一个直链或支链卤代烷基部分键合到 N 基团上,或两个独立的直链或支链卤代烷基部分键合到 N 基团上,其中“卤代烷基”如上定义。“卤代二烷氨基”的实例包括  $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl})$  和  $\text{N}(\text{CF}_2\text{CF}_3)_2$ 。

[0081] “烷基羰基”表示键合到 C(O) 部分上的直链或支链烷基部分。如本文所用,化学缩写 C(O) 和 C(=O) 代表羰基部分。“烷基羰基”实例包括  $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。“卤代烷基羰基”的实例包括  $\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CCl}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CF}_3$  和  $\text{C}(\text{O})\text{CF}_2\text{CF}_3$ 。

[0082] “烷氧基羰基”表示直链或支链烷基部分键合到  $\text{CO}_2$  部分上。如本文所用的化学缩写  $\text{CO}_2$ 、C(O)O 和 C(=O)O 代表氧羰基部分。“烷氧基羰基”的实例包括  $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 。

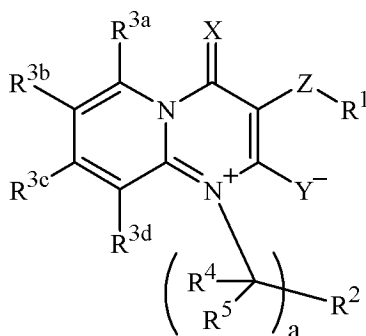
[0083] “烷氨基羰基”表示键合到 C(O)NH 部分上的直链或支链烷基部分。如本文所用,化学缩写 C(O)NH 和 C(O)N 代表酰胺部分(即氨基羰基)。“烷氨基羰基”的实例包括  $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$ 。“二烷氨基羰基”表示两个独立的直链或支链的烷基部分键合到 C(O)N 部分上。“二烷氨基羰基”的实例包括  $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$  和  $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$ 。

[0084] “三烷基甲硅烷基”包括连接在硅原子上并且通过硅原子连接的 3 个支链和 / 或直链烷基,诸如三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基和叔丁基二甲基甲硅烷基。

[0085] “CHO”表示甲酰基、“OCN”表示  $-\text{O}-\text{C}\equiv\text{N}$  并且“SCN”表示  $-\text{S}-\text{C}\equiv\text{N}$ 。

[0086] 当 A 为  $\text{C}(\text{R}^{3c})=\text{C}(\text{R}^{3d})$  时,所述  $\text{C}(\text{R}^{3c})=\text{C}(\text{R}^{3d})$  部分为取向的,以便键合到  $\text{R}^{3d}$  的碳原子直接连接到式 1 嘧啶环上,如下文所示。

[0087]



[0088] 取代基中的碳原子总数由“Ci-Cj”前缀表示,其中 i 和 j 为 1 至 14 的数。例如,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基命名为甲基至丁基;  $\text{C}_2$  烷氧基烷基表示  $\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ;  $\text{C}_3$  烷氧基烷基代表例如  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$  或  $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ; 并且  $\text{C}_4$  代表被包含共四个碳原子的烷氧基取代的各种烷基异构体,实例包括  $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$  和  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 。

[0089] 当基团包含可以是氢的取代基例如  $\text{R}^{3a}$  时,则当此取代基被认为是氢时,应该认识到这相当于所述基团是未取代的。当可变基团示出可任选地连接到一个位置上时,例如实例 1 的 U-36 中的  $(\text{R}^v)_r$ , 其中 r 可为 0, 则即使可变基团定义中没有进行叙述,氢也可以在所述位置上。当基团中的一个或多个位置被称为“没有取代的”或“未取代的”时,则连接了氢原子以占据任何自由价。

[0090] 除非另外指明,作为式 1 组分的“环”或“环系”为碳环的或杂环的。术语“环系”表示两个或更多个相连的环。术语“二环环系”表示由两个共享两个或多个共有原子的环构成的环系。

[0091] 环或二环环系可以是包含两个以上环的扩展环系的一部分,其中所述环或二环环系上的取代基合在一起形成额外的环,所述额外的环可与扩展环系中的其它环构成二环关系。

[0092] 术语“环成员”是指形成环或环系骨架的原子(例如 C、O、N 或 S)或其它部分(例如  $C(=O)$ 、 $C(=S)$  或  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ )。术语“芳族”表示每个环原子基本上在同一平面上,并且具有与所述环平面相垂直的 p 轨道和  $(4n+2)$  个  $\pi$  电子,与所述环或环系关联,以符合休克尔法则,其中 n 为正整数。

[0093] 关于环或环系“部分饱和的”和“部分不饱和的”是指所述环或环系包含至少一个双键但所述环或环系不是芳族。如果至少一个环成员为芳族,则环系为芳族。

[0094] 术语“碳环”表示其中形成环骨架的原子仅选自碳的环。除非另外指明,碳环可以是饱和的、部分不饱和的、或完全不饱和的环。当完全不饱和的碳环满足休克尔法则时,则所述环还被称为“芳环”。“饱和的碳环”是指具有的骨架由彼此通过单键连接的碳原子组成的环;除非另外指明,剩余的碳价被氢原子占据。

[0095] 术语“杂环”或“杂原子环”表示其中形成环骨架的至少一个原子不同于碳的环。除非另外指明,杂环可以是饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的环。“饱和的杂环”是指介于环成员之间仅包含单键的杂环。“部分饱和的杂环”是指包含至少一个双键但其不是芳族的杂环。术语“杂芳环”表示其中的至少一个形成环骨架的原子不是碳的完全不饱和的芳环。通常,杂芳环包含不超过 4 个氮、不超过 1 个氧、以及不超过 1 个硫。除非另外指明,杂芳环可通过任何可利用的碳或氮通过替换所述碳或氮上的氢来连接。术语“杂芳族二环环系”表示由两个稠环组成的环系,其中两个环中有至少一个为如上定义的杂芳环。

[0096] 当基团(例如在  $R^1$  定义中的 3 元至 10 元环)任选地被列出的取代基取代同时说明了取代基数目(例如“至多 5”)时,则所述基团可以是未取代的或被许多取代基取代,所述取代基数变化范围最多达到所述最大值(例如“5”),并且所连接的取代基独立地选自列出取代基。

[0097] 当取代基(如  $R^1$ )为环或环系时,其可通过任何可获得的环成员连接到式 1 的剩余部分上,除非另有所述。

[0098] 如上所记录, $R^1$  为特别是 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。在该定义中,选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N 的环成员是任选的,因为杂原子环成员数目可为零。当不存在杂原子环成员时,所述环或环系为碳环。如果存在至少一个杂原子环成员,则所述环或环系为杂环。 $S(=O)_u(=NR^{24})_z$  的定义容许至多 2 个硫环成员,其可为氧化的硫部分(如  $S(=O)$  或  $S(=O)_2$ )或未氧化的硫原子(即当 u 和 z 均为零时)。氮原子环成员可被氧化成 N-氧化物,因为与式 1 相关的化合物还包括 N-氧化物衍生物。除了最多 4 个杂原子以外,还有至多 3 个选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$  的

碳原子环成员,所述杂原子选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N 原子。由于  $R^{14}$  取代基是任选的,因此可存在 0 至 5 个取代基,这仅受到可得连接点的限制。

[0099] 与如环或环系的基团相关的术语“未取代的”表示所述基团除了其与式 1 剩余部分的一个或多个连接基以外不具有任何取代基。术语“任选地被取代”是指取代基数目可为零。除非另外指明,通过在任何可利用碳或氮原子上用非氢取代基取代氢原子,任选地被取代的基团可被能够容纳数目的任选取代基取代。通常,任选取代基(如果存在的话)的数目在 1 至 3 的范围内。

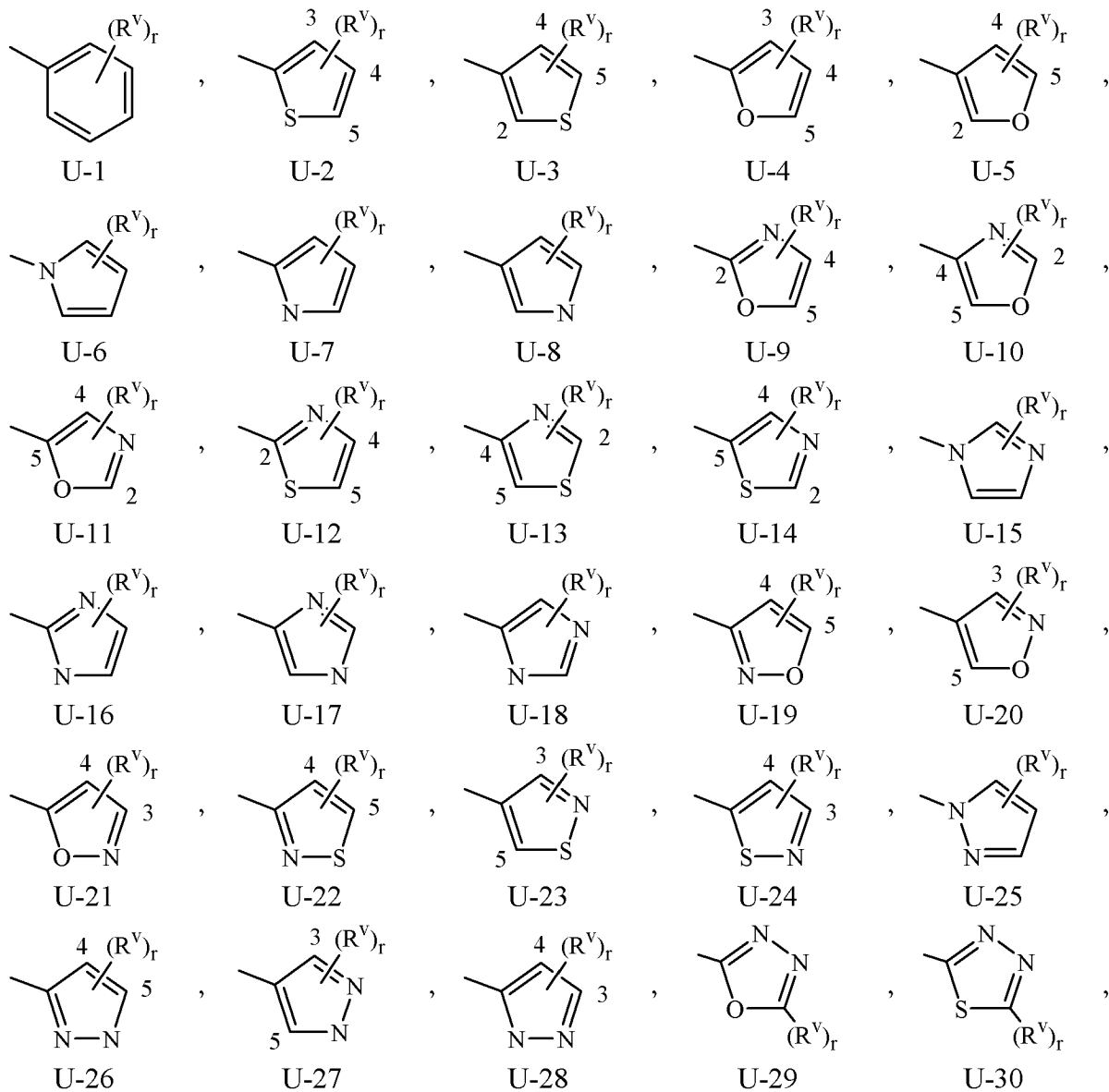
[0100] 任选的取代基数目可能受指定限制的约束。例如,短语“任选地被至多 5 个独立地选自  $R^{15}$  的取代基取代”是指能够存在 0、1、2、3、4 或 5 个取代基(如果可能的连接点数允许)。当指定的取代基数范围超出环上可得的取代基位置数时,实际较高的范围端点被认为是可得位置数。

[0101] 当任选的取代基数目不被表达的限制所限定时(如短语“任选地被卤素取代”或“未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自”),应理解是指任选的取代基数目可在 0 至多可得位置数的范围内。本领域的技术人员将会知道当某些诸如卤素取代基可存在于每个可得位置时(例如  $C_2F_5$  取代基为被最大数 5 个氟原子取代的  $C_2$  烷基),现实的因数,如成本和合成可达性可限制其它取代基出现的数目。这些限制为本领域的技术人员已知的一般的合成知识的一部分。值得注意的是,如果被可得位置数所容纳,在其中缺乏任选的取代基数目表达限制的实施方案中,任选的取代基数目至多为 3 个(即,0、1、2 或 3)。

[0102] 如上所述,取代基如  $R^1$  可为(除了别的以外)任选地被一个或多个取代基取代的 5 元或 6 元杂芳环,所述取代基选自如发明概述中所定义的取代基。任选地被一个或多个取代基取代的 5 元或 6 元杂芳环包括示例 1 所示的环 U-2 至 U-61,其中  $R^v$  是如发明概述中所定义的任何取代基(例如对于  $R^1$ ),并且  $r$  为 0 至 5 的整数,其受限於每个 U 基团上的可得位置数。由于 U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42 和 U-43 仅有一个可获得的位置,因此对于这些 U 基团, $r$  限于整数 0 或 1,并且  $r$  为 0 是指 U 基团是未取代的,并且有一个氢在  $(R^v)_r$  所示的位置。

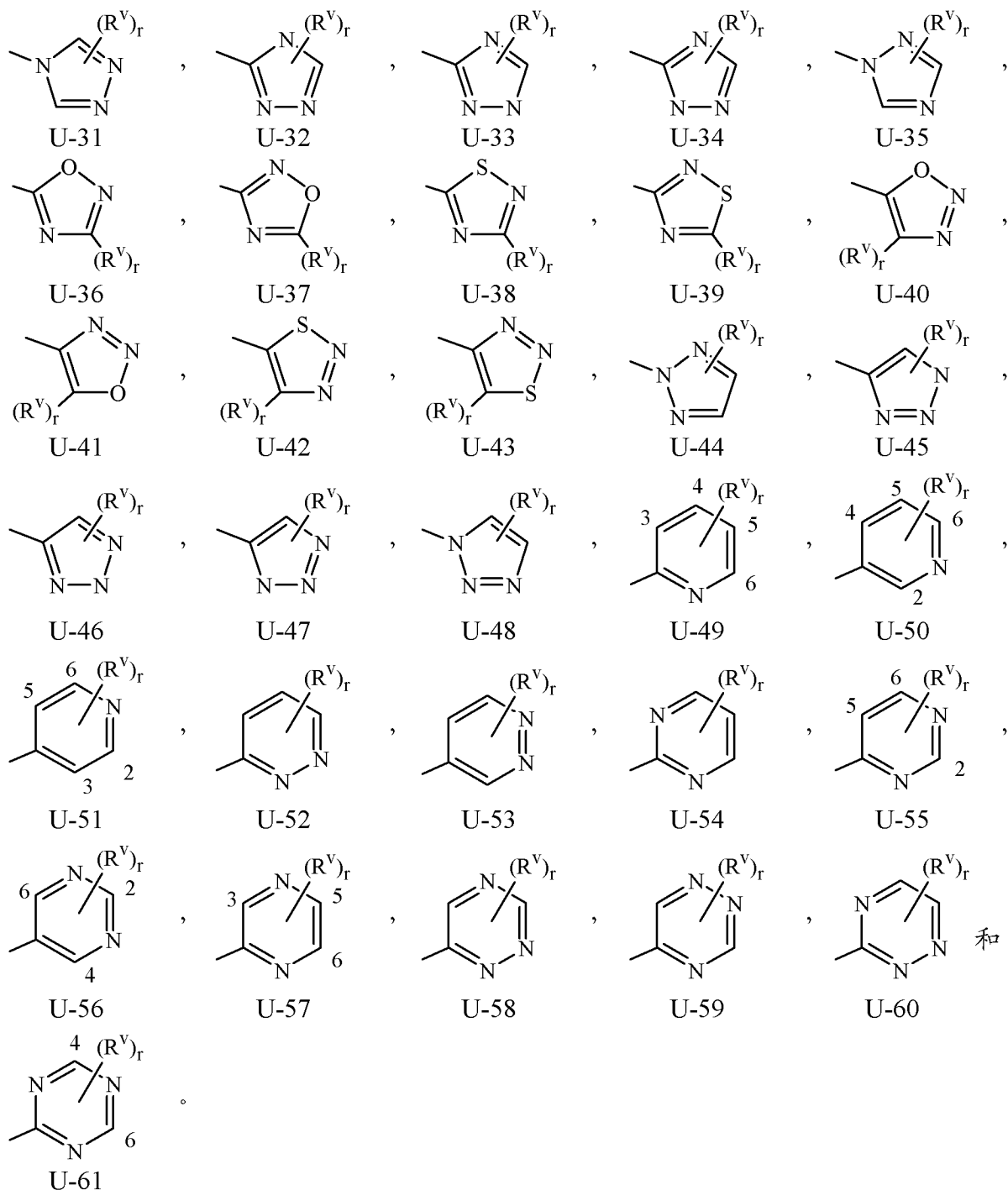
[0103] 示例 1

[0104]



[0105]



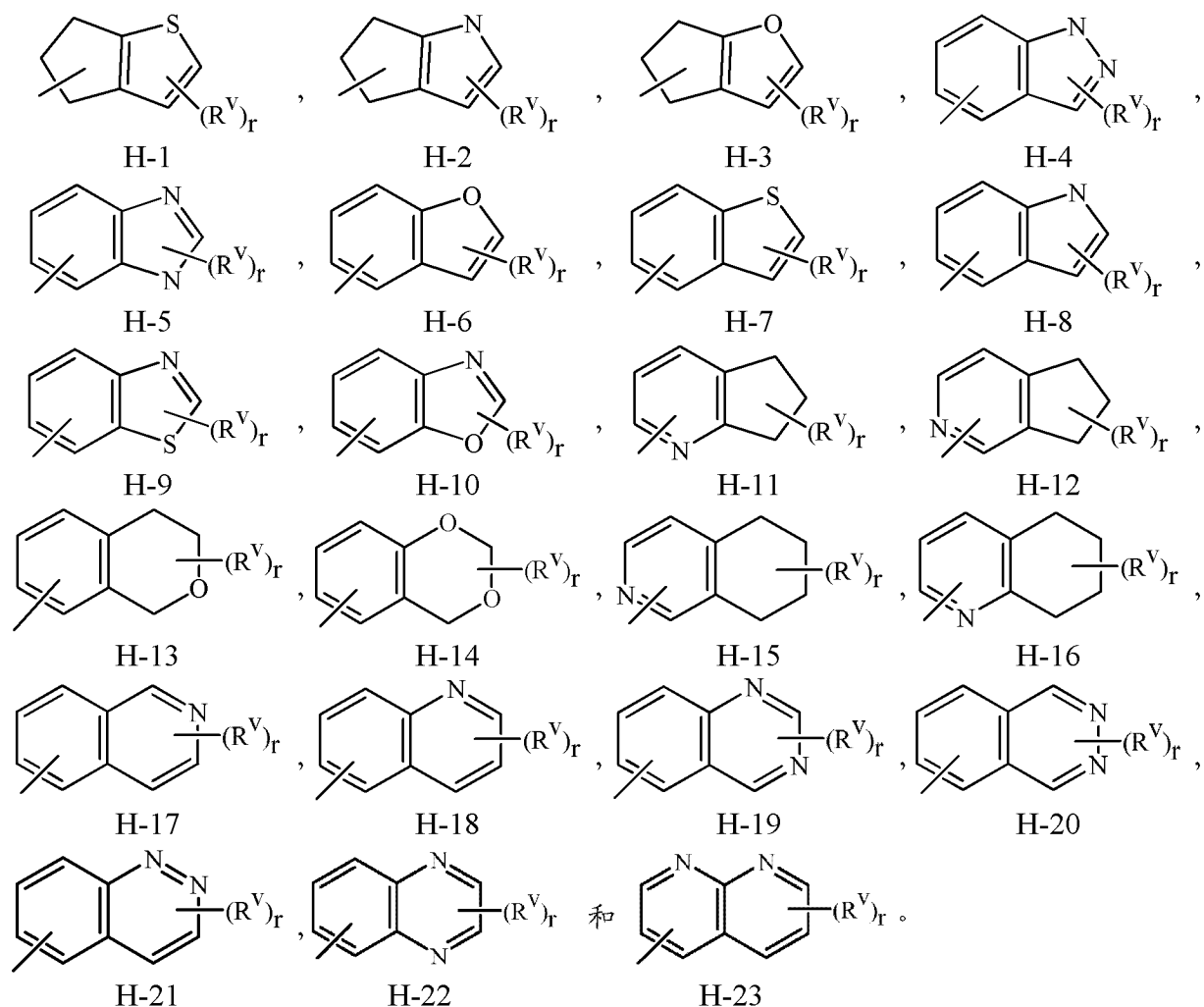


[0106] 如上所述,取代基如  $R^1$  可为(除了别的以外)任选地被至多 5 个取代基取代的 8 元、9 元或 10 元杂芳族二环环系,所述取代基选自如发明概述中所定义的取代基。任选地被至多 5 个取代基取代的 8 元、9 元或 10 元杂芳族二环环系的实例包括示例 2 所示的环系 H-1 至 H-23,其中  $R^v$  是如发

[0107] 明概述中所定义的任何取代基(例如对于  $R^1$ ),并且  $r$  为 0 至 5 的整数,其受限于每个 H 基团上的可得位置数。

[0108] 示例 2

[0109]

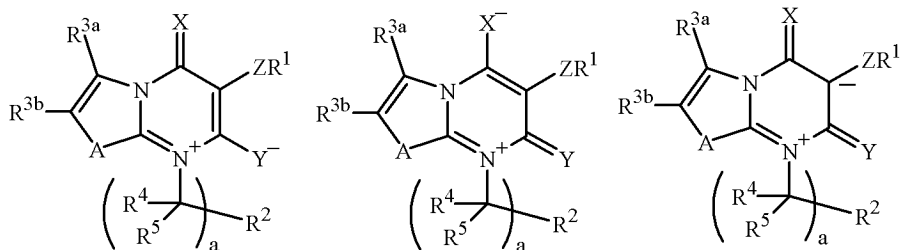


[0110] 虽然在结构 U-1 至 U-61 和 H-1 至 H-23 中示出了  $R^V$  基团,但是注意到,由于它们是任选的取代基,因此不是必须存在的。需要取代来填充其化合价的氮原子可被 H 或  $R^V$  取代。注意到,当  $(R^V)_r$  与 U 或 H 基团间的连接点显示成浮置时,  $(R^V)_r$  可与 U 或 H 基团中的任何可得碳原子或氮原子连接。注意到,当 U 或 H 基团上的连接点表示成浮置时,则所述 U 或 H 基团可通过替换氢原子而通过 U 或 H 基团中的任何可得碳或氮连接到式 1 的其余部分上。

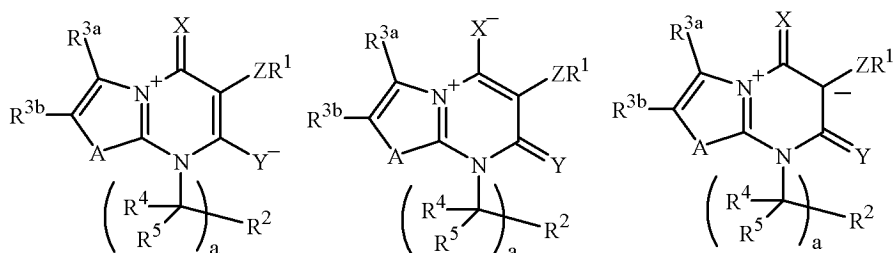
[0111] 本领域中已知有多种合成方法能够制备芳香族的和非芳香族的杂环和环系;大量的综述参见八卷集的“Comprehensive Heterocyclic Chemistry”(A. R. Katritzky 和 C. W. Rees 主编, Pergamon Press, Oxford, 1984 年和十二卷集的 Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. V. Scriven 主编, Pergamon Press, Oxford, 1996)。

[0112] 式 1 的化合物为介离子内盐。还在本领域已知为“两性离子”的“内盐”为电中性分子,但根据价键理论,在不同的原子的每个价键结构中携带形式正电荷和负电荷。此外,式 1 的化合物的分子结构可由下示六种价键结构表示,每一种在不同的原子上带有形式正电荷和负电荷。由于这种共振,式 1 的化合物还被描述为“介离子”。虽然为简洁起见,将式 1 的分子结构描述为本文单一价键结构,但是此具体价键结构应被理解为是涉及式 1 的化合物分子内连接的所有六种价键结构的代表。因此,除非另外指明,对本文式 1 的引用涉及所有六种适用的价键结构以及其它(例如分子轨道理论)结构。

[0113]



1



[0114] 本发明的化合物可以一种或多种立体异构体的形式存在。多种立体异构体包括对映异构体、非对映异构体、阻转异构体和几何异构体。本领域的技术人员将会知道,当一种立体异构体相对于其它立体异构体富集时或者当与其它立体异构体分离时,其可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外,本领域的技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。本发明的化合物可作为立体异构体的混合物、单独的立体异构体、或作为旋光活性的形式存在。

[0115] 由于因空间位阻造成键旋转受限,因此本发明的化合物可以一种或更多种构象异构体形式存在。例如,由于围绕 R<sup>1</sup>- 嘧啶环键的旋转受限,因此式 1 的化合物,其中 Z 为直接键,并且 R<sup>1</sup> 为在邻位上被具有空间需求的烷基(例如异丙基)取代的苯基可以两种旋转异构体形式存在。本发明包括构象异构体的混合物。此外,本发明包括相对于其它构象异构体富集了一种构象异构体的化合物。

[0116] 选自式 1 的化合物(包括其所有立体异构体、其 N-氧化物及其盐)通常以一种以上的形式存在,从而式 1 包括式 1 表示的所有晶体和非晶体形式的化合物。非晶体形式包括为固体的实施方案如蜡和树胶,以及为液体的实施方案如溶液和熔融物。晶体形式包括代表基本上单一晶型体的实施方案,和代表多晶型体(即不同晶型)混合物的实施方案。术语“多晶型体”是指可以不同晶型结晶的化学化合物的具体晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和/或构象。虽然多晶型体可具有相同的化学组成,但是它们也可具有不同的组成,这应归因于是否存在微弱或强力键合于晶格内的共结晶的水或其它分子。多晶型体可具有不同的化学、物理和生物特性,如晶体形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、可悬浮性、溶解率和生物利用度。本领域的技术人员将会知道,相对于由式 1 表示的相同化合物的另一种多晶型体或多晶型体混合物,由式 1 表示的化合物的多晶型体可显示出有益效果(例如制备可用制剂的合适性,经改善的生物性能)。由式 1 表示的化合物的具体多晶型体的制备和分离可通过本领域技术人员已知的方法实现,包括例如采用所选溶剂和温度进行结晶。

[0117] 本领域的技术人员将会理解,不是所有的含氮杂环都可以形成 N-氧化物,因为氮需要有可氧化为氧化物的可用孤对电子;本领域的技术人员将识别出可形成 N-氧化

物的那些含氮杂环。本领域的技术人员还将会知道,叔胺可形成N-氧化物。用于制备杂环和叔胺的N-氧化物的合成方法是本领域技术人员熟知的,包括使用过氧酸(如过乙酸和3-间氯过氧苯甲酸(MCPBA))、过氧化氢、烷基氢过氧化物(如叔丁基氢过氧化物)、过硼酸钠和双环氧乙烷(如二甲基双环氧乙烷)来氧化杂环和叔胺。制备N-氧化物的这些方法已被广泛描述和综述于文献中,参见例如:T.L.Gilchrist的Comprehensive Organic Synthesis第7卷,第748-750页(S.V.Ley编辑,Pergamon Press);M.Tisler和B.Stanovnik,“Comprehensive Heterocyclic Chemistry”第3卷,第18-20页,A.J.Boulton和A.McKillop编辑,Pergamon Press;M.R.Grimmett和B.R.T.Keene,“Advances in Heterocyclic Chemistry”第43卷,第149-161页(A.R.Katritzky编辑,Academic Press);M.Tisler和B.Stanovnik,“Advances in Heterocyclic Chemistry”第9卷,第285-291页(A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,Academic Press);以及G.W.H.Cheeseman和E.S.G.Werstiuk,“Advances in Heterocyclic Chemistry”第22卷,第390-392页(A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,Academic Press)。

[0118] 本领域的技术人员认识到,由于在环境和生理条件下化学化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡,因此盐与非盐形式具有共同的生物用途。因此,式1的化合物的各种各样的盐可用于防治无脊椎害虫和动物寄生虫(即,适用于动物健康用途)。式1的化合物的盐包括与无机酸或有机酸形成的酸加成盐,所述酸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、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。当式1的化合物包含酸性部分诸如羧酸或苯酚时,盐还包括与有机碱或无机碱诸如吡啶、三乙基胺或氨、或者钠、钾、锂、钙、镁或钡的氯化物、氢化物、氢氧化物或碳酸盐形成的那些。因此,本发明包括选自式1的化合物、它们的N-氧化物和盐。

[0119] 如发明概述中所述的本发明实施方案包括下述那些。在下列实施方案中,式1包括其立体异构体、其N-氧化物及其盐,并且除非在实施方案中另外定义,涉及“式1的化合物”的描述包括发明概述中对指定取代基的定义。

[0120] 在随后的实施方案中,在多于一种的可变物之前定义的字“独立地”的详述是指定义独立于其它可变物可施用到每个可变物。例如,详述“当单独存在时,独立的 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 和单独存在时, $R^{3c}$ 为H或卤素”的实施方案相当于三个详述的实施方案:“ $R^{3a}$ 为H或卤素”、“当单独存在时 $R^{3b}$ 为H或卤素”、以及“当单独存在时 $R^{3c}$ 为H或卤素”,它们中的每一个可独立地用作基准以修正或增加权利要求。

[0121] 实施方案1:式1的化合物,其中X为O。

[0122] 实施方案2:式1的化合物,其中X为S。

[0123] 实施方案3:式1或实施方案1或2中的化合物,其中Y为O。

[0124] 实施方案4:式1或实施方案1或2中的化合物,其中Y为S。

[0125] 实施方案5:式1或实施方案1-4中的任一项的化合物,其中A为

[0126] S、 $NR^{3e}$ 或 $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$ 。

[0127] 实施方案5a:实施方案5的化合物,其中A为S或 $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$ 。

[0128] 实施方案5b:实施方案5a的化合物,其中A为 $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$ 。

[0129] 实施方案5c:实施方案5a的化合物,其中A为S。

[0130] 实施方案5d:实施方案5的化合物,其中A为 $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$ 或 $NR^{3e}$ ;

[0131] 实施方案 5e :实施方案 5d 的化合物,其中 A 为  $\text{NR}^{3e}$ 。

[0132] 实施方案 6 :式 1 或实施方案 1-5b 中的任一项的化合物,其中当单独

[0133] 存在时独立的  $\text{R}^{3a}$  (即,当  $\text{R}^{3a}$  不与  $\text{R}^{3b}$  合在一起形成环时),当

[0134] 单独存在时  $\text{R}^{3b}$  (即,当  $\text{R}^{3b}$  不与  $\text{R}^{3a}$ 、 $\text{R}^{3c}$  或  $\text{R}^{3e}$  合在一起形成环时),当单独存在时  $\text{R}^{3c}$  (即,当  $\text{R}^{3c}$  不与  $\text{R}^{3b}$  或  $\text{R}^{3d}$  合在一起形成环时),并且当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  (即,当  $\text{R}^{3d}$  不与  $\text{R}^{3c}$  合在一起形成环时) 为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $\text{SF}_5$ 、 $\text{OCN}$ 、 $\text{SCN}$ 、 $\text{CHO}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^{18}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{18}$ 、 $\text{NHR}^{18}$ 、 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{OR}^{18}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{21})\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{OSO}_2\text{R}^{18}$ 、 $\text{OSO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{SO}_2\text{R}^{18}$ 、 $\text{NR}^{21}\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{Si}(\text{R}^{18}\text{R}^{19}\text{R}^{20})$  或  $\text{Z}^1\text{Q}^t$ ;或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_{10}$  环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基、 $\text{C}_6$ - $\text{C}_{14}$  环烷基环烷基、 $\text{C}_5$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烯基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷氧基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基磺酰基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷硫基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷基亚磺酰基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷基磺酰基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷硫基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯硫基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基亚磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔硫基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基亚磺酰基或  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $\text{R}^{17}$ 。

[0135] 实施方案 6a :实施方案 6 的化合物,其中当单独存在时独立的  $\text{R}^{3a}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3b}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3c}$ ,并且当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  为 H、卤素、氰基、 $\text{OCN}$ 、 $\text{SCN}$ 、 $\text{CHO}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^{18}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{18}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{OR}^{18}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^{21}\text{R}^{19}$  或  $\text{Z}^1\text{Q}^t$ ;或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_{10}$  环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基、 $\text{C}_6$ - $\text{C}_{14}$  环烷基环烷基、 $\text{C}_5$ - $\text{C}_{10}$  烷基环烷基烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烯基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷氧基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷硫基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷硫基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷硫基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $\text{C}_4$ - $\text{C}_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯硫基或  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔硫基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $\text{R}^{17}$ 。

[0136] 实施方案 6b :实施方案 6a 的化合物,其中当单独存在时独立的  $\text{R}^{3a}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3b}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3c}$ ,并且当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  为 H 或卤素;或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_{10}$  环烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  环烷氧基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  烯氧基或  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  炔氧基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $\text{R}^{17}$ 。

[0137] 实施方案 6c :实施方案 6b 的化合物,其中当单独存在时独立的  $\text{R}^{3a}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3b}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3c}$ ,并且当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  为 H 或卤素;或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_{10}$  环烷基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基,各自任选地被卤素取代。

[0138] 实施方案 6d :实施方案 6c 的化合物,其中当单独存在时独立的  $\text{R}^{3a}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3b}$ ,并且当单独存在时  $\text{R}^{3c}$  为 H 或卤素。

[0139] 实施方案 6e :实施方案 6d 的化合物,其中当单独存在时独立的  $\text{R}^{3a}$ ,当单独存在时  $\text{R}^{3b}$ ,并且当单独存在时  $\text{R}^{3c}$  为 H。

[0140] 实施方案 7 :式 1 或实施方案 1-6e 中的任一项的化合物,其中当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  为 H、卤素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷氧基。

[0141] 实施方案 7a :实施方案 7 的化合物,其中当单独存在时  $\text{R}^{3d}$  为卤素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  烷基或

C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基。

[0142] 实施方案 7a1 :式 1 或实施方案 1-6e 中的任一项的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 卤代烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 卤代烷氧基。

[0143] 实施方案 7b :实施方案 7 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

[0144] 实施方案 7c :实施方案 7b 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为 F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 或 OCH<sub>3</sub>。

[0145] 实施方案 7d :实施方案 7c 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为 CH<sub>3</sub>。

[0146] 实施方案 7e :实施方案 7 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为 H、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

[0147] 实施方案 7f :实施方案 7e 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为 H 或卤素。

[0148] 实施方案 7g :实施方案 7e 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3d</sup> 为 H、F、Cl、Br、CH<sub>3</sub> 或 OCH<sub>3</sub>。

[0149] 实施方案 8 :式 1 或实施方案 1 至 7g 中的任一项的化合物,其中 R<sup>3c</sup> 和 R<sup>3d</sup> 单独存在。

[0150] 实施方案 9 :式 1 或实施方案 1 至 7g 中的任一项的化合物,其中当 R<sup>3c</sup> 和 R<sup>3d</sup> 与它们连接到的相邻碳原子合在一起形成 5 元或 6 元环(可理解它们任选地被在发明概述中所述取代基取代)。

[0151] 实施方案 9a :实施方案 9 的化合物,其中形成的 5 元或 6 元环为芳族。

[0152] 实施方案 9b :实施方案 9a 的化合物,其中形成的 5 元或 6 元环为 6 元和碳环(即任选地如在实施方案 9 中所述的被取代的稠合的苯环)。

[0153] 实施方案 9d :实施方案 9 的化合物,其中形成的 5 元或 6 元环为部分不饱和的(并且为碳环的或杂环的)。

[0154] 实施方案 9e :式 1 或实施方案 1-7g 和 9-9d 中的任一项的化合物,其中 R<sup>3c</sup> 和 R<sup>3d</sup> 与它们连接到的碳原子合在一起形成环(其如在实施方案 9 中所述的任选地被取代)。

[0155] 实施方案 10 :式 1 或实施方案 1-9d 中的任一项的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3e</sup> (即,当 R<sup>3e</sup> 不与 R<sup>3b</sup> 合在一起形成环时)为 H、羟基、氨基、CHO、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>)或 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>;或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯氧基或 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 炔氧基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自 R<sup>17</sup>。

[0156] 实施方案 10a :实施方案 10 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3e</sup> 为 H、CHO、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基。

[0157] 实施方案 10b :实施方案 10a 的化合物,其中当单独存在时 R<sup>3e</sup> 为 H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

- [0158] 实施方案 10c :实施方案 10b 的化合物,其中当单独存在时  $R^{3e}$  为 H 或  $C_1-C_4$  烷基。
- [0159] 实施方案 10d :实施方案 10c 的化合物,其中当单独存在时  $R^{3e}$  为  $C_1-C_4$  烷基。
- [0160] 实施方案 10e :实施方案 10d 的化合物,其中当单独存在时  $R^{3e}$  为  $CH_3$ 。
- [0161] 实施方案 10f :实施方案 10c 的化合物,其中当单独存在时  $R^{3e}$  为 H 或  $CH_3$ 。
- [0162] 实施方案 10g :实施方案 10f 的化合物,其中当单独存在时  $R^{3e}$  为 H。
- [0163] 实施方案 11 :式 1 或实施方案 1-10 中的任一项的化合物,其中在  $R^{3e}$  的定义中  $R^{17}$  为实例独立地选自  $R^{17a}$ ;  $R^{17a}$  为卤素、 $OR^{11}$  或  $Z^{1a}Q^t$ ; 并且  $Z^{1a}$  为直接键。
- [0164] 实施方案 12 :式 1 或实施方案 1 至 11 中的任一项的化合物,其中  $R^{3b}$  和  $R^{3e}$  单独存在 (即  $R^{3b}$  和  $R^{3e}$  没有合在一起形成环)。
- [0165] 实施方案 13 :式 1 或实施方案 1 至 11 中的任一项的化合物,其中当  $R^{3e}$  和  $R^{3b}$  与它们连接到的相邻碳原子合在一起形成 5 元或 6 元环 (可理解它们任选地被在发明概述中所述取代基取代)。
- [0166] 实施方案 14 :实施方案 13 的化合物,其中形成的 5 元或 6 元环为稠合的吡啶环 (其如在实施方案 13 中所述的任选地被取代)。
- [0167] 实施方案 15 :式 1 或实施方案 1 至 14 中的任一项的化合物,其中 Z 为直接键、O、 $NR^6$ 、 $C(=X^1)$ 、 $C(=X^1)E$ 、 $EC(=X^1)$ 、 $C(=NOR^8)$  或  $C(=NN(R^6)_2)$ 。
- [0168] 实施方案 15a :实施方案 15 的化合物,其中 Z 为直接键、 $C(=X^1)$ 、 $C(=X^1)E$ 、 $EC(=X^1)$ 、 $C(=NOR^8)$  或  $C(=NN(R^6)_2)$ 。
- [0169] 实施方案 15b :实施方案 15a 的化合物,其中 Z 为直接键、 $C(=X^1)$  或  $C(=X^1)E$ 。
- [0170] 实施方案 15c :实施方案 15b 的化合物,其中 Z 为  $C(=X^1)E$ 。
- [0171] 实施方案 15d :实施方案 15b 的化合物,其中 Z 为  $C(=X^1)$ 。
- [0172] 实施方案 15e :实施方案 15b 中的化合物,其中 Z 为直接键。
- [0173] 实施方案 16 :式 1 或实施方案 1-15d 中的任一项的化合物,其中  $X^1$  为 O 或 S。
- [0174] 实施方案 16a :式 1 或实施方案 1-15d 中的任一项的化合物,其中  $X^1$  为  $NR^9$ 。
- [0175] 实施方案 16b :实施方案 16 中的化合物,其中  $X^1$  为 O。
- [0176] 实施方案 16c :实施方案 16 中的化合物,其中  $X^1$  为 S。
- [0177] 实施方案 17 :式 1 或实施方案 1-15c 中任一项的化合物,其中 E 为 O。
- [0178] 实施方案 17a :式 1 或实施方案 1-15c 中任一项的化合物,其中 E 为 S。
- [0179] 实施方案 17b :式 1 或实施方案 1-15c 中任一项的化合物,其中 E 为  $NR^{9a}$ 。
- [0180] 实施方案 18 :式 1 或实施方案 1-15d 和 16a 中任一项的化合物,其中每个  $R^9$  独立地为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基。
- [0181] 实施方案 18a :实施方案 18 的化合物,其中每个  $R^9$  独立地为  $CH_3$ 、 $C(=O)CH_3$  或  $C(=O)OCH_3$ 。
- [0182] 实施方案 19 :式 1 或实施方案 1-15c、16-16c 和 17b 中的任一项的化合物,其中每个  $R^{9a}$  独立地为 H、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基。
- [0183] 实施方案 19a :实施方案 19 的化合物,其中每个  $R^{9a}$  独立地为 H、 $CH_3$ 、 $C(=O)CH_3$  或  $C(=O)OCH_3$ 。
- [0184] 实施方案 20 :式 1 或实施方案 1-19a 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  为 H、卤素、氰基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$  或  $C(=S)NH_2$ ; 或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$

环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $Z^1Q^t$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0185] 实施方案 20a:实施方案 20 的化合物,其中  $R^1$  为 H、卤素、氰基或 CHO;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基或  $C_3-C_6$  环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $Z^1Q^t$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0186] 实施方案 20b:实施方案 20a 的化合物,其中  $R^1$  为 H、卤素或 CHO;或未取代的或被至少一个取代基取代的  $C_1-C_8$  烷基,所述取代基独立地选自卤素和  $Z^1Q^t$ ;或  $C_2-C_8$  烯基或  $C_2-C_8$  炔基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $Z^1Q^t$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0187] 实施方案 20c:式 1 或实施方案 1-20b 中的任一项的化合物,其中在  $R^1$  定义中  $Z^1Q^t$  的实例独立地选自  $Z^{1b}Q^{1b}$ ;其中  $Z^{1b}$  为直接键;并且  $Q^{1b}$  为未取代的或被至少一个取代基取代的 5 元或 6 元碳环或杂环,所述取代基独立地选自卤素、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷氧基、 $C_1-C_4$  烷基硫基、 $C_1-C_4$  卤代烷基硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基和  $C_1-C_4$  卤代烷基亚磺酰基。

[0188] 实施方案 21:实施方案 20b 的化合物,其中  $R^1$  为任选地被卤素取代的  $C_1-C_8$  烷基或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0189] 实施方案 21a:实施方案 21 的化合物,其中  $R^1$  为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基



取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0190] 实施方案 21b:式 1 或实施方案 1-21 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  的环或环系是部分不饱和的或芳族(包括杂芳族)。

[0191] 实施方案 21c:实施方案 21b 的化合物,其中  $R^1$  的环或环系是芳族(包括杂芳族)。

[0192] 实施方案 21d:式 1 或实施方案 1-21c 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  的环或环系是二环的。

[0193] 实施方案 22:式 1 或实施方案 1-21c 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  为 3 元至 10 元环,所述环包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,并且任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0194] 实施方案 22a:实施方案 22 的化合物,其中  $R^1$  的环为 5 元或 6 元。

[0195] 实施方案 22b:实施方案 22 或 22a 的化合物,其中  $R^1$  的环为碳环。

[0196] 实施方案 22c:实施方案 22 或 22a 的化合物,其中  $R^1$  的环为杂环。

[0197] 实施方案 22d:实施方案 22a 的化合物,其中所述环为任选地被至多 5 个取代基取代的苯基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;任选地被至多 3 个取代基取代的 5 元杂环,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;或任选地被至多 5 个取代基取代的 6 元杂环,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0198] 实施方案 22e:实施方案 22d 的化合物,其中  $R^1$  为任选地被至多 5 个取代基取代的苯基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;或任选地被至多 4 个取代基取代的吡啶基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0199] 实施方案 22f:实施方案 22e 的化合物,其中  $R^1$  为任选地被至多 3 个取代基取代的苯基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;或任选地被至多 2 个取代基取代的吡啶基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0200] 实施方案 22g:实施方案 22f 的化合物,其中  $R^1$  为任选地被至多 3 个取代基取代的苯基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0201] 实施方案 22h:实施方案 22f 的化合物,其中  $R^1$  为任选地被至多 2 个取代基取代的吡啶基,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0202] 实施方案 22i:式 1 或实施方案 1-22h 中的任一项的化合物,其中当单独存在时  $R^{14}$ (即当没有与另一个  $R^{14}$  的实例在邻近环的原子上合在一起形成环时)为卤素、氰基、 $SF_5$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $Z^1Q^t$  或  $Z^1Q^iZ^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  炔硫基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17a}$ ;并且  $R^{17a}$  为卤素、 $OR^{11}$  或  $Z^1Q^t$ 。

[0203] 实施方案 22j:实施方案 22i 的化合物,其中当单独存在时  $R^{14}$  为卤素或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基或  $C_1-C_8$  烷硫基,各自任选地被卤素取代。

[0204] 实施方案 22k:式 1 或实施方案 1-22j 中的任一项的化合物,其中每个  $R^{14}$  的实例单独存在(即没有与另一个  $R^{14}$  的实例在邻近环的原子上合在一起形成环)。

[0205] 实施方案 22m:式 1 或实施方案 1-22d 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  为苯基或 6 元

杂芳环,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0206] 实施方案 22m1 :式 1 或实施方案 1-22d 中的任一项的化合物,其中  $R^1$  为苯基或 5 元或 6 元杂芳环,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0207] 实施方案 22n :实施方案 22m 的化合物,其中  $R^1$  为苯基或吡啶基,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ 。

[0208] 实施方案 22o :实施方案 22m 或 22n 的化合物,其中  $R^{14}$  为卤素、氰基、 $C(=NOR^{21})R^{22}$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基或  $C_1-C_8$  烷硫基,各自任选地被卤素取代。

[0209] 实施方案 22o1 :实施方案 22m、22m1 或 22n 的化合物,其中  $R^{14}$  为卤素、氰基、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=NOR^{21})R^{22}$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基或  $C_1-C_8$  烷硫基,各自任选地被卤素取代。

[0210] 实施方案 22p :实施方案 22o 中的化合物,其中  $R^{21}$  为  $C_1-C_4$  烷基。

[0211] 实施方案 22q :实施方案 22o 中的化合物,其中  $R^{22}$  为  $C_1-C_4$  烷基。

[0212] 实施方案 22r :实施方案 22o 中的化合物,其中一个  $R^{14}$  为  $Z^1Q^t$ ;  $Z^1$  为直接键;并且  $Q^t$  为苯基、吡啶基或嘧啶基,各自任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基和  $C_1-C_4$  卤代烷氧基。

[0213] 实施方案 23 :式 1 或实施方案 1-22r 中的任一项的化合物,其中  $R^2$  为 H、卤素、氰基、CHO、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$  或  $SO_2NR^{21}R^{19}$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0214] 实施方案 23a :实施方案 23 的化合物,其中  $R^2$  为 H、卤素、氰基、CHO、 $C(=O)R^{18}$  或  $C(=O)OR^{18}$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基或  $C_2-C_8$  炔氧基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0215] 实施方案 23b:实施方案 23a 中的化合物,其中  $R^2$  为 H。

[0216] 实施方案 23c:实施方案 23a 中的化合物,其中  $R^2$  为卤素。

[0217] 实施方案 23d:实施方案 23a 中的化合物,其中  $R^2$  为氰基、CHO、 $C(=O)R^{18}$  或  $C(=O)OR^{18}$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基或  $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0218] 实施方案 23e:实施方案 23d 的化合物,其中  $R^2$  为  $C(=O)OR^{18}$ ;或任选地被卤素取代的  $C_1-C_8$  烷基;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0219] 实施方案 23f:式 1 或实施方案 1-23e 中的任一项的化合物,其中在  $R^2$  定义中的  $R^{18}$  的实例独立地选自  $R^{18a}$ ;并且  $R^{18a}$  为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17a}$ ;

[0220]  $R^{17a}$  为卤素、 $OR^{11}$  或  $Z^{1c}Q^t$ ;并且  $Z^{1c}$  为直接键。

[0221] 实施方案 24:实施方案 23e 的化合物,其中  $R^2$  为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0222] 实施方案 24a:实施方案 24 的化合物,其中  $R^2$  为 3 元至 10 元环,所述环包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,并且任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0223] 实施方案 24b:实施方案 24a 的化合物,其中  $R^2$  的环为 5 元或 6 元。

[0224] 实施方案 24c:实施方案 24b 的化合物,其中  $R^2$  的环为 5 元,并且任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ 。

[0225] 实施方案 24d:实施方案 24b 的化合物,其中  $R^2$  的环为 6 元。

[0226] 实施方案 24e:式 1 或实施方案 1-24d 中的任一项的化合物,其中  $R^2$  的环或环系是部分不饱和的或芳族(包括杂芳族)。

[0227] 实施方案 24f:实施方案 24e 的化合物,其中  $R^2$  的环或环系是芳族(包括杂芳族)。

[0228] 实施方案 24h :式 1 或实施方案 1-24f 中的任一项的化合物,其中  $R^2$  的环或环系为碳环。

[0229] 实施方案 24i :式 1 或实施方案 1-24f 中的任一项的化合物,其中  $R^2$  的环或环系为杂环。

[0230] 实施方案 25 :实施方案 24i 的化合物,其中  $R^2$  为吡啶基、嘧啶基或噻唑基,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、 $SF_5$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$  和  $Z^1Q^t$ ,和  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_2-C_8$  烯硫基和  $C_2-C_8$  炔硫基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、 $OR^{11}$  和  $Z^1Q^t$ 。

[0231] 实施方案 25a :实施方案 24i 的化合物,其中  $R^2$  为吡啶基、嘧啶基、噻唑基或噻唑基,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素和  $C_1-C_4$  烷基。

[0232] 实施方案 25b :实施方案 25 的化合物,其中  $R^2$  为吡啶基、嘧啶基或噻唑基,各自任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素和  $C_1-C_4$  烷基。

[0233] 实施方案 25c :实施方案 25b 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被至少一个取代基取代的吡啶基,所述取代基独立地选自卤素和  $C_1-C_4$  烷基。

[0234] 实施方案 25d :实施方案 25c 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被卤素取代的吡啶基。

[0235] 实施方案 25e :实施方案 25d 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被 Cl 取代的吡啶基。

[0236] 实施方案 25f :实施方案 25e 的化合物,其中  $R^2$  为 6-氯-3-吡啶基。

[0237] 实施方案 26 :实施方案 25b 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被至少一个取代基取代的噻唑基,所述取代基独立地选自卤素或  $C_1-C_4$  烷基。

[0238] 实施方案 26a :实施方案 26 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被卤素取代的噻唑基。

[0239] 实施方案 26b :实施方案 26a 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被 Cl 取代的噻唑基。

[0240] 实施方案 26c :实施方案 26b 的化合物,其中  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

[0241] 实施方案 26d :实施方案 25b 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被  $C_1-C_4$  烷基取代的嘧啶基。

[0242] 实施方案 26e :实施方案 24i 的化合物,其中  $R^2$  为任选地被  $C_1-C_4$  烷基取代的 N-甲基吡啶基。

[0243] 实施方案 26f :实施方案 25b 的化合物,其中  $R^2$  为 6-氯-3-吡啶基或 2-氯-5-噻唑基。

[0244] 实施方案 26g :式 1 或实施方案 1-26f 中的任一项的化合物,其中每个  $R^{15}$  独立地为卤素、氰基、 $SF_5$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$  或  $Z^{1c}Q^t$ ;或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  炔硫基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17a}$ ;  $R^{17a}$  为卤素、 $OR^{11}$  或  $Z^{1d}Q^t$ ;  $Z^{1c}$  为直接键;并且  $Z^{1d}$  为直接键。

[0245] 实施方案 27 :式 1 或实施方案 1-26g 中的任一项的化合物,其中每个  $R^4$  和  $R^5$  独立

地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub> 或 SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub> 环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯氧基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔氧基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> 和 Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>。

[0246] 实施方案 27a：实施方案 27 的化合物，其中每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为 H 或卤素；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基，各自任选地被卤素取代。

[0247] 实施方案 27b：实施方案 27a 的化合物，其中每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为 H 或卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷氧基。

[0248] 实施方案 27c：实施方案 27b 的化合物，其中每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为 H 或卤素或 CH<sub>3</sub>。

[0249] 实施方案 27d：实施方案 27c 的化合物，其中每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 独立地为 H 或卤素。

[0250] 实施方案 27e：式 1 或实施方案 1-27d 中的任一项的化合物，其中每个 R<sup>5</sup> 为 H。

[0251] 实施方案 27f：实施方案 27e 的化合物，其中每个 R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H。

[0252] 实施方案 28：式 1 或实施方案 1-27f 中的任一项的化合物，其中每个 R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> 和 R<sup>8</sup> 独立地为 H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基。

[0253] 实施方案 29：实施方案 28A 的化合物，其中每个 R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> 和 R<sup>8</sup> 独立地为 H、CH<sub>3</sub>、C(=O)CH<sub>3</sub> 或 C(=O)OCH<sub>3</sub>。

[0254] 实施方案 30：式 1 或实施方案 1-29 中的任一项的化合物，其中每个 Z<sup>1</sup> 为直接键。

[0255] 实施方案 30a：式 1 或实施方案 1-29 中的任一项的化合物，其中每个 Z<sup>1</sup> 独立地为直接键或 O。

[0256] 实施方案 31：式 1 或实施方案 1-30 中的任一项的化合物，其中每个 R<sup>16</sup> 独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基烷基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰氧基和 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基。

[0257] 实施方案 32：式 1 或实施方案 1-31 中的任一项的化合物，其中 a 为 1。

[0258] 实施方案 33：式 1 或实施方案 1-32 中的任一项的化合物，其中每个 R<sup>24</sup> 独立地为 H、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

[0259] 实施方案 34：式 1 或实施方案 1-33 中的任一项的化合物，其中在每个 S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>24</sup>)<sub>z</sub> 实例中，当 z 为 1 时，则 u 为 1。

[0260] 实施方案 35：式 1 或实施方案 1-34 中的任一项的化合物，其中每个 Q<sup>i</sup> 和 Q<sup>t</sup> 独立地为苯基或吡啶基，各自任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基。

[0261] 实施方案 35a：式 1 或实施方案 1-34 中的任一项的化合物，其中每个 Q<sup>t</sup> 独立地为苯基或 5 元或 6 元杂芳环，各自任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub> 和 R<sup>16</sup>。

[0262] 实施方案 36：式 1 或实施方案 1-34 中的任一项的化合物，其中每个 Q<sup>t</sup> 独立地为苯

基、吡啶基或嘧啶基,各自任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基和  $C_1-C_4$  卤代烷氧基。

[0263] 值得注意的是式 1 或实施方案 1-36 中的任一项的化合物,包含所述化合物的组合和其用于防治无脊椎害虫的用途,其中 X 和 Y 为 0。

[0264] 本发明的实施方案,包括上文实施方案 1-36 以及本文所述的任何其它实施方案,可以任何方式组合,并且实施方案中的变量描述不仅涉及式 1 的化合物,还涉及可用于制备式 1 的化合物的起始化合物和中间体化合物。此外,本发明的实施方案,包括以上的实施方案 1-36 以及本文所述的任何其它实施方案,以及它们的任何组合,适用于本发明的组合和方法。

[0265] 实施方案 1-36 的组合可由以下示出:

[0266] 实施方案 A:式 1 的化合物,其中

[0267] X 为 0;

[0268] Y 为 0;

[0269] Z 为直接键、 $C(=X^1)$  或  $C(=X^1)E$ ;

[0270]  $X^1$  为 0;

[0271] E 为 0;

[0272] A 为  $C(R^{3c}) = C(R^{3d})$  或  $NR^{3e}$ ;

[0273]  $R^1$  为任选地被卤素取代的  $C_1-C_8$  烷基或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;

[0274]  $R^2$  为  $C(=O)OR^{18}$ ;或任选地被卤素取代的  $C_1-C_8$  烷基;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ ;

[0275]  $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{3c}$  独立地为 H 或卤素;

[0276]  $R^{3d}$  为卤素、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_1-C_8$  卤代烷基或  $C_1-C_8$  卤代烷氧基;或  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环,每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ,每个环任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基;

[0277]  $R^{3e}$  为  $C_1-C_4$  烷基;

[0278]  $R^4$  和  $R^5$  为 H;并且

[0279] a 为 1。

[0280] 实施方案 A1 : 实施方案 A 中的化合物, 其中

[0281]  $R^{3d}$  独立地为卤素、 $C_1-C_8$  烷基或  $C_1-C_8$  烷氧基 ; 或  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环, 每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N, 其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ , 并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ , 每个环任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基。

[0282] 实施方案 B : 实施方案 A1 中的化合物, 其中

[0283]  $R^1$  为苯基或 5 元或 6 元杂芳环, 各自任选地被至多 3 个取代基取代, 所述取代基独立地选自  $R^{14}$  ;

[0284]  $R^{14}$  为卤素、氰基、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=NOR^{21})R^{22}$  或  $Z^1Q^t$  ; 或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基或  $C_1-C_8$  烷硫基, 各自任选地被卤素取代 ;

[0285]  $R^{21}$  为  $C_1-C_4$  烷基 ;

[0286]  $R^{22}$  为  $C_1-C_4$  烷基 ;

[0287] Z 为直接键 ;

[0288] 每个  $Z^1$  独立地为直接键或 O ; 并且

[0289] 每个  $Q^t$  独立地为苯基或 5 元或 6 元杂芳环, 各自任选地被至多 5 个取代基取代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $C(=O)NR^{21}NR^{22}R^{23}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $S(=O)(=NR^{21})R^{22}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $R^{16}$ 。

[0290] 实施方案 B1 : 实施方案 B 中的化合物, 其中

[0291]  $R^1$  为任选地被至多 3 个取代基取代的苯基, 所述取代基独立地选自  $R^{14}$  ;

[0292]  $R^{14}$  为卤素、氰基、 $SF_5$ 、CHO、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $Z^1Q^t$  或  $Z^1Q^tZ^1Q^t$  ; 或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_2-C_8$  烯硫基或  $C_2-C_8$  炔硫基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立地选自  $R^{17a}$  ;

[0293]  $R^{17a}$  为卤素、 $OR^{11}$  或  $Z^1Q^t$  ;

[0294]  $R^2$  为吡啶基、嘧啶基或噻唑基, 各自任选地被至多 3 个取代基取

[0295] 代, 所述取代基独立地选自卤素、氰基、 $SF_5$ 、CHO、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $Z^1Q^t$  ; 或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_2-C_8$  烯硫基和  $C_2-C_8$  炔硫基, 各自为未取代的或被至少一个取代基取代的, 所述取代基独立

地选自卤素、OR<sup>11</sup> 和 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；

[0296] 每个 Z<sup>1</sup> 为直接键；并且

[0297] 每个 Q<sup>i</sup> 和 Q<sup>t</sup> 独立地为苯基或吡啶基，各自任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基。

[0298] 实施方案 C：实施方案 B1 中的化合物，其中

[0299] A 为 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>)；

[0300] Z 为直接键；

[0301] R<sup>14</sup> 为卤素或 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基，各自任选地被卤素取代；并且

[0302] R<sup>2</sup> 为吡啶基、嘧啶基或噻唑基，各自任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。

[0303] 实施方案 D：实施方案 C 中的化合物，其中

[0304] R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H；并且

[0305] R<sup>3d</sup> 为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

[0306] 实施方案 E：实施方案 A 中的化合物，其中

[0307] R<sup>1</sup> 为苯基或 6 元杂芳环，各自任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自 R<sup>14</sup>；

[0308] R<sup>14</sup> 为卤素、氰基、C(=NOR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup> 或 Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷硫基，各自任选地被卤素取代；

[0309] R<sup>21</sup> 为 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基；

[0310] R<sup>22</sup> 为 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基；

[0311] Z 为直接键；并且

[0312] 每个 Z<sup>1</sup> 为直接键。

[0313] 实施方案 F：实施方案 B 中的化合物，其中

[0314] R<sup>2</sup> 为吡啶基、嘧啶基、噁唑基或噻唑基，各自任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。

[0315] 实施方案 G：实施方案 F 的化合物，其中

[0316] R<sup>1</sup> 为苯基或吡啶基，各自任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自 R<sup>14</sup>；并且

[0317] 每个 Q<sup>t</sup> 独立地为苯基、吡啶基或嘧啶基，各自任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤代烷氧基。

[0318] 实施方案 H：实施方案 G 的化合物，其中

[0319] A 为 C(R<sup>3c</sup>) = C(R<sup>3d</sup>)；

[0320] R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H；并且

[0321] R<sup>3d</sup> 为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基。

[0322] 具体的实施方案包括式 1 的化合物，所述化合物选自：

[0323] 9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0324] 9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯



基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0325] 9-溴-3-(3-溴苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0326] 9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0327] 9-溴-3-[3-氯-2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0328] 9-氯-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0329] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0330] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0331] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0332] 9-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羟基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0333] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0334] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2,6-二氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0335] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3-[(三氟甲基)硫代]苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0336] 3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0337] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0338] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0339] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(4-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0340] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲氧基-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0341] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲氧基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0342] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-[2-甲氧基-5-(三氟甲氧基)苯基]-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

- [0343] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(2-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0344] 3-[3-氯-2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0345] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[4-[(三氟甲基)硫代]苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0346] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2,4-二氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0347] 3-(3-氯-2-氟苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0348] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0349] 7-溴-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-3-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0350] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-碘苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0351] 2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0352] 2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0353] 3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0354] 3-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0355] 3-[3-溴-5-(三氟甲氧基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0356] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0357] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0358] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-3-(3-碘-5-甲氧苯基)-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0359] 3-(3-溴苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0360] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-3-[3'-(三氟甲氧基)[1,1'-联苯]-3-基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；
- [0361] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2',5'-二氟[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟

基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0362] 3-[3-(6-氯-3-吡啶基)-5-(三氟甲氧基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0363] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2',4'-二氯[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

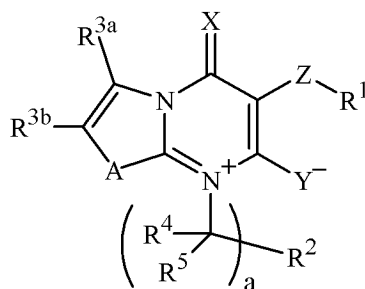
[0364] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[2,1-a]异喹啉鎓内盐内盐；和

[0365] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(3-乙烯基苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐；

[0366] 更多具体的实施方案包括式1的化合物，所述化合物选自：化合物编号113、118、125、137、183、190、191、196、229、231、254、257、272、289、296、299、307、308、315、343、344、352、363、364、368、381、385、421、433、435、448、449、450、451、462、482、490和493，其中所述化合物编号指的是在索引表A-E中的化合物。

[0367] 本发明的实施方案涉及式1的化合物（包括所有立体异构体）、其N-氧化物及其盐和包含它们的组合物以及它们用于防治无脊椎害虫的用途；

[0368]



1

[0369] 其中

[0370] X为O或S；

[0371] Y为O或S；

[0372] A为O、S、NR<sup>3e</sup>或C(R<sup>3c</sup>)=C(R<sup>3d</sup>)，前提条件是所述C(R<sup>3c</sup>)=C(R<sup>3d</sup>)部分为取向的，以便键合到R<sup>3d</sup>上的碳原子直接连接到式1的嘧啶鎓环上；

[0373] Z为直接键、O、S(O)<sub>n</sub>、NR<sup>6</sup>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(=X<sup>1</sup>)、C(=X<sup>1</sup>)E、EC(=X<sup>1</sup>)、C(=NOR<sup>8</sup>)或C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>)；

[0374] X<sup>1</sup>为O、S或NR<sup>9</sup>；

[0375] E为O、S或NR<sup>9a</sup>；

[0376] R<sup>1</sup>为H、卤素、氰基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>或C(=S)NH<sub>2</sub>；或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>和Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或3元至10元环或7元至11元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多4个

杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{14}$ ;前提条件是当  $R^1$  为卤素时,则  $Z$  为直接键、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $OC(R^7)_2$ 、 $C(=X^1)$ 、 $EC(=X^1)$ 、 $C(=NOR^8)$  或  $C(=NN(R^6)_2)$ ;

[0377]  $R^2$  为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$  或  $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$ ;或  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_3$ - $C_{10}$  环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6$ - $C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5$ - $C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_3$ - $C_8$  环烷氧基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2$ - $C_8$  烯氧基、 $C_2$ - $C_8$  炔氧基、 $C_1$ - $C_8$  烷硫基、 $C_1$ - $C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_8$  烷基磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷硫基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯硫基、 $C_2$ - $C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  炔硫基、 $C_2$ - $C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2$ - $C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ;或 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系,每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N,其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ,每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代,所述取代基独立地选自  $R^{15}$ ;

[0378]  $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $SF_5$ 、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ;或  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_3$ - $C_{10}$  环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6$ - $C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5$ - $C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_3$ - $C_8$  环烷氧基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2$ - $C_8$  烯氧基、 $C_2$ - $C_8$  炔氧基、 $C_1$ - $C_8$  烷硫基、 $C_1$ - $C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_8$  烷基磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷硫基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4$ - $C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯硫基、 $C_2$ - $C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  烯基磺酰基、 $C_2$ - $C_8$  炔硫基、 $C_2$ - $C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2$ - $C_8$  炔基磺酰基,各自为未取代的或被至少一个取代基取代的,所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ;或  $R^{3a}$  和  $R^{3b}$ 、或  $R^{3b}$  和  $R^{3c}$ 、或  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环,每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N,其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ,并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ,每个环任选地被至多 3 个取代基取代,所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、 $C_2$ - $C_4$  卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$  炔基、 $C_2$ - $C_4$  卤代炔基、 $C_3$ - $C_7$  环烷基、 $C_3$ - $C_7$  卤代环烷基、 $C_4$ - $C_8$  烷基环烷基、 $C_4$ - $C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4$ - $C_8$  环烷基烷基、 $C_4$ - $C_8$  卤代环烷基烷基、

$C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基；

[0379]  $R^{3e}$  为 H、羟基、氨基、CHO、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^tQ^t$ ；或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；或  $R^{3e}$  和  $R^{3b}$  与它们连接的相邻碳原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基；

[0380] 每个  $R^4$  和  $R^5$  独立地为 H、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、OCN、SCN、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$  或  $SO_2NH_2$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{12}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_8$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_3-C_6$  环烷氧基、 $C_4-C_8$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_6$  烯氧基或  $C_2-C_6$  炔氧基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ；

[0381] 每个  $R^6$ 、 $R^7$  和  $R^8$  独立地为 H；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ；

[0382] 每个  $R^9$  独立地为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$  和  $Si(R^{10})_3$ ；或

[0383] 每个  $R^{9a}$  独立地为 H；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、 $C_2-C_6$  烷基羰基或  $C_2-C_6$  烷氧基羰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独

立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>10</sup>、C(=O)OR<sup>11</sup>、C(=O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、OR<sup>11</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>10</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>和Si(R<sup>10</sup>)<sub>3</sub>；或

[0384] 每个R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>独立地为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；或苯基或5元或6元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烷氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>二烷氨基羰基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>三烷基甲硅烷基；

[0385] 每个R<sup>14</sup>独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、SF<sub>5</sub>、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、C(=S)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>18</sup>、C(=O)OR<sup>18</sup>、NHR<sup>18</sup>、NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、C(=O)NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、C(=S)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、OC(=O)R<sup>21</sup>、OC(=O)OR<sup>18</sup>、OC(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)R<sup>21</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)OR<sup>19</sup>、N(R<sup>21</sup>)C(=O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、OSO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、Si(R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>)、C(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NOR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NNR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>)R<sup>23</sup>、C(=NN(C(=O)R<sup>19</sup>)R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、C(=NN(C(=O)OR<sup>19</sup>)R<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、ON=CR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、ONR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、S(=O)(=NR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>C(=O)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、P(=X<sup>2</sup>)R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)(OR<sup>18</sup>)R<sup>19</sup>、OP(=X<sup>2</sup>)(OR<sup>18</sup>)OR<sup>19</sup>、N=CR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>、NR<sup>21</sup>N=CR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>C(=X<sup>2</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>C(=NR<sup>21</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>21</sup>C(=X<sup>2</sup>)NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、NR<sup>21</sup>NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>、Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>或Z<sup>1</sup>Q<sup>i</sup>Z<sup>1</sup>Q<sup>t</sup>；或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基、C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>环烷基环烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>烷基环烷基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基氧基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基亚磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷硫基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基亚磺酰基、C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>环烷基烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基亚磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基亚磺酰基或C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自R<sup>17</sup>；或

[0386] 在相邻环原子上的两个R<sup>14</sup>取代基与相邻环原子合在一起形成5元至7元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多3个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N，其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S)，并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)<sub>n</sub>，每个环任选地被至多3个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>

卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基；

[0387] 每个  $X^2$  独立地为 O 或 S；

[0388] 每个  $Z^1$  独立地为直接键、O、 $S(O)_n$ 、 $NR^6$ 、 $C(R^7)_2$ 、 $C(R^7) = C(R^7)$ 、 $C \equiv C$ 、 $C(R^7)_2O$ 、 $OC(R^7)_2$ 、 $C(=X^1)$ 、 $C(=X^1)E$ 、 $EC(=X^1)$ 、 $C(=NOR^8)$  或  $C(=NN(R^6)_2)$ ；

[0389] 每个  $Q^1$  独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ，每个环或环系任选地被至多 4 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $R^{16}$ ；

[0390] 每个  $Q^1$  独立地为 3 元至 10 元环或 7 元至 11 元环系，每个环或环系包含选自碳原子和至多 4 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 4 个 N，其中至多 3 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$ ，每个环或环系任选地被至多 5 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $C(=O)NR^{21}NR^{22}R^{23}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $S(=O)(=NR^{21})R^{22}$ 、 $Si(R^{10})_3$  和  $R^{16}$ ；

[0391] 每个  $R^{15}$  独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $SF_5$ 、OCN、SCN、CHO、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}NR^{22}R^{23}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $S(=O)(=NR^{21})R^{22}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ；或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；或

[0392] 在相邻环原子上的两个  $R^{15}$  取代基与相邻环原子合在一起形成 5 元至 7 元碳环或杂环，每个环包含选自碳原子和至多 3 个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多 2 个 O、至多 2 个 S 和至多 3 个 N，其中至多 2 个碳原子环成员独立地选自  $C(=O)$  和  $C(=S)$ ，并且所述硫原子环成员独立地选自  $S(=O)_n$ ，每个环任选地被至多 3 个取代基取代，所述取代基独立地选自卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_2-C_4$  烯基、 $C_2-C_4$  卤代烯基、 $C_2-C_4$  炔基、 $C_2-C_4$  卤代炔基、 $C_3-C_7$  环烷基、 $C_3-C_7$  卤代环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  卤代烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_4-C_8$  卤代环烷基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  卤代烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰基和  $C_2-C_6$  卤代烷基羰基；

[0393] 每个  $R^{16}$  独立地为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷硫基、 $C_1-C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基氨基、 $C_2-C_8$  二烷基氨基、 $C_3-C_6$  环烷基氨基、 $C_2-C_4$  烷氧基烷基、 $C_2-C_4$  烷基羰基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰氧基、 $C_2-C_6$  烷基羰硫基、 $C_2-C_6$  烷基氨基羰基、 $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基和  $C_3-C_6$  三烷基甲硅烷基；或苯基或 5 元或 6 元杂芳环，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_6$  环烯基、卤素、氰基、硝基、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷硫基、 $C_1-C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基氨基、 $C_2-C_8$  二烷基氨基、 $C_3-C_6$  环烷基氨基、 $C_2-C_4$  烷氧基烷基、 $C_2-C_4$  烷基羰基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_2-C_6$  烷基羰氧基、 $C_2-C_6$  烷基羰硫基、 $C_2-C_6$  烷基氨基羰基、 $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基和  $C_3-C_6$  三烷基甲硅烷基；

[0394] 每个  $R^{17}$  独立地为卤素、氰基、硝基、 $OH$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^{10}$ 、 $C(=O)OR^{11}$ 、 $C(=O)NR^{12}R^{13}$ 、 $OR^{11}$ 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 $SO_2NR^{12}R^{13}$ 、 $Si(R^{10})_3$  或  $Z^1Q^t$ ；

[0395] 每个  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  和  $R^{20}$  独立地为  $Q^t$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；

[0396] 每个  $R^{21}$ 、 $R^{22}$  和  $R^{23}$  独立地为  $Q^t$  或  $H$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_4-C_8$  烷基环烷基、 $C_4-C_8$  环烷基烷基、 $C_6-C_{10}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基或  $C_3-C_6$  环烯基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；

[0397] 每个  $R^{24}$  独立地为  $H$ 、氰基、 $OCN$ 、 $SCN$ 、 $CHO$ 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C(=O)R^{18}$ 、 $C(=O)OR^{18}$ 、 $NHR^{18}$ 、 $NR^{18}R^{19}$ 、 $C(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $C(=S)NR^{21}R^{19}$ 、 $SO_2NR^{21}R^{19}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $OC(=O)OR^{18}$ 、 $OC(=O)NR^{21}R^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)R^{21}$ 、 $N(R^{21})C(=O)OR^{19}$ 、 $N(R^{21})C(=O)NR^{21}R^{22}$ 、 $OSO_2R^{18}$ 、 $OSO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $NR^{21}SO_2R^{18}$ 、 $NR^{21}SO_2NR^{21}R^{22}$ 、 $Si(R^{18}R^{19}R^{20})$  或  $Z^1Q^t$ ；或  $C_1-C_8$  烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_3-C_{10}$  环烷基、 $C_4-C_{10}$  烷基环烷基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基、 $C_6-C_{14}$  环烷基环烷基、 $C_5-C_{10}$  烷基环烷基烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_3-C_8$  环烷氧基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷氧基、 $C_2-C_8$  烯氧基、 $C_2-C_8$  炔氧基、 $C_1-C_8$  烷硫基、 $C_1-C_8$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$  烷基磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷硫基、 $C_3-C_8$  环烷基亚磺酰基、 $C_3-C_8$  环烷基磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷硫基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基亚磺酰基、 $C_4-C_{10}$  环烷基烷基磺酰基、 $C_2-C_8$  烯硫基、 $C_2-C_8$  烯基亚磺酰基、 $C_2-C_8$  烯基磺酰基、 $C_2-C_8$  炔硫基、 $C_2-C_8$  炔基亚磺酰基或  $C_2-C_8$  炔基磺酰基，各自为未取代的或被至少一个取代基取代的，所述取代基独立地选自  $R^{17}$ ；

[0398] a 为 1、2 或 3；

[0399] 每个 n 独立地为 0、1 或 2；并且

[0400] 在每个  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$  的实例中，u 和 z 独立地为 0、1 或 2，前提条件是在每个  $S(=O)_u(=NR^{24})_z$  的实例中，u 和 z 的和 0、1 或 2；

[0401] 前提条件是当 A 为 O、S、 $NCH_3$  或  $C(R^{3c})=C(R^{3d})$ 、 $R^{3c}$  为 H 或 F，并且  $R^{3d}$  为 H、F、 $CF_2H$



或  $\text{CF}_3$  时, 则  $\text{R}^{3a}$  或  $\text{R}^{3b}$  中的至少一个不是 H。

[0402] 值得注意的是, 本发明的化合物的特征在于有利的新陈代谢和 / 或土壤残留模式, 并且表现出对农学和非农学无脊椎害虫的广谱防治活性。

[0403] 尤其值得注意的是, 由于对无脊椎害虫的广谱防治性和经济重要性, 因此通过防治无脊椎害虫来保护农作物免受无脊椎害虫的损害或损伤是本发明的实施方案。由于本发明的化合物在植株内有利的转移特性或体系性, 因此它们也同样保护没有与式 1 的化合物或包含所述化合物的组合物直接接触的叶片或其它植株部分。

[0404] 作为本发明的实施方案, 还值得注意的是组合物, 所述组合物包含任何前述实施方案以及本文所述任何其它实施方案中的化合物以及它们的任何组合, 和至少一种附加组分, 所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂, 所述组合物任选地还包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0405] 作为本发明的实施方案, 还值得注意的是用于防治无脊椎害虫的组合物, 所述组合物包含 (即以生物学有效量) 任何前述实施方案以及本文所述任何其它实施方案中的化合物以及它们的任何组合, 和至少一种附加组分, 所述附加组分选自表面活性剂、a 固体稀释剂和液体稀释剂, 所述组合物任选地还包含 (即以生物学有效量) 至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0406] 本发明的实施方案还包括用于保护动物的组合物, 所述组合物包含任何前述实施方案中的化合物 (即为杀寄生虫有效量) 和载体。

[0407] 本发明的实施方案还包括防治无脊椎害虫的方法, 所述方法包括使无脊椎害虫或其环境接触生物学有效量的任何前述实施方案中的化合物 (例如为本文所述的组合物)。尤其值得注意的是用于保护动物的方法, 所述方法包括向动物施用杀寄生虫有效量的任何前述实施方案中的化合物 (例如为本文所述的组合物)。

[0408] 本发明的实施方案还包括为浸壤液体制剂形式的包含任何前述实施方案中化合物的组合物。本发明的实施方案还包括防治无脊椎害虫的方法, 所述方法包括使土壤接触包含生物学有效量的任何前述实施方案中化合物的作为土壤浸液的液体组合物。

[0409] 本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的喷雾组合物, 所述组合物包含任何前述实施方案中的化合物 (即为生物学有效量) 和推进剂。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的饵料组合物, 所述组合物包含任何前述实施方案中的化合物 (即为生物学有效量)、一种或多种食物物料、任选的诱虫剂和任选的湿润剂。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的装置, 所述装置包括所述饵料组合物和适于容纳所述饵料组合物的外罩, 其中所述外罩具有至少一个开口, 所述开口的尺寸能够使无脊椎害虫通过, 以使无脊椎害虫能够从位于外罩外部的的位置触及所述饵料组合物, 并且其中所述外罩还适于放置在潜在或已知的无脊椎害虫活动场所之中或附近。

[0410] 本发明的实施方案还包括保护种子免受无脊椎害虫的侵害的方法, 所述方法包括使种子与生物学有效量的任何前述实施方案中的化合物还 (例如为本文所述的组合物)。

[0411] 本发明的实施方案还包括用于保护动物免受无脊椎寄生害虫的侵害的方法, 所述方法包括向所述动物施用杀寄生虫有效量的任何前述实施方案中的化合物。

[0412] 本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的方法, 所述方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐 (例如本文所述的组合

物)接触,前提条件是所述方法不是通过治疗对人或动物躯体进行药物处理的方法。

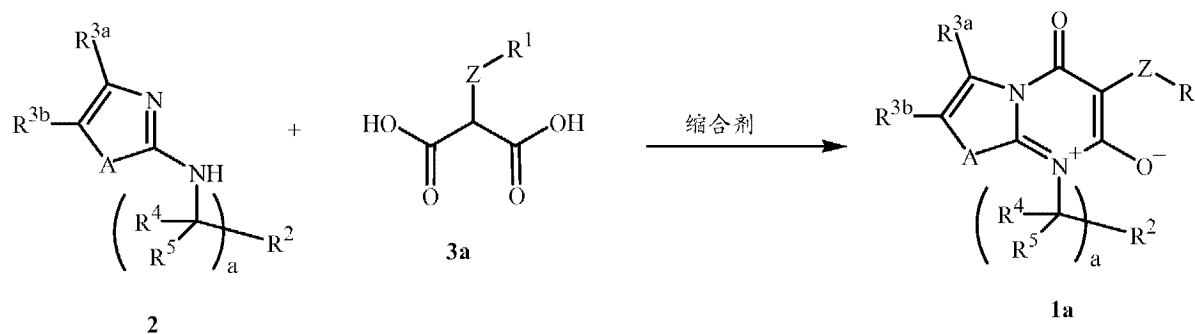
[0413] 本发明还涉及此类方法,其中使所述无脊椎寄生害虫或其环境接触一种组合物,所述组合物包含生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐和至少一种附加组分,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂,所述组合物还任选包含生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或试剂,前提条件是所述方法不是通过治疗对人或动物躯体进行药物处理的方法。

[0414] 可使用如方案 1-13 中所述的一种或多种下列方法和变型来制备式 1 的化合物。除非另外指明,下式 1-13 的化合物中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、X、Y、Z 和 A 的定义如上文发明概述中所定义。式 1a-1e 为式 1,的各种子集,并且除非另外指明,式 1a-1e 的所有取代基如上文式 1 中所定义。环境温度或室温定义为约 20-25°C。

[0415] 式 1a 的化合物(即式 1,其中 X 和 Y 为 O)可通过在缩合剂的存在下,适当被取代的式 2 的化合物与任选地被取代的丙二酸(3a)的缩合反应制得,如方案 1 所示。缩合剂可以是碳二亚胺,如二环己基碳二亚胺(参见例如 Koch, A. 等人的 Tetrahedron, 2004, 60, 10011-10018)或本领域熟知的在存在或不存在活化剂,如 N-羟基苯并三唑的情况下形成酰胺键的其它试剂,如 Science of Synthesis(2005, 21, 17-25)和 Tetrahedron(2005, 61, 10827-10852)中所述。此反应通常在惰性有机溶剂如二氯甲烷或 1,2-二氯乙烷中,在约 0°C 至约 80°C 的温度下实施 10 分钟至若干天时间。

[0416] 方案 1

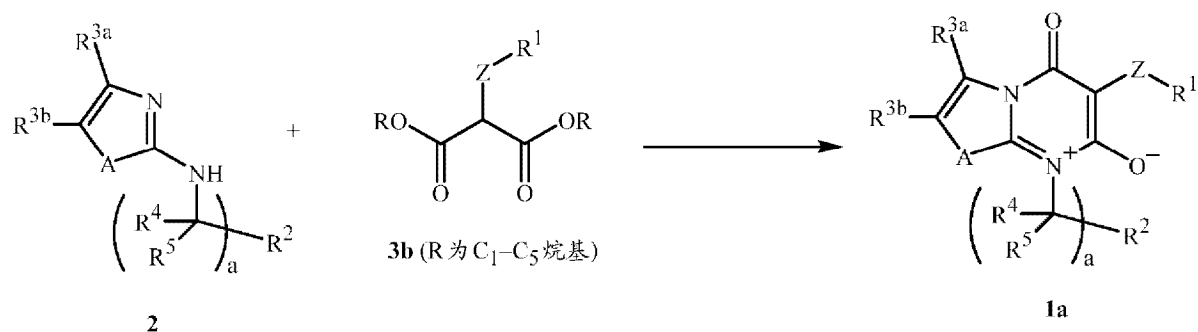
[0417]



[0418] 式 1a 的化合物还可由式 2 的化合物与丙二酸酯(3b)的缩合反应制备,其中 R 为  $C_1$ - $C_5$  烷基,如方案 2 所示。这些反应可无溶剂实施或在惰性溶剂的存在下实施,如 Bulletin of the Chemical Society of Japan(1999, 72(3), 503-509)中所述。惰性溶剂包括但不限于高沸点烃如三甲苯、萘满或异丙基苯,或高沸点醚如二苯基醚。典型的温度在 50°C 至 250°C 范围内。值得注意的是 150°C 至 200°C 的温度,其通常提供短反应时间和高收率。这些反应还可在相同的温度范围内,在微波反应器中实施。典型的反应时间在 5 分钟至若干小时范围内。

[0419] 方案 2

[0420]

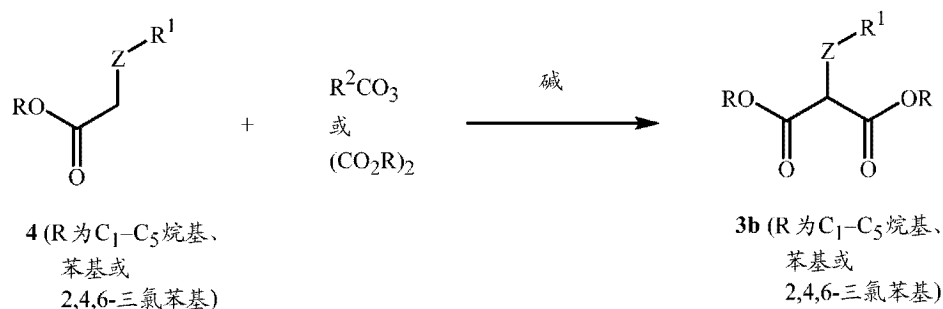


[0421] 式 3a 的化合物可通过本领域已知的多种方法制备, 例如通过式 3b 的化合物的碱水解反应。

[0422] 其中 Z 为直接键, 并且 R<sup>1</sup> 任选地被芳族 (包括杂芳族) 环或环系取代的式 3b 的化合物可通过钯催化由丙二酸酯芳基化制备 (使用式 R<sup>1</sup>X<sup>1</sup> 的化合物, 其中 X<sup>1</sup> 为 Cl、Br 或 I, 其实例存在于表 I-24a-24c) (J. Org. Chem, 2002, 67, 541-555) 或铜催化 (Org. Lett. 2002, 4, 269-272 和 Org. Lett. 2005, 7, 4693-4695)。作为另外一种选择, 式 3b 的化合物可通过在方案 2a 中示出的方法制备 (参见例如, J. Med. Chem 1982, 25 (6), 745-747)。

[0423] 方案 2a

[0424]

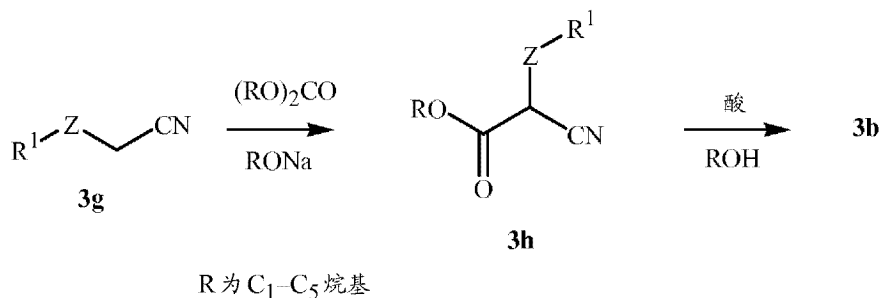


[0425] 式 4 的酯可通过本领域熟知的方法由相应的酸制备。其中 R 为 H 的许多式 4 的酸可商购获得或通过本领域已知的方法容易地制备 (实例列于表 I-1)。

[0426] 式 3b 的化合物还可按方案 2b 中示出的方法制备。式 3g 的腈类与二烷基羧酸酯的反应产生式 3h 的腈酯, 并且随后在醇的存在下酸性水解提供式 3b 的化合物 (参见例如 Helvetica Chimica Acta 1991, 74 (2), 309-314)。式 3g 的许多腈可商购获得, 或易于由本领域已知的方法制得。

[0427] 方案 2b

[0428]

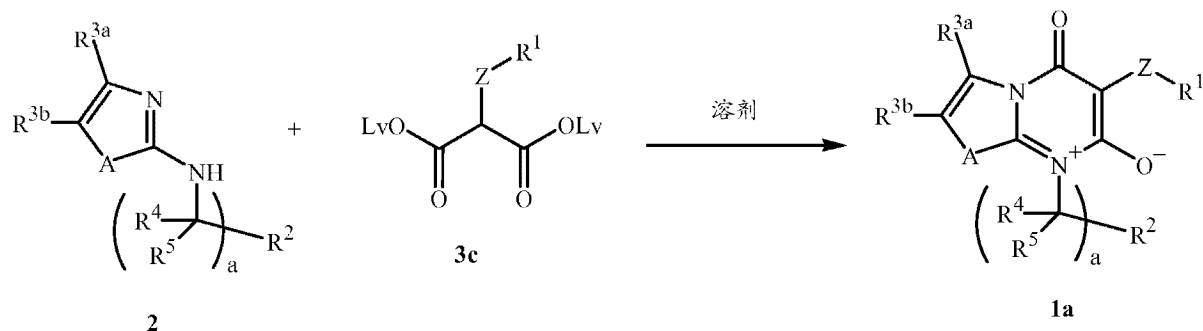


[0429] 式 1a 的化合物还可通过用式 3c 的活性酯 (其中 Lv0 为活性离去基团) 处理式 2 的化合物制得, 如方案 3 所示。优选易于合成或反应的 Lv 的实例为苯基、4-硝基

苯基或卤素取代的苯基（如 2,4,6-三氯苯基、五氯苯基或五氟苯基）如在 *Archiv der Pharmazie*(Weinheim, Germany)1991,324, 第 863-866 页中所述。其它活性酯是本领域熟知的并且包括但不限于 N-羟基琥珀酰亚胺酯（参见例如 *J. Am. Chem. Soc.* 2002,124, 6872-6878）。典型的温度在 50°C 至 200°C 范围内。值得注意的是 50°C 至 150°C 的温度，其通常提供短反应时间和高收率。这些反应可在存在或不存在溶剂如甲苯的情况下实施，并且可在相同的温度范围内，在微波反应器中实施。典型的反应时间在 5 分钟至 2 小时范围内。

## [0430] 方案 3

[0431]

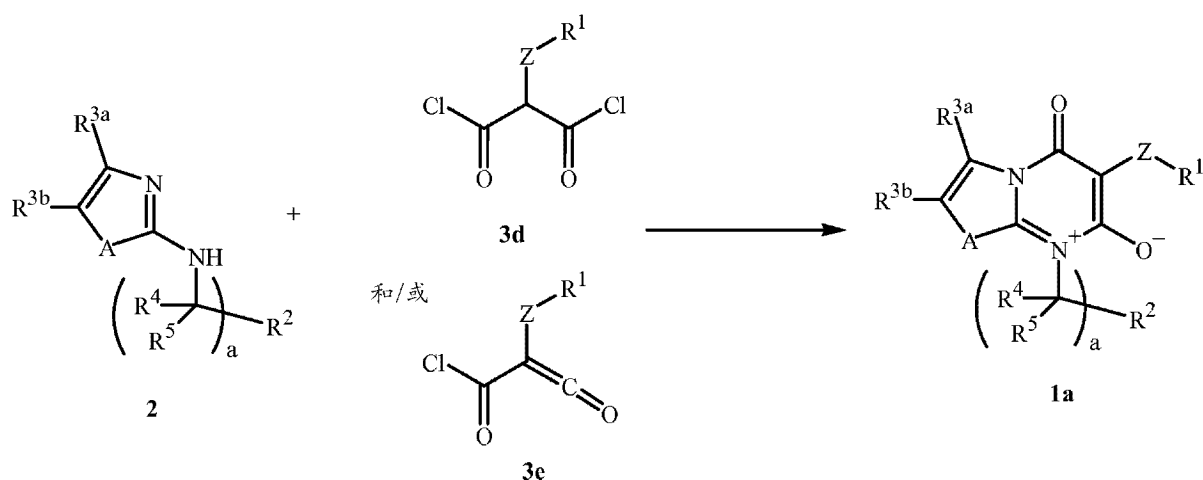


[0432] 式 3c 的化合物可由例如式 3a 的化合物制备（参见例如 *J. Het. Chem.* 1980,17, 337）。

[0433] 式 1a 的化合物还可通过式 2 的化合物与式 3d 或式 3e 的化合物的缩合反应制得，或可通过式 2 的化合物与式 3d 和式 3e 的化合物的混合物的缩合反应制得，如方案 4 所示。这些反应通常在惰性溶剂如二氯甲烷中实施，并且任选地在两当量或更多当量的酸受体的存在下实施（参见例如 *Zeitschrift für Naturforschung, Teil B: Anorganische Chemie, Organische Chemie*, 1982, 37B(2), 222-233）。典型的酸受体包括但不限于三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶和取代的吡啶和金属氢氧化物、碳酸盐和碳酸氢盐。

## [0434] 方案 4

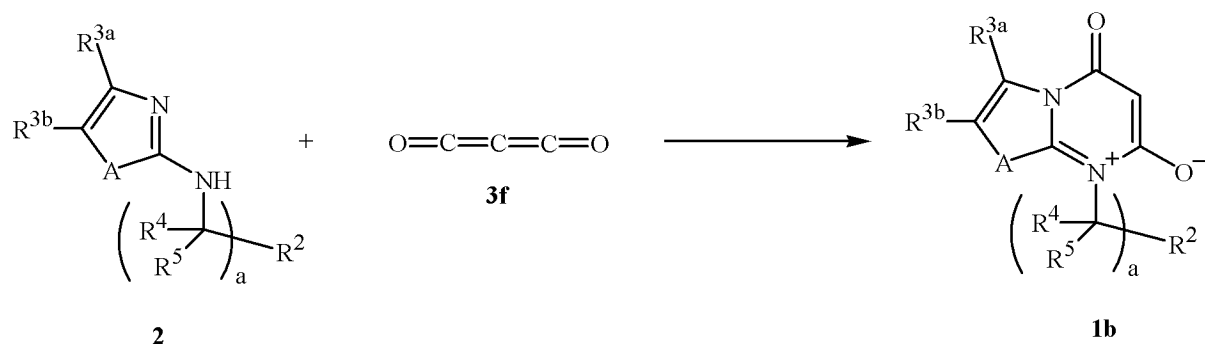
[0435]



[0436] 式 1b 的化合物（即式 1a 其中 Z 为直接键并且 R<sup>1</sup> 为 H）可通过式 2 的化合物与三氧化三碳 (3f) 的缩合反应制得（参见例如 *J. Org. Chem.* 1972, 37(9), 1422-1425），如方案 5 所示。所述反应通常在惰性溶剂如醚中实施，并且可包括使用催化剂如 AlCl<sub>3</sub>。

## [0437] 方案 5

[0438]



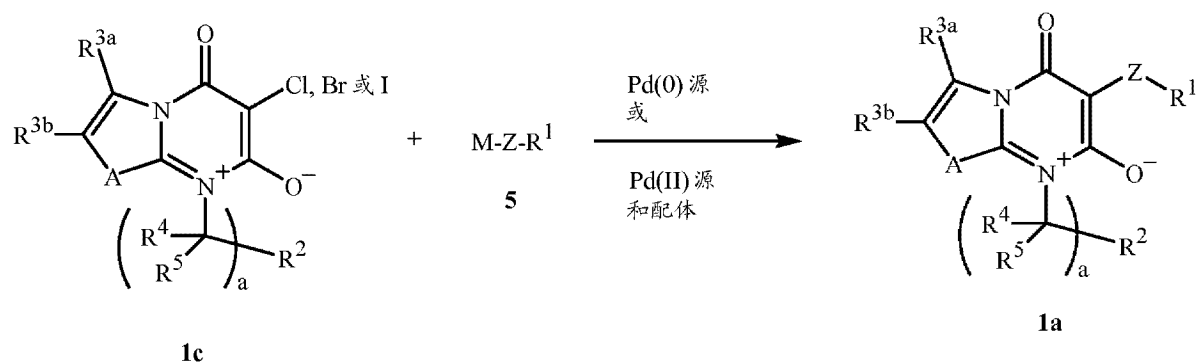
[0439] 式 2 的化合物可以本领域已知的多种方法制备；参见例如 Patai, S. 的 *The Chemistry of Functional Groups: The Chemistry of Amidines and Imidates*; Wiley: Chichester, UK, 1975; *The Chemistry of Amidines and Imidates*; Patai, S.; Rappoport, Z., Eds.; Wiley: Chichester, UK, 1991; 第 2 卷; Mega, T. 等人的 *Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1988, 61(12), 4315-4321; Ife, R. 等人的 *European Journal of Medicinal Chemistry* 1989, 24(3), 249-257; Wagaw, S.; Buchwald, S. *Journal of Organic Chemistry* 1996, 61(21), 7240-7241; Shen, Q. 等人的 *Angewandte Chemie, International Edition* 2005, 44(9), 1371-1375; 和 Okano, K. 的等人 *Organic Letters* 2003, 5(26), 4987-4990。

[0440] 本领域的技术人员将认识到式 2 的化合物在方案 1-5 的偶合方法中还可被用作它们的酸加成盐（如盐酸盐、乙酸盐）。

[0441] 其中 Z 为直接键并且 R<sup>1</sup> 为 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基或任选地被芳环或环系取代的式 1a 的化合物可由式 1c 的化合物（即式 1 其中 X 和 Y 为 O, Z 为直接键并且 R<sup>1</sup> 为 Cl、Br 或 I, 优选 Br 或 I）和，其中 R<sup>1</sup> 为 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 烯基或任选地被芳环或环系取代的式 5 的化合物制备，并且 M 与 Z-R<sup>1</sup> 形成硼酸、硼酸酯或三氟硼酸盐或 M 为三烷基锡或锌，并且 Z 为直接键，如方案 6 所示。

## [0442] 方案 6

[0443]

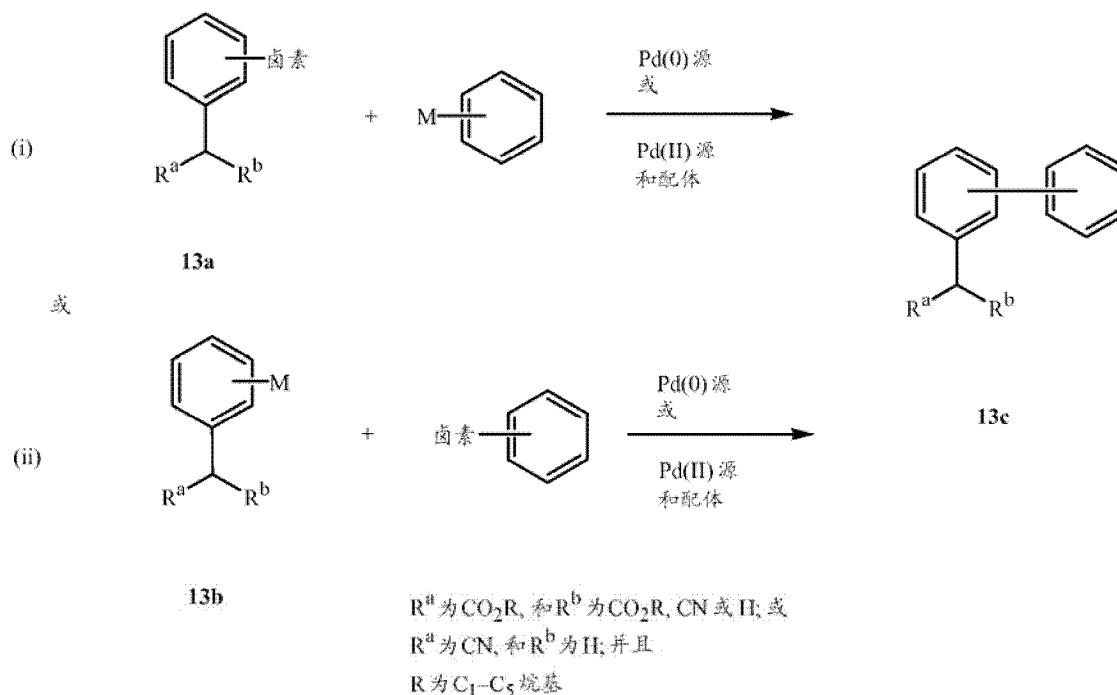


[0444] 以类似的方法，其中取代基（如 R<sup>1</sup> 或 R<sup>2</sup>）由两个直接键合的芳环或环系（如苯环键合到第二个苯环、苯环键合到吡啶环或吡啶环键合到第二个吡啶环）组成的式 1 化合物可通过两个适当取代的芳环或环系的钯催化的偶合制备。这些介于芳族氯化物、溴化物或碘化物和芳族硼酸或酯，或芳族锡或锌试剂之间的钯催化的偶合为人们所熟知并在本领域已被广泛地描述。例如参见方案 6a，其中式 13a 或 13b 的化合物与适当取代的苯环偶合以

提供式 13c 化合物的联苯。M 如上文关于方案 6 所定义。

[0445] 方案 6a

[0446]



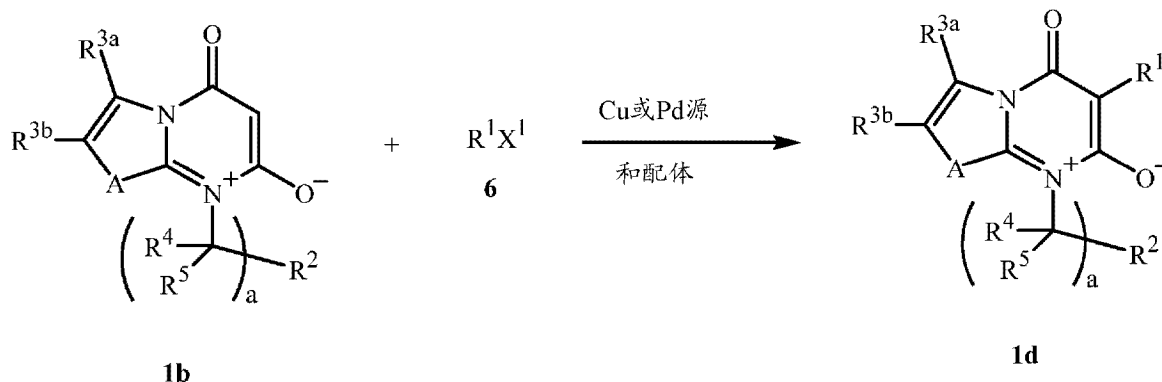
[0447] 这些偶合反应通常在钯催化剂和碱的存在下,任选在惰性气氛下实施。用于这些偶合反应中的钯催化剂通常包括 0 价 (即 Pd(0)) 或 2 价 (即 Pd(II)) 的形式氧化态钯。有多种此类含钯化合物和络合物可用作这些反应的催化剂。在方法中可用作催化剂的含钯化合物和络合物的实例包括  $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$  (双(三苯基膦)二氯化钯 (II))、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$  (四(三苯基膦)钯 (0))、 $\text{Pd}(\text{C}_5\text{H}_7\text{O}_2)_2$  (乙酰丙酮钯 (II))、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$  (三(二亚苄基丙酮)双钯 (0)) 和 [1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯 (II)。这些偶合方法一般在液相中实施,并因此所述钯催化剂优选地在所述液相中具有良好的溶解度。可用的溶剂包括例如水、醚,如 1,2-二甲氧基乙烷,酰胺,如 N,N-二甲基乙酰胺和未卤化的芳族烃,如甲苯。

[0448] 所述偶合方法可在宽泛的温度范围内实施,在约  $25^\circ\text{C}$  至约  $200^\circ\text{C}$  的范围内。值得注意的是约  $60^\circ\text{C}$  至约  $150^\circ\text{C}$  的温度,这通常提供快速的反应时间和高产物收率。芳基碘化物、溴化物或氯化物与芳基锡、芳基锌或芳基硼酸的相应 Stille、Negishi 和 Suzuki 偶合反应的一般方法和步骤是文献中熟知的;参见例如 E. Negishi 的 Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York。

[0449] 其中  $R^1$  任选地被芳环或环系取代的式 1d 的化合物 (即式 1 其中 X 和 Y 为 O, 并且 Z 为直接键) 可由式 1b 的化合物 (即式 1a 其中 Z 为直接键并且  $R^1$  为 H) 和其中  $X^1$  为 Cl、Br 或 I (优选 Br 或 I) 的式 6 化合物制备,如方案 7 所示。

[0450] 方案 7

[0451]



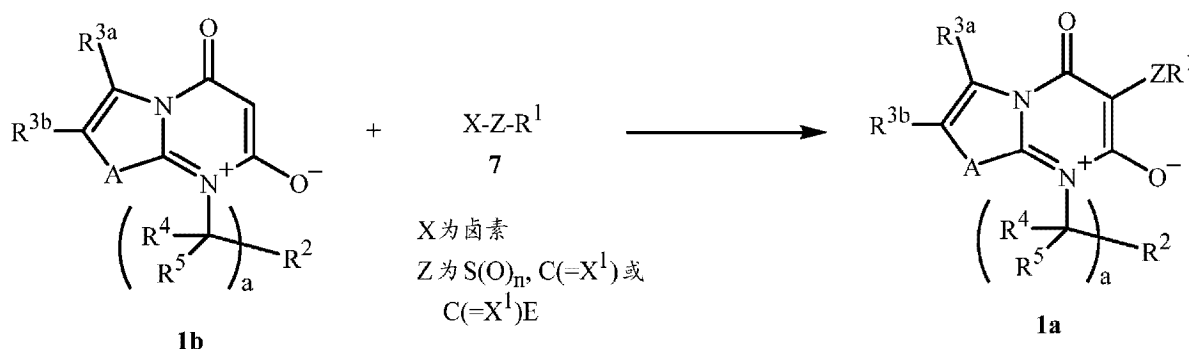
[0452] 这些反应通常在铜或钯催化剂的存在下,优选地在惰性气氛下实施。用于本发明的方法中的铜催化剂通常包括金属形式的铜(例如为粉末)或1价形式氧化态的铜(即Cu(I))。在方案7方法中可用作催化剂的含铜化合物的实例包括Cu、CuI、CuBr、CuCl。在方案7方法中可用作催化剂的含钯化合物的实例包括Pd(OAc)<sub>2</sub>。可用于方案7方法中的溶剂包括例如醚如1,4-二氧杂环己烷、酰胺如N,N-二甲基乙酰胺和二甲基亚砷。

[0453] 方案7的方法可在25°C至200°C的广泛温度范围内实施。值得注意的是40°C至150°C的温度。方案7的方法可在配体的存在下实施。有多种含铜化合物可用作本发明的方法的配体。可用配体的实例包括但不限于1,10-菲咯啉、N,N-二甲基乙二胺、L-脯氨酸和2-吡啶甲酸。铜催化的Ullmann型偶合反应的一般方法和步骤是文献中熟知的;参见例如Xie, Ma等人的Org. Lett. 2005, 7, 4693-4695。

[0454] 其中Z为S(O)<sub>n</sub>、C(=X<sup>1</sup>)或C(=X<sup>1</sup>)E的式1a化合物可由式1b的化合物通过用式7的化合物处理,任选地在路易斯酸催化剂的存在下(如FeCl<sub>3</sub>)制备,如方案8所示。可用于方案8方法中的式7化合物的实例包括但不限于亚磺酰基和磺酰基卤化物、羧酸、酸酐、酸的卤化物、氯甲酸酯、氨基羰基卤化物、异氰酸酯和异硫氰酸酯。通常,所述反应在惰性溶剂中实施,更典型在极性溶剂如N,N-二甲基乙酰胺或1-甲基-2-吡咯烷酮中实施。所述反应通常在0°C至180°C,更典型在环境温度至150°C的温度下实施。微波辐射在加热反应混合物方面是有利的。

[0455] 方案8

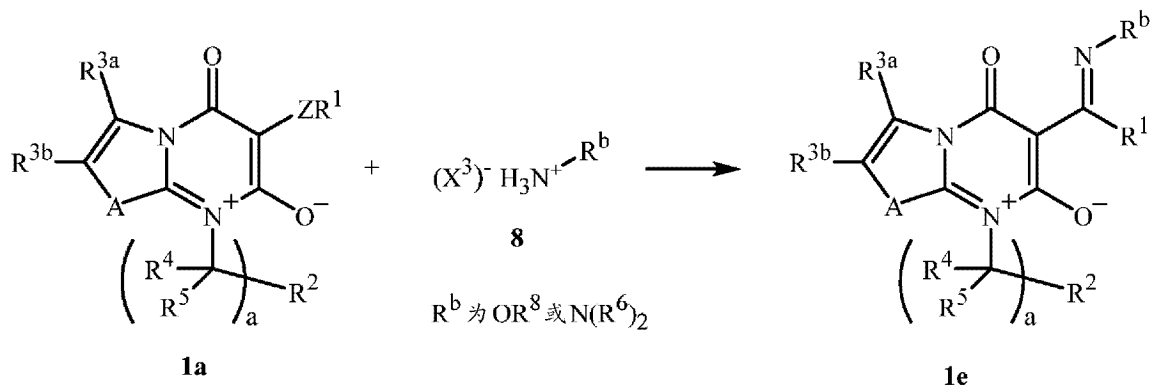
[0456]



[0457] 式1e的化合物(即式1a其中Z为C(=NOR<sup>6</sup>)或C(=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>)可通过将其中Z为C(=O)的式1a化合物与烷氧基胺或其中X<sup>3</sup>为诸如卤化物或草酸盐抗衡离子的式8的胍盐的反应制备,如方案9所示。所述反应可在醇溶剂如乙醇或丙醇中,在80°C至溶剂回流温度范围内的温度下,进行3至24小时。

[0458] 方案9

[0459]

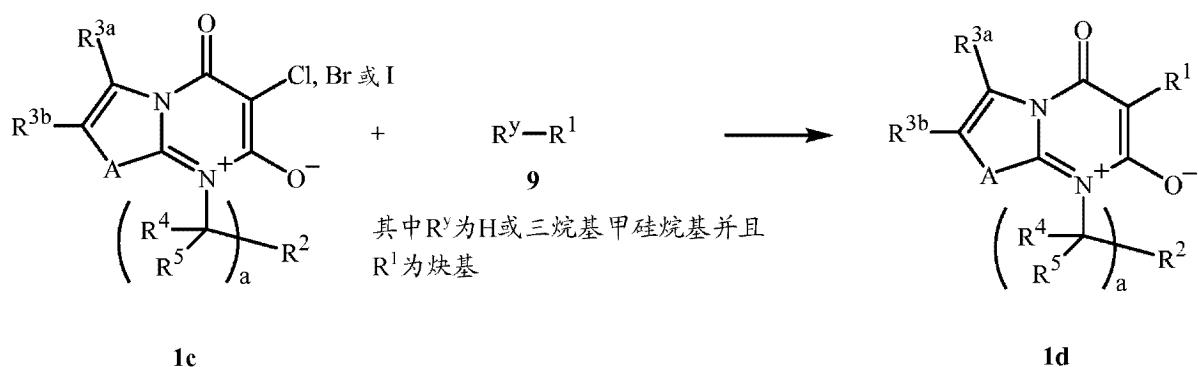


Z 为 C(=O)

[0460] 其中  $R^1$  为  $C_2-C_8$  炔基的式 1d 化合物可由式 1c 的化合物和式 9 取代的炔烃通过 Sonogashira 偶合反应制备, 如方案 10 所示。Sonogashira 偶合是文献中熟知的。参见例如, K. Sonogashira, *Sonogashira Alkyne Synthesis* 第 2 卷, 第 493 页, E. Negishi 的 *Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis*, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York。

[0461] 方案 10

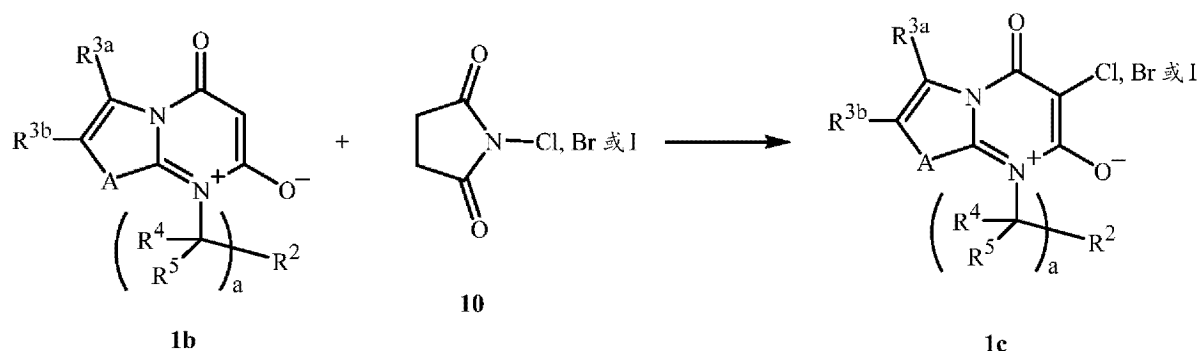
[0462]



[0463] 式 1c 的化合物可使用例如液溴或 N- 卤代琥珀酰亚胺 (10), 由式 1b 的化合物通过卤化制得, 如方案 11 所示。通常, 所述反应在惰性溶剂, 更典型在卤代溶剂如二氯甲烷或 1,2- 二氯乙烷中实施。所述反应通常在  $0^\circ C$  至  $80^\circ C$ , 更典型在环境温度下实施。

[0464] 方案 11

[0465]



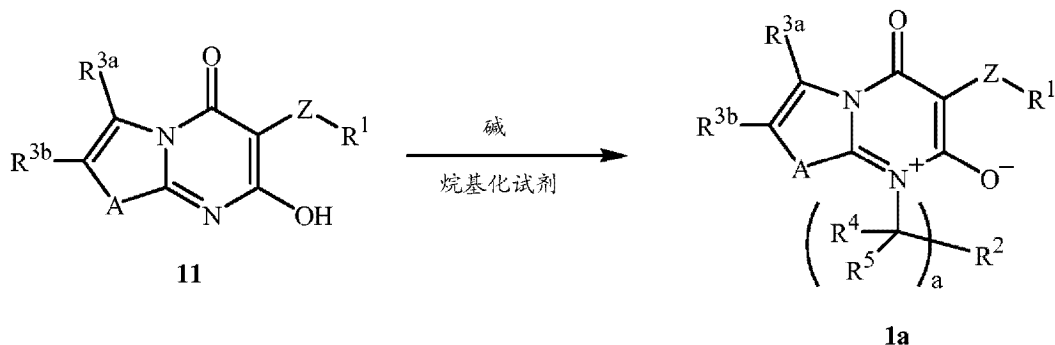
[0466] 式 1a 的化合物还可使用适当取代的烷基化试剂和碱, 如碳酸钾通过式 11 的化合物的烷基化反应制备, 如在方案 12 中所示 (参见例如, Kappe, T. 等人的 *Monatshefte für*



Chemie 1971, 102, 412-424 和 Urban, M. G. ; Arnold, W. 的 Helvetica Chimica Acta 1970, 53, 905-922)。烷基化试剂包括但不限于烷基氯化物、溴化物、碘化物以及磺酸酯。有多种碱和溶剂可用于方案 12 的方法中, 并且这些碱和溶剂是本领域熟知的。

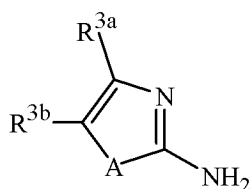
[0467] 方案 12

[0468]



[0469] 式 11 的化合物可通过式 2a 的化合物由类似于在方案 1 至 5 中示出的那些方法制备, 其中式 2 的化合物被式 2a 的化合物替代。式 2a 的化合物是可商购获得的, 或能够通过本领域熟知的一般方法制得。

[0470]



[0471] 用于制备式 2 的化合物尤其有用的方法示于方案 13 中。在方案 13 的方法中, 用合适的保护基如但不限于叔丁氧羰基、乙酰基或甲酰基保护式 2a 的化合物, 以形成式 2b 的中间体, 其中 PG 为保护基。然后将式 2b 的化合物与适当的式 12 的试剂 (其中 R<sup>4</sup> 或 R<sup>5</sup> 的至少一个为氢并且 X 为诸如卤素的离去基团) 烷基化以提供式 2c 的中间体。将保护基移除, 以获得式 2 的化合物。在胺官能团上形成和移除保护基的条件是文献中已知的 (参见例如 Greene, T. W.、Wuts, P. G. M. 的“Protective Groups in Organic Synthesis”第 2 版 (Wiley :New York, 1991)。

[0472] 尤其可用的式 2 的化合物的实例示于表 I-27 至 I-27g 和 I-29 中。式 2a 的化合物的一些实例示于表 I-28 至 I-28g 中。

[0473] 用于制备式 2 的化合物可供选择的方法是通过适当的羰基化合物的还原氨化。该方法示于合成实施例 1 的步骤 B 和步骤 C 以及合成实施例 5 的步骤 A 中。

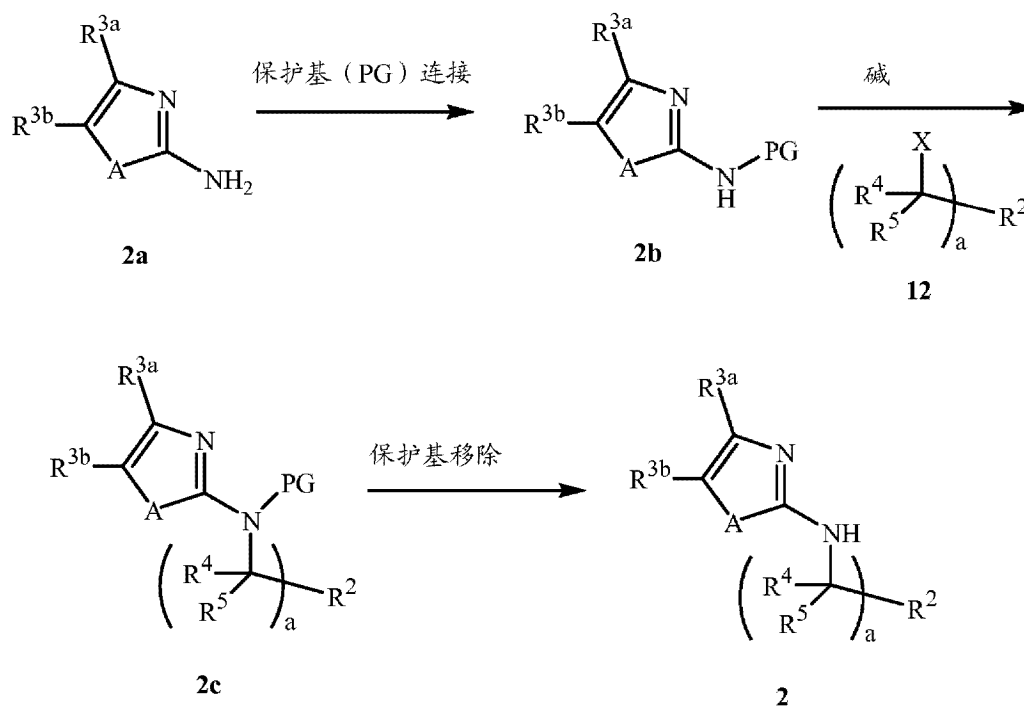
[0474] 用于制备式 2 的化合物另一个可供选择的方法是通过将适当取代的胺与类似于式 2a 化合物的卤素取代的杂芳族化合物 (即, 式 2a 化合物, 其中所述氨基被卤素替代) 在铜或钯催化剂的存在下反应。该方法示于合成实施例 2 步骤 A 中。

[0475] 式 2 的化合物还可以本领域已知的多种方法制备; 参见例如 Patai, S. 的 The Chemistry of Functional Groups: The Chemistry of Amidines and Imidates; Wiley :Chichester, UK, 1975; The Chemistry of Amidines and Imidates; Patai, S. ;

Rappoport, OZ., Eds.; Wiley: Chichester, UK, 1991; 第 2 卷; Mega, T. 等人的 Bulletin of the Chemical Society of Japan 1988, 61(12), 4315-4321; Ife, R. 等人的 European Journal of Medicinal Chemistry 1989, 24(3), 249-257; Wagaw, S.; Buchwald, S. Journal of Organic Chemistry 1996, 61(21), 7240-7241; Shen, Q. 等人的 Angewandte Chemie, International Edition 2005, 44(9), 1371-1375; 和 Okano, K. 的等人 Organic Letters 2003, 5(26), 4987-4990。

[0476] 方案 13

[0477]



[0478] 其中 Z 为 O 的式 1a 的化合物可通过适当取代的醇（如烷基醇或酚）与式 1c 化合物在 Cu 源的存在下（Ullmann 反应；例如参见 Hayashi, S.; Nakanishi, W. 的 Bulletin of the Chemical Society of Japan 2008, 81(12), 1605-1615）的反应制备。该 Cu 催化的反应通常在室温至 200℃，更典型在 100 至 150℃，并在诸如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮的溶剂中实施。作为另外一种选择，该方法可在 Pd 源的存在下实施（例如，参见 Buchwald, S. 等人的 Angew. Chem. Int. Ed. 2006, 45, 1-7）。该 Pd 催化的反应通常在室温至 200℃，更典型在 100 至 150℃，并在诸如 K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> 的碱的存在下，并且在诸如 2-二叔丁基膦基-2', 4', 6'-三异丙基联苯（即，二 t-BuXphos）配体的存在下，在诸如甲苯的惰性溶剂中实施。

[0479] 其中 Z 为 NR<sup>6</sup> 的式 1a 的化合物可通过适当取代的胺（如烷基胺或苯胺）与式 1c 的化合物在 Cu 源的存在下（Ullmann 反应；例如参见 Xu, H.; Yin, K.; Huang, W. 的 Chemistry—A European Journal 2007, 13(36), 10281-10293）的反应制备。该 Cu 催化的反应通常在室温至 200℃，更典型在 100 至 150℃，并在诸如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮的溶剂中实施。作为另外一种选择，该方法可在 Pd 源的存在下实施（例如，参见 Uchiyama, M. 等人的 J. Am. Chem. Soc. 2004, 126(28), 8755-8759）。该 Pd 催化的反应通常在室温至 200℃，更典型在 100 至 150℃，在诸如甲苯的惰性溶剂和诸如 NaO-t-Bu 的碱的存在

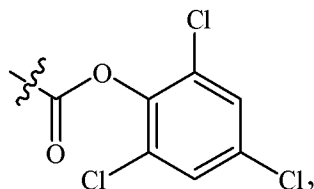
下实施

[0480] 式 1 的化合物 (其中 X 和 / 或 Y 为 S) 可通过本领域已知的一般方法, 由相应的式 1a 的化合物制得, 所述方法涉及用硫化剂如  $P_4S_{10}$  或 Lawesson 试剂 (2,4-二-(4-甲氧苯基)-1,3-二硫代-2,4-二磷杂环丁烷-2,4-二硫化物) 处理。作为另外一种选择, 可用  $P_2S_6(CH_3)_2$  处理式 3a 丙二酸, 如 J. Am. Chem. Soc. 1988, 110(4), 第 1316-1318 页中所述。然后可通过方案 1 的方法, 使用所得丙二酸硫衍生物来制备式 1 的化合物, 其中 X 和 / 或 Y 为 S。

[0481] 方案 1 至 13 示出了制备式 1 化合物的方法, 所述化合物具有多种用  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、X、Y、Z 和 A 指定的取代基。具有与方案 1 至 13 中具体指定的那些不同的  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、X、Y、Z 和 A 取代基的式 1 的化合物, 可由合成有机化学领域中已知的一般方法制得, 包括与方案 1 至 13 中所述的那些相类似的方法。

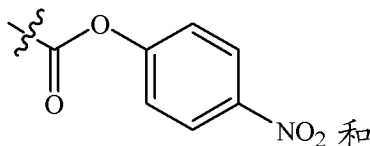
[0482] 可用于制备本发明的化合物的中间体的实例示于表 I-1 至 I-30 中。以下表中使用如下缩写: Me 代表甲基、Et 代表乙基、Pr 代表丙基、Ph 代表苯基、C(O)O(2,4,6-三氯苯基) 代表

[0483]



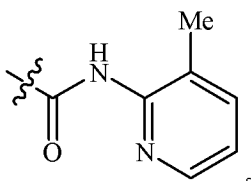
[0484] C(O)O(4-硝基苯基) 代表

[0485]



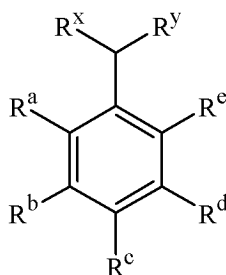
[0486] C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基) 代表

[0487]



[0488] 表 1

[0489]



[0490]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$  和  $R^e$  为 H

$R^a$	$R^a$	$R^a$	$R^a$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0491] <i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基

[0492] 苯基 | 3-氯苯基 | 2,4-二氟苯基 |

[0493] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

$R^b$	$R^b$	$R^b$	$R^b$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氟苯基	2,4-二氟苯基	

[0495]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^d$  和  $R^e$  为 H

$R^c$	$R^c$	$R^c$	$R^c$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基

[0497]	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0498] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 F ; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

[0499]	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0500] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 F ; R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

[0501]	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基

	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
[0502]	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0503] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 F ; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
[0505]	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0506] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 F ; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H

	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0507]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0508] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 Cl; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0509]	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基



[0510]	<i>t</i> -Bu CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr OPh CH=CH <sub>2</sub> C≡CH 苯基	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氰基 C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub> C(=NOMe)Me C(=NOEt)Me 2-氟苯基 3-氟苯基	6-氟-3-吡啶基 6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基 4,6-二氟-3-吡啶基 2-氟-6-氟-3-吡啶基 2,6-二氟-3-吡啶基 2-溴-5-氟-4-吡啶基 3-溴-5-氟苯基 3-氟-5-氟苯基 3-氟-4-氟苯基 2,4-二氟苯基 2,4-二氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基 2,5-二氟苯基 2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基 2-氟-5-氟苯基 2,5-二氟苯基 2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基 2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基 <i>N</i> -Me-4-吡唑基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
--------	--	--	--	---

[0511] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 Cl ; R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	R <sup>c</sup>	R <sup>c</sup>	R <sup>c</sup>	R <sup>c</sup>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氟苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氟苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氟苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0512]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氟-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氟-3-吡啶基	2-氟-5-氟苯基
	OMe	氰基	2,6-二氟-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氟-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氟-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氟苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氟苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氟苯基	2,4-二氟苯基	

[0513] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 Cl ; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

[0514]	R <sup>d</sup> H	R <sup>d</sup> O- <i>i</i> -Pr	R <sup>d</sup> 3-(CF <sub>3</sub> )苯基	R <sup>d</sup> 2-氟-4-氟基苯基
--------	---------------------	-----------------------------------	--	------------------------------

[0515]	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基	
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0516] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 Cl; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H

[0517]	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基	
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基	
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基	
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0518] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 OMe; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0520]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0521] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 OM<sup>e</sup>; R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$	$\underline{R}^c$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
[0522]	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基

[0523]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	<i>O-n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0524] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 OMe; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	<i>O-i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	<i>O-c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0525]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	<i>O-n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0526] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 OM<sup>e</sup>; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H

[0527] R<sup>e</sup> | R<sup>e</sup> | R<sup>e</sup> | R<sup>e</sup>

	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0528]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0529] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 Me; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
[0530]	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
[0531]	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0532]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^a$  为 Me;  $R^b$ 、 $R^d$  和  $R^e$  为 H

$R^c$	$R^c$	$R^c$	$R^c$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0533] <i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0534]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^a$  为 Me;  $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^e$  为 H

$R^d$	$R^d$	$R^d$	$R^d$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
[0535] Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基

[0536]	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0537] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>a</sup> 为 Me ; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H

	R <sup>e</sup>	R <sup>e</sup>	R <sup>e</sup>	R <sup>e</sup>
[0538]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基	
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基	
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0539] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>d</sup> 为 Cl ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 和 H

	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0540]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0541]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^d$  为 CF<sub>3</sub>;  $R^a$ 、 $R^c$  和  $R^e$  为 H

	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$	$\underline{R}^b$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
[0542]	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基



	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
[0543]	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0544] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>b</sup> 为 Br ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0545]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0546] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>b</sup> 为 OCF<sub>3</sub> ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
[0547]	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基

[0548]	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氟-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氟-3-吡啶基	2-氟-5-氟苯基
	OMe	氟基	2,6-二氟-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氟-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>m</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氟-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氟苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氟苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氟苯基	2,4-二氟苯基	

[0549] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>b</sup> 为 OMe ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
[0550]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氟苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氟苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氟苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氟-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氟-3-吡啶基	2-氟-5-氟苯基
	OMe	氟基	2,6-二氟-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氟-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>m</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氟-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氟苯基	3-Me-5-异噁唑基	
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氟苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氟苯基	2,4-二氟苯基		

[0551] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH ; R<sup>y</sup> 为 H ; R<sup>b</sup> 为 F ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

$R^d$	$R^d$	$R^d$	$R^d$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0553]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^b$  为 CN;  $R^a$ 、 $R^c$  和  $R^e$  为 H

$R^d$	$R^d$	$R^d$	$R^d$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0555]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0556] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>b</sup> 为 Me; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

[0557]	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟基苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0558] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>b</sup> 为 I; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

[0559]	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基

	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0560]	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氟苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0561] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 和 R<sup>b</sup> 为 F; R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0562]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氟苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0563] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 为 F; R<sup>b</sup> 为 Cl; R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0564]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0565]  $R^x$  为 C(O)OH;  $R^y$  为 H;  $R^c$  为 OMe;  $R^a$ 、 $R^b$  和  $R^e$  为 H

	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$	$\underline{R}^d$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0566]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基

[0567]	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0568] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>c</sup> 为 Me; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>
[0569]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0570] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>c</sup> 为 F; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>d</sup>
[0571]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基

	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
[0572]	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0573] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>c</sup> 为 Cl; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0574]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0575] R<sup>x</sup> 为 C(O)OH; R<sup>y</sup> 为 H; R<sup>a</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 F; R<sup>e</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H



	$R^b$	$R^b$	$R^b$	$R^b$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0576]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0577] 表 I-2

[0578] 表 I-2 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OMe。

[0579] 表 I-3

[0580] 表 I-3 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OEt。

[0581] 表 I-4

[0582] 表 I-4 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OPh。

[0583] 表 I-5

[0584] 表 I-5 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>。

[0585] 表 I-5a

[0586] 表 I-5 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)O(2,4,6-三氯苯基)。

[0587] 表 I-5b

[0588] 表 I-5 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)O(4-硝基苯基)。

[0589] 表 I-6

[0590] 表 I-6 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OH 并且 R<sup>y</sup> 为 C(O)OH。

[0591] 表 I-7

[0592] 表 I-7 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OH 并且 R<sup>y</sup> 为 C(O)OMe。

[0593] 表 I-8

[0594] 表 I-8 的构造与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OH 并且 R<sup>y</sup> 为 C(O)OEt。

[0595] 表 I-9

[0596] 表 I-9 与表 I-1 相同,不同的是 R<sup>x</sup> 为 C(O)OH 并且 R<sup>y</sup> 为 C(O)OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>。

- [0597] 表 I-10
- [0598] 表 I-10 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OH$  并且  $R^y$  为  $C(O)OPh$ 。
- [0599] 表 I-10a
- [0600] 表 I-10 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OH$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(2,4,6-三氯苯基)$ 。
- [0601] 表 I-10b
- [0602] 表 I-10 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OH$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(4-硝基苯基)$ 。
- [0603] 表 I-11
- [0604] 表 I-11 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)OMe$ 。
- [0605] 表 I-12
- [0606] 表 I-12 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)OEt$ 。
- [0607] 表 I-13
- [0608] 表 I-13 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)OC(CH_3)_3$ 。
- [0609] 表 I-14
- [0610] 表 I-14 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)OPh$ 。
- [0611] 表 I-14a
- [0612] 表 I-14 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(2,4,6-三氯苯基)$ 。
- [0613] 表 I-14b
- [0614] 表 I-14 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OPh$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(4-硝基苯基)$ 。
- [0615] 表 I-15
- [0616] 表 I-15 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)Cl$  并且  $R^y$  为  $C(O)Cl$ 。
- [0617] 表 I-16
- [0618] 表 I-16 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OMe$  并且  $R^y$  为  $C(O)OMe$ 。
- [0619] 表 I-17
- [0620] 表 I-17 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OEt$  并且  $R^y$  为  $C(O)OEt$ 。
- [0621] 表 I-18
- [0622] 表 I-18 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)OC(CH_3)_3$  并且  $R^y$  为  $C(O)OC(CH_3)_3$ 。
- [0623] 表 I-19
- [0624] 表 I-19 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)O(2,4,6-三氯苯基)$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(2,4,6-三氯苯基)$ 。
- [0625] 表 I-19a
- [0626] 表 I-19 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)O(4-硝基苯基)$  并且  $R^y$  为  $C(O)O(4-硝基苯基)$ 。
- [0627] 表 I-20
- [0628] 表 I-20 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)$  并且  $R^y$  为  $C(O)OH$ 。
- [0629] 表 I-21
- [0630] 表 I-21 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为  $C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)$  并且  $R^y$  为  $C(O)OMe$ 。

[0631] 表 I-22

[0632] 表 I-22 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为 C(O) (3- 甲基 -2- 吡啶基氨基) 并且  $R^y$  为 C(O) OEt。

[0633] 表 I-23

[0634] 表 I-23 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为 C(O) (3- 甲基 -2- 吡啶基氨基) 并且  $R^y$  为 C(O) OPh。

[0635] 表 I-23a

[0636] 表 I-23 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为 C(O) (3- 甲基 -2- 吡啶基氨基) 并且  $R^y$  为 C(O) O(2,4,6- 三氯苯基)。

[0637] 表 I-23b

[0638] 表 I-23 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为 C(O) (3- 甲基 -2- 吡啶基氨基) 并且  $R^y$  为 C(O) O(4- 硝基苯基)。

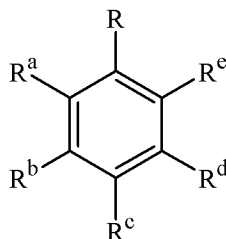
[0639] 表 I-24

[0640] 表 I-24 与表 I-1 相同,不同的是  $R^x$  为 C(O) (3- 甲基 -2- 吡啶基氨基) 并且  $R^y$  为 C(O) OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>。

[0641] 表 I-24a

[0642] 表 I-24a 与表 I-1 相同,不同的是在表 I-24a 标题下的化学结构被下列结构替代,并且 R 为 Cl。存在于表 I-1 中的  $R^x$  和  $R^y$  基团与表 I-24a 无关,由于在表 I-1 的结构中 CH( $R^x$ ) ( $R^y$ ) 部分被在表 I-24a 的结构中的 R 基团替代。

[0643]



[0644] 例如,在表 I-24a 中的第一个化合物为紧挨着上方所示的结构,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$  和  $R^e$  为 H,并且 R 为 Cl。

[0645] 表 I-24b

[0646] 表 I-24b 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 Br。

[0647] 表 I-24c

[0648] 表 I-24c 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 I。

[0649] 表 I-24d

[0650] 表 I-24d 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 CH<sub>2</sub>OH。

[0651] 表 I-24e

[0652] 表 I-24 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 CH<sub>2</sub>CN。

[0653] 表 I-24f

[0654] 表 I-24f 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 CH<sub>2</sub>Cl。

[0655] 表 I-24g

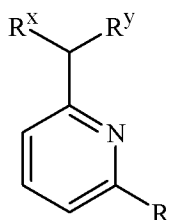
[0656] 表 I-24g 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为 CH(CN) CO<sub>2</sub>Me。

[0657] 表 I-24h

[0658] 表 I-24h 与表 I-24a 相同,不同的是 R 为  $\text{CH}(\text{CN})\text{CO}_2\text{Et}$ 。

[0659] 表 I-25

[0660]

[0661] R 为  $\text{CF}_3$ 

[0662]

<u>R<sup>x</sup></u>	<u>R<sup>y</sup></u>	<u>R<sup>x</sup></u>	<u>R<sup>y</sup></u>
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0663] R 为 H

[0664]

$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0665] R 为 Cl

[0666]

$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh

[0667]  $\underline{R}^x$  $\underline{R}^y$  $\underline{R}^x$  $\underline{R}^y$ H C(O)OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>

[0668] R 为 Br

[0669]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0670] R 为 I

[0671]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH

[0672]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0673] R 为 NH<sub>2</sub>

[0674]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0675] R 为 2-氯-4-(三氟甲基)苯基

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
[0676] C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh

[0677]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氟苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0678] R 为 2-氟-5-(三氟甲基)苯基

[0679]

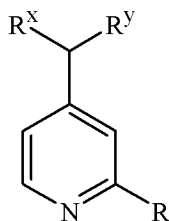
	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
	H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
	H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
	C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
	C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
	C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
	C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
	C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
	C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
	C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
			H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
[0680]	R 为 2-氯-4-氰基苯基			
	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
	H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
	H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
	C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
[0681]	C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
	C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
	C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
	C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
	C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
[0682]	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
	C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
			H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
[0683]	R 为 2-氟-4-氰基苯基			
[0684]				



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0685] 表 I-26

[0686]



[0687] R 为 H

[0688]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0689] R 为 CF<sub>3</sub>

[0690]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0691] R 为 F

[0692]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0693] R 为 Cl

[0694]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0695] R 为 Br

[0696]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0697] R 为 I

[0698]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt

[0699]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0700] R 为 NH<sub>2</sub>

[0701]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0702] R 为 2-氯-4-(三氟甲基)苯基

[0703]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH

[0704]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0705] R 为 2-氟-5-(三氟甲基)苯基

[0706]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0707] R 为 2-氯-4-氰基苯基

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
[0708] C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh

[0709]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

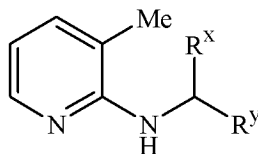
[0710] R 为 2-氟-4-氰基苯基

[0711]

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OH	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OMe	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)O(4-硝基苯基)	H	C(O)OH
C(O)O(4-硝基苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-三氯苯基)	C(O)(3-甲基-2-吡啶基氨基)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0712] 表 I-27

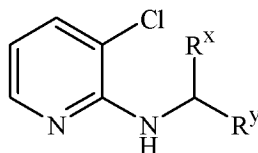
[0713]



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0716] 表 I-27a

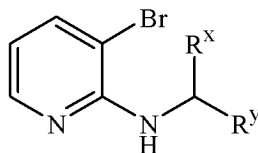
[0717]



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-噻唑基
[0718] Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-噻唑基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噻唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噻唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-噻唑基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-噻唑基

[0719] 表 I-27b

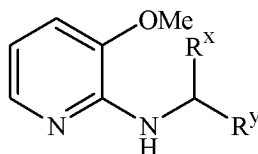
[0720]



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-噻唑基
[0721] Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-噻唑基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噻唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噻唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-噻唑基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-噻唑基

[0722] 表 I-27c

[0723]

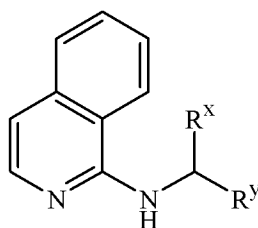




$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
[0724] Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0725] 表 I-27d

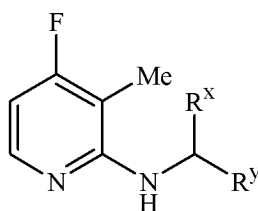
[0726]



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
[0727] H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
[0728] Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0729] 表 I-27e

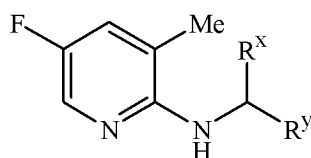
[0730]



$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	Me	2-氯-5-噻唑基
H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
[0731] Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0732] 表 I-27f

[0733]

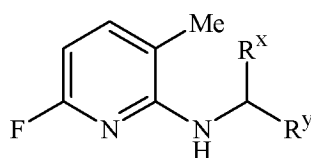


$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	H	2-氯-5-噻唑基
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	Me	2-氯-5-噻唑基
[0734] H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基

$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
[0735] H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0736] 表 I-27g

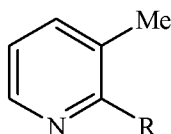
[0737]



	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	H	2-氯-5-噻唑基
	Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Cl	Me	2-氯-5-噻唑基
	H	Et	H	环丙基	H	1-甲基-4-吡唑基
	Me	Et	Me	环丙基	Me	1-甲基-4-吡唑基
[0738]	H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基	H	5-嘧啶基
	Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基	Me	5-嘧啶基
	H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基	H	2-溴-5-噻唑基
	Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基	Me	2-溴-5-噻唑基
	H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基	H	3-甲基-5-异噻唑基
	Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基	Me	3-甲基-5-异噻唑基
	H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基	H	2-甲基-5-嘧啶基
	Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0739] 表 I-28

[0740]

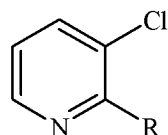


[0741]

$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$
F	Cl	Br	I	NH <sub>2</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>t</i> -Bu)
NHCHO	NHC(O)CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>i</i> -Pr)

[0742] 表 I-28a

[0743]

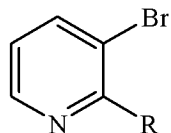


[0744]

$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$
F	Cl	Br	I	NH <sub>2</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>t</i> -Bu)
NHCHO	NHC(O)CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>i</i> -Pr)

[0745] 表 I-28b

[0746]

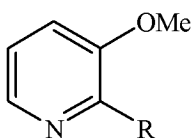


[0747]

$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$	$\underline{R}$
F	Cl	Br	I	NH <sub>2</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>t</i> -Bu)
NHCHO	NHC(O)CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH(CO <sub>2</sub> - <i>i</i> -Pr)

[0748] 表 I-28c

[0749]

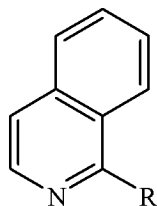


[0750]



[0751] 表 I-28d

[0752]

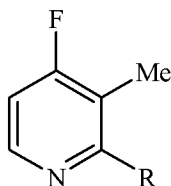


[0753]



[0754] 表 I-28e

[0755]

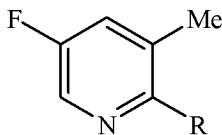


[0756]



[0757] 表 I-28f

[0758]

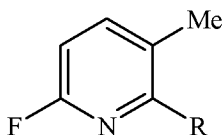


[0759]



[0760] 表 I-28g

[0761]

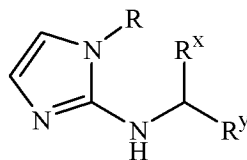


[0762]



[0763] 表 I-29

[0764]



[0765] R 为 Et

$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl
H	Et	H	环丙基
Me	Et	Me	环丙基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基
Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基
Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基
H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基
Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基
H	2-氯-5-噻唑基	H	2-溴-5-噻唑基
Me	2-氯-5-噻唑基	Me	2-溴-5-噻唑基
H	1-甲基-4-吡唑基	H	3-甲基-5-异噁唑基
Me	1-甲基-4-吡唑基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
H	5-嘧啶基	H	2-甲基-5-嘧啶基
Me	5-嘧啶基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

[0767] R 为 CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>

$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$	$\underline{R}^x$	$\underline{R}^y$
H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CHFCl
Me	CF <sub>3</sub>	Me	CH <sub>2</sub> CHFCl
H	Et	H	环丙基
Me	Et	Me	环丙基
H	3-吡啶基	H	6-甲基-3-吡啶基
Me	3-吡啶基	Me	6-甲基-3-吡啶基
H	6-氟-3-吡啶基	H	6-氯-3-吡啶基
Me	6-氟-3-吡啶基	Me	6-氯-3-吡啶基
H	6-溴-3-吡啶基	H	5-噻唑基

	$R^x$	$R^y$	$R^x$	$R^y$
	Me	6-溴-3-吡啶基	Me	5-噻唑基
	H	2-甲基-5-噻唑基	H	2-氟-5-噻唑基
	Me	2-甲基-5-噻唑基	Me	2-氟-5-噻唑基
[0769]	H	2-氯-5-噻唑基	H	2-溴-5-噻唑基
	Me	2-氯-5-噻唑基	Me	2-溴-5-噻唑基
	H	1-甲基-4-吡啶基	H	3-甲基-5-异噁唑基
	Me	1-甲基-4-吡啶基	Me	3-甲基-5-异噁唑基
	H	5-嘧啶基	H	2-甲基-5-嘧啶基
	Me	5-嘧啶基	Me	2-甲基-5-嘧啶基

## [0770] 表 I-30

	2-氯-6-(三氟甲基)吡啶	4-氯-2-(三氟甲基)吡啶
	2-溴-6-(三氟甲基)吡啶	4-溴-2-(三氟甲基)吡啶
	2-碘-6-(三氟甲基)吡啶	4-碘-2-(三氟甲基)吡啶
	4-氯-2-氟吡啶	2,4-二氯吡啶
[0771]	4-溴-2-氟吡啶	4-溴-2-氯吡啶
	2-氟-4-碘吡啶	2-氯-4-碘吡啶
	2-溴-4-氯吡啶	
	2,4-二溴吡啶	
	2-溴-4-碘吡啶	

[0772] 应认识到,上述用于制备式 1 的化合物的某些试剂和反应条件可能不与中间体中存在的某些官能团相容。在这些情况下,将保护 / 去保护序列或官能团互变引入到合成中将有助于获得所需的产物。保护基的使用和选择对化学合成领域的技术人员来讲将是显而易见的(参见例如 Greene, T. W.、Wuts, P. G. M. 的“Protective Groups in Organic Synthesis”第 2 版(Wiley :New York, 1991)。本领域的技术人员将认识到,在一些情况下,在按照任何单独方案中的描述引入指定试剂后,可能需要实施没有详细描述额外常规合成步骤以完成式 1 的化合物的合成。本领域的技术人员还将认识到,可能需要以与制备式 1 的化合物时所示的具体顺序不同的顺序来实施上文方案中示出的步骤的组合。

[0773] 本领域的技术人员还将认识到,本文所述的式 1 的化合物和中间体可经历各种亲电反应、亲核反应、自由基反应、有机金属反应、氧化反应和还原反应,以引入取代基或修饰现有的取代基。

[0774] 无需进一步详尽说明,据信本领域的技术人员使用以上所述内容可将本发明利用至最大限度。因此,以下合成实施例应理解为仅是例证性的,而不以任何方式限制本发明的公开内容。以下合成实施例中的步骤示出了整个合成转化中每个步骤的过程,并且用于每个步骤的原料不必由在其它实施例或步骤中描述的具体制备步骤制得。环境温度或室温定义为约 20-25°C。百分比均按重量计,除非是色谱溶剂混合物或除非另外指明。色谱溶剂混合物的份数和百分比均按体积计,除非另外指明。MPLC 是指在硅胶上的中压液相色谱。以距四甲基硅烷的低场 ppm 数为单位记录  $^1\text{H}$  NMR 光谱;“s”表示单峰,“d”表示双重峰,“dd”表示双重双重峰,“ddd”表示两个双重双重峰,“t”表示三重峰,“m”表示多重峰,并且“br s”表示宽的单峰。就质谱数据而言,记录的数值是采用大气压化学电离(AP<sup>+</sup>),由质谱观测到的 H<sup>+</sup>(分子量为 1)加在所述分子上获得 M+1 峰所形成的母分子离子的分子量(M)。

[0775] 合成实施例 1

[0776] 1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-9-苯基-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐(化合物编号 68)的制备

[0777] 步骤 A:2-氨基-3-苯基吡啶的制备

[0778] 在微波小瓶中装满 2-氨基-3-溴吡啶 (0.5g, 2.9mmol)、苯基硼酸 (0.52g, 4.3mmol)、碳酸氢钠 (0.31g, 2.9mmol)、二氯双(三苯基膦)钯(II) (0.1g, 0.14mmol)、二氧六环 (5mL) 和水 (1mL)。封端所述小瓶, 并将反应混合物在 150°C 下加热 10 分钟。然后冷却所述反应混合物, 用水 (10mL) 淬灭, 并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机相经过 MgSO<sub>4</sub> 干燥并浓缩至留下黑色的油。使用 10-40% 乙酸乙酯/己烷作为洗脱液, 在硅胶上通过色谱法来纯化粗产物, 获得白色固体状标题化合物 (0.35g)。

[0779] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 8.10 (d, 1H), 7.46 (m, 4H), 7.38 (m, 2H), 6.75 (m, 1H), 4.50-4.55 (br s, 2H)。

[0780] 步骤 B:N-[(2-氯-5-噁唑基)亚甲基]-3-苯基-2-吡啶胺的制备

[0781] 在室温下, 将 2-氨基-3-苯基吡啶 (即步骤 A 中的产物, 0.342g, 2.01mmol) 加入到 2-氯-1,3-噁唑-5-甲醛 (0.296g, 2.01mmol) 的二氯甲烷 (10mL) 中。将悬浮液搅拌 10 分钟, 然后真空浓缩至干。将所得残余物在配备不可返回式防爆沸球的旋转蒸发器上加热至 90°C 20 分钟, 以有利于除水。所述残余的黄色固体再溶解于二氯甲烷 (10mL) 中, 在旋转蒸发器上再加热至 90°C 20 分钟。此时, 通过 NMR 检查所述黄色固体验证反应完全。获得黄色固体状标题化合物, 并且被用于下一步骤而无需进一步纯化。

[0782] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 9.29 (s, 1H), 8.45 (m, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.50-7.35 (m, 5H), 7.30-7.25 (m, 1H)。

[0783] 步骤 C:N-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-苯基-2-吡啶胺的制备

[0784] 将 N-[(2-氯-5-噁唑基)亚甲基]-3-苯基-2-吡啶胺 (即步骤 B 中的产物) 分批加入至搅拌的过量硼氢化钠 (0.379g, 10.0mmol) 的甲醇 (8mL) 中。在加料完成后, 使反应混合物在环境温度下搅拌 5 分钟。通过加入冰醋酸淬灭过量的还原剂, 直至气体停止逸出。加入水 (20mL); 并且浓缩所述反应混合物以移除甲醇。用乙酸乙酯萃取所得水相两次, 并且将合并的有机相经过 MgSO<sub>4</sub> 干燥并浓缩, 获得黄色固体状标题化合物 (0.659g)。

[0785] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 8.2 (d, 1H), 7.5-7.3 (m, 7H), 6.8-6.7 (m, 1H), 5.0-4.9 (br s, 1H), 4.68 (d, 2H)。

[0786] 步骤 D:1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-9-苯基-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的制备

[0787] 将 N-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-苯基-2-吡啶胺 (即步骤 C 中的产物, 100mg, 0.33mmol) 和 2-苯基丙二酸-1,3-双(2,4,6-三氯苯基)酯 (246mg, 0.398mmol) 溶解于甲苯 (10mL) 并在 85°C 下加热过夜。然后将反应混合物倾倒在硅胶柱上, 用 50-100% 乙酸乙酯的己烷洗脱, 获得黄色固体状标题化合物 (63mg), 即, 本发明的化合物。

[0788] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 9.60 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.85-7.75 (m, 2), 7.55 (m, 3H), 7.5-7.4 (m, 4H), 7.1 (dd, 1H), 6.84 (s, 1H), 5.1-5.25 (brs, 2H)。

[0789] 合成实施例 2

[0790] 1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡

啉并 [1,2-a] 嘧啶鎓内盐 (化合物编号 30) 的制备[0791] 步骤 A :N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-甲基-2-吡啶胺的制备

[0792] 将 2-氨基-3-甲基吡啶 (2.16g, 20mmol) 和 2-氯-5-(氯甲基)噻唑 (1.68g, 10mmol) 于 N-甲基吡咯烷酮 (10mL) 中的混合物在 180°C 下, 在微波反应器中加热 10 分钟。将冷却的反应混合物倾入饱和碳酸氢钠水溶液中并用乙酸乙酯萃取。分离所述有机层, 用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤, 经过 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 干燥并减压浓缩。所述残余物通过色谱层析在硅胶上纯化, 用 10% 乙酸乙酯的己烷洗脱, 获得油状标题化合物 (2.0g)。

[0793] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 8.07(d, 1H), 7.43(s, 1H), 7.26(d, 1H), 6.63(dd, 1H), 4.77(d, 2H), 4.54(brs, 1H)。

[0794] 步骤 B :2-(2-氟苯基)丙二酸-1,3-双(2,4,6-三氯苯基)酯的制备

[0795] 向 2-(2-氟苯基)丙二酸 (0.60g, 3mmol, 由 Eur. J. Biochem. 1992, 210, 475 中所述的方法制备) 的二氯甲烷 (5mL) 溶液加入草酰氯 (0.65mL, 7.5mmol) 和一滴 N,N-二甲基甲酰胺。所述反应混合物在室温下搅拌 1h。然后加入 2,4,6-三氯苯酚 (1.47g, 7.5mmol), 并且所述反应混合物在室温下搅拌过夜。减压浓缩所述反应混合物, 并且所述粗制的残余物用少量的冷的甲醇磨碎, 获得白色固体状标题化合物 (1.1g)。

[0796] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 7.73(m, 1H), 7.42(m, 1H), 7.37(s, 2H), 7.24(m, 1H), 7.19(t, 1H), 5.72(s, 1H)。

[0797] 步骤 C :1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并 [1,2-a] 嘧啶鎓内盐的制备

[0798] N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-甲基-2-吡啶胺 (即步骤 A 中的产物, 100mg, 0.4mmol) 和 2-(2-氟苯基)丙二酸-1,3-双(2,4,6-三氯苯基)酯 (即步骤 B 中的产物, 300mg, 0.5mmol) 于甲苯 (1mL) 中的溶液在 70°C 下加热 1h。然后冷却并过滤反应混合物, 并且过滤出的固体用少量的乙醚研成粉末, 获得黄色固体状标题产物, 即, 本发明的化合物 (60mg)。

[0799] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 9.52(d, 1H), 8.01(dd, 1H), 7.58(t, 1H), 7.37(t, 1H), 7.1-7.35(m, 4H), 5.62(s, 2H), 2.84(s, 3H)。

[0800] 合成实施例 2a[0801] 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并 [1,2-a] 嘧啶鎓内盐 (化合物编号 30) 的可供选择的制备[0802] 步骤 A :α-氰基-2-氟苯基乙酸甲酯的制备

[0803] 在氮气氛下, 将甲醇钠 (51.84g) 加入至于 1L 反应器中干燥的甲苯 (815mL) 中。将反应混合物加热至 75°C, 然后在 70-74°C 下, 经过 45 分钟的时间加入 2-氟苯乙腈 (100g) 于碳酸二甲酯 (131.64g) 中的混合物。所述反应混合物被进一步保持在该温度 (70-75°C) 下另外的 4.5 小时。然后将反应混合物冷却至 25-30°C, 并用加料漏斗在 10-15°C 加入 HCl (110g, 35.2 重量%) 用水稀释 (300mL) 的混合物。分离出所得层, 并且用乙酸乙酯 (2×200mL) 萃取水层。将合并的有机层用水 (2×200mL) 洗涤, 经过硫酸钠干燥并减压浓缩, 获得棕色油状液体标题化合物 (138.8g, 94.8% 收率)。

[0804] 步骤 B :2-(2-氟苯基)丙二酸-1,3-二甲酯的制备

[0805] 在氮气氛下, 将 α-氰基-2-氟苯基乙酸甲酯 (135g) 加入至于 1L 反应器中的甲醇



(675g) 中。将反应混合物冷却至 0°C, 并经过 45 分钟的时间缓慢加入亚硫酸氯 (240.47g)。将所述反应混合物加热至 45°C 19 小时, 并且反应的进程通过 HPLC 监测。然后将反应混合物冷却至 30°C, 并在 45-47°C 减压下浓缩。将残余物溶解于水 (300mL) 并用乙酸乙酯 (2×300mL) 洗涤。将合并的有机层用水 (2×300mL) 洗涤, 经过硫酸钠干燥并减压浓缩至干, 获得标题化合物 (152.2g, 95.9% 收率)。

[0806] 步骤 C: 2-(2-(三氟甲氧基)苯基)丙二酸的制备

[0807] 将氢氧化钠 (117.11g 的 50% 水溶液) 加入到水中 (160.5g), 并将所述溶液冷却至 10-15°C。加入四甲基氯化铵 (4.88g), 随后在 10-15°C 下, 经过 30 分钟的时间滴加 2-(2-氟苯基)丙二酸-1,3-二甲酯 (150g)。在添加完毕后, 将反应的温度缓慢升至 30°C, 并保持在 27-32°C。所述反应物料变成浓厚的浆液, 并加入水 (25g) 以改善搅拌。可通过 HPLC 监测反应进程。在搅拌 2 小时后, 在 5-10°C 下, 经过 30 分钟的时间, 向反应混合物中加入 HCl (231g) 和水 (150mL) 的溶液。将所述混合物的 pH 调节至 < 2, 并且将反应混合物在 5-10°C 下搅拌半小时。然后过滤反应混合物以分离空气干燥的固体产物, 然后在 35°C 下进一步减压干燥 3 小时。干固体用石油醚成浆液样, 并且过滤所述浆液以再分离固体。然后在 35°C 下减压干燥所述固体 3 小时, 获得标题产物 (115.5g, 93.97%)。

[0808] 步骤 D: 2-(2-(氟苯基)丙二酸-1,3-双(4-硝基苯基)酯)的制备

[0809] 在氮气氛下, 在 25°C, 向 1L 烧瓶中加入甲苯 (500mL)、2-(2-氟苯基)丙二酸 (100g, 0.479 摩尔) 和 N,N-二甲基甲酰胺 (6.92g)。所述反应混合物起先被加热至 30°C, 并且在 25-30°C 下经过 20 分钟的时间, 滴加亚硫酸氯 (127.53g, 1.071 摩尔)。在添加后, 将反应混合物加热至 48-50°C 并将该温度保持 3.5 小时。然后将甲苯 (300mL) 一次性加入到反应混合物中, 接着经过 15 分钟时间, 分十份加入固体 4-硝基苯酚 (总共 148.09g, 1.064 摩尔)。添加后, 将反应混合物在 49-55°C 下保持 1.5 小时。然后在 40-45°C 下减压浓缩反应混合物以移除甲苯。用冷的甲醇 (300mL, 大约 5°C) 磨碎所得残余物, 获得灰白色固体, 其通过过滤分离, 用冷的甲醇洗涤 (2×150mL, 大约 5°C) 并在 45°C 下减压干燥, 获得标题化合物 (163.8g, 71.6%)。

[0810] 步骤 E: 1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-(2-(氟苯基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶)内盐的制备

[0811] 向反应器中加入 N-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-甲基-2-吡啶胺 (即实施例 1 步骤 A 中的产物, 60.0g, 0.247mol), 2-(2-氟苯基)丙二酸-1,3-双(4-硝基苯基)酯 (142g, 0.297mol), 咪唑 (6.74g, 99mmol) 和乙酸乙酯 (300mL), 并且将所述反应混合物加热至 72-77°C 2.0 小时。然后将反应混合物冷却至 40°C, 并且滴加水 (460mL)。将所得浆液冷却至 10°C 并进一步保持在那个温度下 15 分钟。然后过滤所述浆液以分离被用甲醇洗涤 (360mL) 的湿固体, 空气干燥粗产物, 然后在 45-50°C 下进一步减压干燥 3 小时, 获得固体状标题化合物, 即, 本发明的化合物 (93.7g, 93.1% 收率)。<sup>1</sup>H NMR (dmsO-d<sub>6</sub>) δ 9.26 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.57-7.46 (m, 2H), 7.33-7.29 (m, 1H), 7.21-7.15 (m, 2H), 5.44 (s, 2H), 2.72 (s, 3H)。

[0812] 合成实施例 3

[0813] 1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-(2',3'-二氯[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶)内盐 (化合物编号 88) 的制备

[0814] 步骤 A :2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-乙酸乙酯的制备

[0815] 将 3-碘苯乙酸乙酯 (0.87g, 3mmol, 由 J. Chem. Soc. 1963, 第 5437 页中所述的方法制备), 2,3-二氯苯基硼酸 (0.85g, 4.5mmol), 双(三苯基膦)二氯化钯 (0.10g, 0.15mmol) 和 2N 碳酸氢钠水溶液 (3mL) 于对二氧六环 (6mL) 的混合物在微波反应器中 160°C 下加热 5 分钟。冷却反应混合物, 倾入水中, 并用乙酸乙酯萃取。将有机层分离并用盐水洗涤, 经过 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 干燥并减压浓缩。所述残余物通过色谱层析在硅胶上纯化, 用乙酸乙酯的己烷洗脱, 获得标题产物 (0.48g)。

[0816] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 8.07(d, 1H), 7.43(s, 1H), 7.26(d, 1H), 6.63(dd, 1H), 4.77(d, 2H), 4.54(brs, 1H)。

[0817] 步骤 B :2-(2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-基)丙二酸-1,3-二乙酯的制备

[0818] 向 2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-乙酸乙酯 (即步骤 A 中的产物, 0.45g, 1.45mmol) 和碳酸二乙酯 (5mL) 的溶液中加入氢化钠 (于油中 60% 分散体, 0.23g, 5.8mmol)。在室温下, 将反应混合物搅拌过夜, 然后用饱和氯化铵水溶液淬灭。然后用乙酸乙酯萃取反应混合物, 并且所述有机层经过硫酸钠干燥并减压浓缩, 获得标题化合物 (0.50g)。

[0819] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 7.35-7.5(m, 5H), 7.25(t, 2H), 5.30(s, 1H), 4.20(q, 4H), 1.26(t, 6H)。

[0820] 步骤 C :2-(2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-基)丙二酸的制备

[0821] 将 2-(2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-基)丙二酸-1,3-二乙酯 (即步骤 B 中的产物, 0.30g, 0.79mmol) 加入到 2% 氢氧化钠水溶液 (5mL) 中, 并将反应混合物在 70°C 加热 20 分钟。冷却反应混合物, 用 6N 的盐酸水溶液淬灭, 并用乙酸乙酯萃取。将所述有机层分离, 用盐水洗涤, 经过硫酸钠干燥并减压浓缩, 获得标题化合物 (0.20g)。

[0822] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 7.4-7.5(m, 5H), 7.20-7.25(m, 2H), 4.74(s, 1H)。

[0823] 步骤 D :1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-(2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-基)-2-羟基-9-甲基-4-氧代-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的制备

[0824] 向 2-(2',3'-二氯-[1,1'-联苯]-3-基)丙二酸 (即步骤 C 中的产物, 200mg, 0.62mmol) 于二氯甲烷 (3mL) 的溶液中加入一滴 N,N-二甲基甲酰胺和草酰氯 (0.3mL, 3.5mmol)。将反应混合物在室温下搅拌 30 分钟, 并减压浓缩。残余物再次被溶解于二氯甲烷 (3mL) 中, 并且将该溶液加入到冰冷冷却的 N-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-3-甲基-2-吡啶胺 (即合成实施例 2 的步骤 A 中的产物, 100mg, 0.44mmol) 和三乙胺 (0.3mL, 2.2mmol) 于二氯甲烷 (2mL) 中的溶液。将反应混合物在冷却下搅拌 15 分钟, 然后在少量的 Celite<sup>®</sup> 硅藻土助滤剂的存在下浓缩。通过 MPLC 纯化粗制残余物, 获得标题化合物 (88mg), 即, 本发明的化合物。

[0825] <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 9.52(d, 1H), 8.04(dd, 1H), 7.76(d, 1H), 7.2-7.45(m, 6H), 5.95(m, 1H), 5.34(d, 1H), 5.30(d, 1H), 5.01(d, 2H)。

[0826] 合成实施例 4

[0827] 1-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[2,1-a]异喹啉鎓内盐 (化合物编号 99) 的制备

[0828] 步骤 A :N-[(2-氯-5-噁唑基)甲基]-1-异喹啉胺的制备

[0829] 1-氨基异喹啉 (0.56g, 3.9mmol) 和 2-氯-5-(氯甲基)噻唑 (0.50g, 3.0mmol) 在 N-甲基吡咯烷酮 (3mL) 中的混合物在微波反应器中被加热至 220°C 10 分钟。将反应混合物冷却至室温,用水 20mL) 稀释,并用乙醚 (5×20mL) 萃取。将合并的有机萃取物减压浓缩,并且使用 20-50% 乙酸乙酯 / 己烷作为洗脱液,在硅胶上通过色谱法来纯化所得残余物,获得浅黄色固体状标题化合物 (0.09g)

[0830]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.07 (d, 1H), 7.70-7.75 (m, 2H), 7.62 (t, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.05 (d, 1H), 5.60 (br s, 1H), 4.91 (d, 2H), 1.58 (brs,  $\text{NH}+\text{H}_2\text{O}$ )。

[0831] 步骤 B: 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羟基-4-氧代-3-苯基-4H-嘧啶并[2,1-a]异喹啉内盐的制备

[0832] 向苯基丙二酸 (0.44g, 2.4mmol) 于二氯甲烷 (10mL) 的溶液中加入两滴 N,N-二甲基甲酰胺和草酰氯 (1.1mL, 12mmol)。将所述反应混合物在室温下搅拌 30 分钟,在减压下浓缩,然后再溶解于二氯甲烷 (2.4mL)。将一部分的所得溶液 (0.4mL, 0.4mmol) 加入到冰冷却的 N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-1-异喹啉胺 (即步骤 A 中的产物, 50mg, 0.18mmol) 和三乙胺 (0.08mL) 于二氯甲烷 (2mL) 的溶液中。使反应混合物升至室温,并且搅拌过夜。然后浓缩反应混合物,并且使用 80-100% 乙酸乙酯 / 己烷作为洗脱液,通过 MPLC 来纯化粗制残余物,获得标题化合物 (17.4mg), 即,本发明的化合物。

[0833]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.26 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 7.97-8.02 (m, 2H), 7.84 (d, 2H), 7.78-7.82 (m, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.42-7.48 (m, 3H), 5.64 (brs, 2H)。

[0834] 合成实施例 5

[0835] 2-羟基-9-甲基-4-氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶内盐 (化合物编号 43) 的制备

[0836] 步骤 A: N-(5-嘧啶基甲基)-3-甲基-2-吡啶胺的制备

[0837] 向 5-嘧啶甲醛 (5.0g, 46mmol) 于甲苯 (100mL) 的溶液中加入 2-氨基-3-甲基吡啶 (5.0g, 46mmol)。在旋转蒸发器中减压的同时,将反应混合物加热到 80°C。10 分钟后,加入附加的 200mL 的甲苯。在减压下持续的加热导致形成白色固体,所述固体被溶解于甲醇 (200mL)。该溶液在氮气氛下剧烈搅拌,并分批加入颗粒状的硼氢化钠 (10.0g, 265mmol), 引起剧烈地冒泡。在加完所述硼氢化钠之后,使反应在室温下搅拌 1h。然后加入乙酸 (1mL), 并且将所述反应混合物搅拌 5 分钟,随后加入水 (100mL)。在减压下移除挥发物,并且所述悬浮液水溶液用二氯甲烷 (2×100mL) 萃取。将所述有机层合并,并且经过  $\text{MgSO}_4$  干燥,过滤,并在减压下移除所述溶剂,获得灰白色固体。将粗制固体吸附到 Celite<sup>®</sup> 上,并通过柱层析 (100% 己烷至 100% 乙酸乙酯梯度,经过 30 分钟),获得 8.848g 的白色固体。

[0838]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.11 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.00 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.60 (dd, 1H), 4.73 (d, 2H), 4.59 (brs, NH), 2.12 (s, 3H)。

[0839] 步骤 B: 2-羟基-9-甲基-4-氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶内盐的制备

[0840] 向 2-[3-(三氟甲氧基)苯基]丙二酸-1,3-双(2,4,6-三氯苯基)酯 (100mg, 0.16 毫摩尔) 于甲苯 (10mL) 的溶液中加入 N-(5-嘧啶基甲基)-3-甲基-2-吡啶胺 (即步骤 A 中的产物, 32mg, 0.16 毫摩尔)。将反应混合物在 80°C 下加热 18h。将反应容器冷却至 0°C 导致形成黄色固体沉淀,所述沉淀通过过滤分离,获得 13.2mg 的黄色固体状标题化

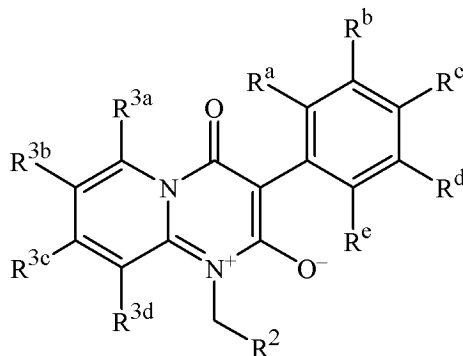
合物,即,本发明的化合物。

[0841]  $^1\text{H}$  NMR( $\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$ )  $\delta$  9.46 (d, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.83 (s, 2H), 8.27 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.69 (s, 3H)。

[0842] 通过本文所述的方法以及本领域已知的方法,可制得下表 1 至 32 中的化合物。下列缩写用于表 1 至 32,其如下:Me 代表甲基、Et 代表乙基、Pr 代表丙基并且 Ph 代表苯基。

[0843] 表 1-15 关于下文所示的式 T-1 结构。

[0844]



T-1

[0845] 表 1

[0846]  $\text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d, \text{R}^e, \text{R}^{3a}, \text{R}^{3b}$  和  $\text{R}^{3c}$  为 H;  $\text{R}^{3d}$  为 Me;  $\text{R}^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{\text{R}}^a$	$\underline{\text{R}}^a$	$\underline{\text{R}}^a$	$\underline{\text{R}}^a$
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-( $\text{CF}_3$ )苯基	2-氟-4-氰基苯基
	F	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}$	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-( $\text{OCF}_3$ )苯基	2-氟-4-( $\text{CF}_3$ )苯基
[0847]	I	$\text{OCF}_3$	4-氟苯基	2,4-双( $\text{CF}_3$ )苯基
	Me	$\text{OCHF}_2$	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$	4-( $\text{CF}_3$ )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	$\text{SCF}_3$	4-氰基苯基	2-( $\text{CF}_3$ )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	$\text{SCF}_3$	4-溴苯基	2-甲基-4-( $\text{CF}_3$ )苯基
	<i>c</i> -Pr	$\text{SCHF}_2$	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-( $\text{CF}_3$ )苯基
	<i>t</i> -Bu	$\text{S}(\text{O})\text{CF}_3$	6-氟-3-吡啶基	2-( $\text{CF}_3$ )-4-氯苯基
	$\text{CF}_3$	$\text{SO}_2\text{CF}_3$	6-( $\text{CF}_3$ )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	$\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CO}_2\text{Me}$	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-( $\text{CF}_3$ )苯基
	$\text{CHF}_2$	$\text{CO}_2\text{Et}$	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
[0848]	OEt	$\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-( $\text{OCF}_3$ )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	$\text{C}(\text{O})\text{NMe}_2$	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-( $\text{CF}_3$ )苯基
	OPh	$\text{C}(=\text{NOMe})\text{Me}$	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	$\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{C}(=\text{NOEt})\text{Me}$	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	$\text{C}\equiv\text{CH}$	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0849]  $\text{R}^a, \text{R}^c, \text{R}^d, \text{R}^e, \text{R}^{3a}, \text{R}^{3b}$  和  $\text{R}^{3c}$  为 H;  $\text{R}^{3d}$  为 Me;  $\text{R}^2$  为 2-氯-5-噻唑基

$R^b$	$R^b$	$R^b$	$R^b$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0850] <i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0851]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H； $R^{3d}$  为 Me； $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

$R^c$	$R^c$	$R^c$	$R^c$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0852] <i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0853] R<sup>a</sup> 为 F ; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

$R^b$	$R^b$	$R^b$	$R^b$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氰基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氰基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
[0854] Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氰基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基

[0855]	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH 苯基	2-氟苯基 3-氯苯基	2,4-二氯苯基 2,4-二氟苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基

[0856] R<sup>a</sup> 为 F ;R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
[0857]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH 苯基	2-氟苯基 3-氯苯基	2,4-二氯苯基 2,4-二氟苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基

[0858] R<sup>a</sup> 为 F ;R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

$R^d$	$R^d$	$R^d$	$R^d$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0859] <i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0860]  $R^a$  为 F ;  $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H ;  $R^{3d}$  为 Me ;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

$R^e$	$R^e$	$R^e$	$R^e$
H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
[0861] Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基



[0862]	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0863] R<sup>a</sup> 为 Cl ; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
[0864]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0865] R<sup>a</sup> 为 Cl ; R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[0866] R<sup>c</sup> | R<sup>c</sup> | R<sup>c</sup> | R<sup>c</sup>

[0867]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0868] R<sup>a</sup> 为 Cl ;R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
[0869]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基

[0870]	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0871] R<sup>a</sup> 为 Cl ;R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

[0872]	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氰基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0873] R<sup>a</sup> 为 OMe ;R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

[0874]	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0875]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0876] R<sup>a</sup> 为 OMe ;R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0877]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0878]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	
[0879]	R <sup>a</sup> 为 OMe ; R <sup>b</sup> 、R <sup>c</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H ; R <sup>3d</sup> 为 Me ; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
[0880]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0881] R<sup>a</sup> 为 OMe ; R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[0882]	<u>R<sup>e</sup></u>	<u>R<sup>e</sup></u>	<u>R<sup>e</sup></u>	<u>R<sup>e</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0883]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0884] R<sup>a</sup> 为 Me ;R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0885]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0886]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0887] R<sup>a</sup> 为 Me ;R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

[0888]	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0889] R<sup>a</sup> 为 Me ;R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

[0890]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0891]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0892] R<sup>a</sup> 为 Me ;R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>	<u>R<sup>c</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0893]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基



[0894]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0895] R<sup>d</sup> 为 Cl ;R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>
[0896]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sub>2</sub>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0897] R<sup>d</sup> 为 CF<sub>3</sub> ;R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>
[0898]	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0899]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0900] R<sup>b</sup> 为 Br ;R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ;R<sup>3d</sup> 为 Me ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0901]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0902]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	
[0903]	R <sup>b</sup> 为 OCF <sub>3</sub> ; R <sup>a</sup> 、R <sup>c</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H; R <sup>3d</sup> 为 Me; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
[0904]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup>	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		
[0905]	R <sup>b</sup> 为 OMe; R <sup>a</sup> 、R <sup>c</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H; R <sup>3d</sup> 为 Me; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
[0906]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0907]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0908] R<sup>b</sup> 为 F ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0909]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0910]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0911] R<sup>b</sup> 为 CN ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[0912]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0913] R<sup>b</sup> 为 Me ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[0914]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0915]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0916] R<sup>b</sup> 为 I ; R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0917]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
[0918]	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	
[0919]	R <sup>a</sup> 和 R <sup>b</sup> 为 F ; R <sup>c</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H ; R <sup>3d</sup> 为 Me ; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0920]	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	
[0921]	R <sup>a</sup> 为 F ; R <sup>b</sup> 为 Cl ; R <sup>c</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H ; R <sup>3d</sup> 为 Me ; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
[0922]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氯苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0923]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0924] R<sup>a</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 F ; R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>	<u>R<sup>b</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0925]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基



[0926]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0927] R<sup>c</sup> 为 OMe ; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[0928]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0929] R<sup>c</sup> 为 Me ; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[0930]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基

	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
[0931]	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	

[0932] R<sup>c</sup> 为 F ; R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噁唑基

	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
[0933]	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基

[0934]	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
	C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
	苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基	
[0935]	R <sup>c</sup> 为 Cl ; R <sup>a</sup> 、R <sup>b</sup> 、R <sup>e</sup> 、R <sup>3a</sup> 、R <sup>3b</sup> 和 R <sup>3c</sup> 为 H ; R <sup>3d</sup> 为 Me ; R <sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基			
[0936]	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>	<u>R<sup>d</sup></u>
	H	O- <i>i</i> -Pr	3-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-氟基苯基
	F	OCH <sub>2</sub> CH=CH	3-氟苯基	2-氟-4-氯苯基
	Cl	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH	3-氟基苯基	2-甲基-4-氯苯基
	Br	O- <i>c</i> -Pr	3-(OCF <sub>3</sub> )苯基	2-氟-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	I	OCF <sub>3</sub>	4-氟苯基	2,4-双(CF <sub>3</sub> )苯基
	Me	OCHF <sub>2</sub>	4-氯苯基	2-氟-4-溴苯基
	Et	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-(CF <sub>3</sub> )苯基	2-氯-4-氟苯基
	Pr	SCF <sub>3</sub>	4-氟基苯基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氟基苯基
	<i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	4-溴苯基	2-甲基-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>c</i> -Pr	SCHF <sub>2</sub>	6-氯-3-吡啶基	2-氯-4-(CF <sub>3</sub> )苯基
	<i>t</i> -Bu	S(O)CF <sub>3</sub>	6-氟-3-吡啶基	2-(CF <sub>3</sub> )-4-氯苯基
	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-(CF <sub>3</sub> )-3-吡啶基	2,5-二氟苯基
	CH <sub>2</sub> F	CO <sub>2</sub> Me	4,6-二氯-3-吡啶基	2-氟-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	CHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-氟-6-氯-3-吡啶基	2-氟-5-氯苯基
	OMe	氟基	2,6-二氯-3-吡啶基	2,5-二氯苯基
	OEt	C(O)NHMe	2-溴-5-氯-4-吡啶基	2-氟-5-(OCF <sub>3</sub> )苯基
	O- <i>n</i> -Pr	C(O)NMe <sub>2</sub>	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-(CF <sub>3</sub> )苯基
	OPh	C(=NOMe)Me	3-氯-5-氟苯基	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
	CH=CH <sub>2</sub>	C(=NOEt)Me	3-氟-4-氯苯基	3-Me-5-异噁唑基
C≡CH	2-氟苯基	2,4-二氯苯基	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基	
苯基	3-氯苯基	2,4-二氟苯基		

[0937] 表 2

[0938] 表 2 与表 1 相同,不同的是 R<sup>3d</sup> 为 OMe。例如,表 2 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 OMe ; 并且 R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基。

[0939] 表 2a

[0940] 表 2a 与表 1 相同,不同的是 R<sup>3d</sup> 为 Et。例如,表 2a 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Et ; 并且 R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基。

[0941] 表 3

[0942] 表 3 与表 1 相同,不同的是 R<sup>3d</sup> 为 Cl。例如,表 3 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 Cl ; 并且 R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基。

[0943] 表 4

[0944] 表 4 与表 1 相同,不同的是 R<sup>3c</sup> 为 F。例如,表 4 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H ; R<sup>3c</sup> 为 F ; R<sup>3d</sup> 为 Me ; 并且 R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基。

[0945] 表 5

[0946] 表 5 与表 1 相同,不同的是  $R^{3b}$  为 F。例如,表 5 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3b}$  为 F; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

[0947] 表 6

[0948] 表 6 与表 1 相同,不同的是  $R^{3a}$  为 F。例如,表 6 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3a}$  为 F; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

[0949] 表 7

[0950] 表 7 与表 1 相同,不同的是  $R^{3d}$  为 Br。例如,表 7 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Br;并且  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

[0951] 表 8

[0952] 表 8 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 6-氯-3-吡啶基。例如,表 8 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 6-氯-3-吡啶基。

[0953] 表 8a

[0954] 表 8a 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 6-溴-3-吡啶基。例如,表 8a 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 6-溴-3-吡啶基。

[0955] 表 8b

[0956] 表 8b 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 6-甲基-3-吡啶基。例如,表 8b 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 6-甲基-3-吡啶基。

[0957] 表 8c

[0958] 表 8c 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 3-吡啶基。例如,表 8c 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 3-吡啶基。

[0959] 表 9

[0960] 表 9 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 5-噻唑基。例如,表 9 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 5-噻唑基。

[0961] 表 10

[0962] 表 10 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 2-甲基-5-噻唑基。例如,表 10 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 2-甲基-5-噻唑基。

[0963] 表 10a

[0964] 表 10a 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 2-甲基-5-噁唑基。例如,表 10a 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 2-甲基-5-噁唑基。

[0965] 表 11

[0966] 表 11 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 6-氟-3-吡啶基。例如,表 11 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H; $R^{3d}$  为 Me;并且  $R^2$  为 6-氟-3-吡啶基。

## [0967] 表 12

[0968] 表 12 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 2-溴-5-噻唑基。例如,表 12 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 2-溴-5-噻唑基。

## [0969] 表 12a

[0970] 表 12a 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 2-氟-5-噻唑基。例如,表 12a 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 2-氟-5-噻唑基。

## [0971] 表 13

[0972] 表 13 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 4-嘧啶基。例如,表 13 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 4-嘧啶基。

## [0973] 表 13a

[0974] 表 13a 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 2-甲基-4-嘧啶基。例如,表 13a 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 2-甲基-4-嘧啶基。

## [0975] 表 14

[0976] 表 14 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为 N-甲基-4-吡唑基。例如,表 14 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 N-甲基-4-吡唑基。

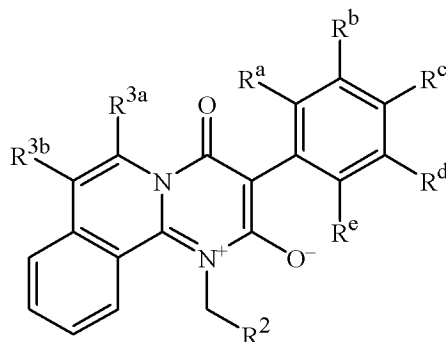
## [0977] 表 15

[0978] 表 15 与表 1 相同,不同的是  $R^2$  为  $CF_3$ 。例如,表 15 中的第一个化合物为式 T-1 的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为  $CF_3$ 。

## [0979] 表 16

[0980] 表 16 与表 1 相同,不同的是  $R^{3c}$  和  $R^{3d}$  合在一起以形成苯环。例如,表 16 中的第一个化合物为紧挨着下方所示的化合物,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$  和  $R^{3b}$  为 H; 并且  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

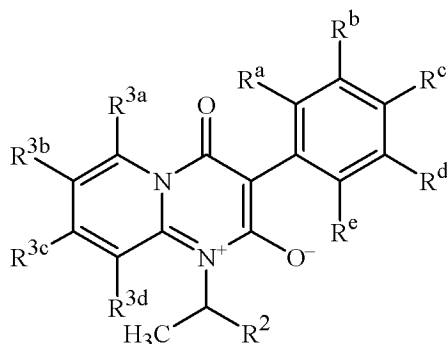
[0981]



## [0982] 表 17

[0983] 表 17 与表 1 相同,不同的是表 17 标题下的化学结构被下列结构替代:

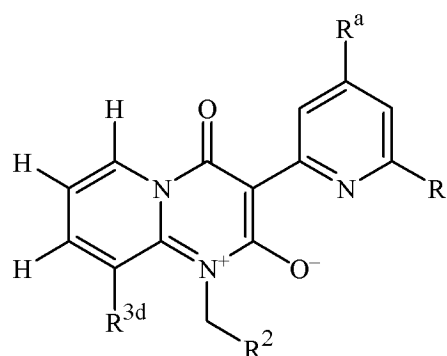
[0984]



[0985] 例如,表 17 中的第一个化合物为紧挨着上方所示的结构,其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  和  $R^{3c}$  为 H;  $R^{3d}$  为 Me; 并且  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基。

[0986] 表 17a

[0987]



[0988]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[0990]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Ome

	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[0991]	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0992]	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0993]	$R^2$ 为 2-氯-5-噻唑基; $R^{3d}$ 为 Cl			
	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0994]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0995]	$R^2$ 为 2-氯-5-噻唑基; $R^{3d}$ 为 Br			

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0996] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[0997]  $R^2$  为 2-溴-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[0998] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[0999]  $R^2$  为 2-氟-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1000] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基



[1001] R<sup>2</sup> 为 5-噻唑基;R<sup>3d</sup> 为 Me

	R <sup>a</sup>	R	R <sup>a</sup>	R
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
[1002]	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[1003]	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1004] R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基;R<sup>3d</sup> 为 Me

	R <sup>a</sup>	R	R <sup>a</sup>	R
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1005]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1006] R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基 R<sup>3d</sup> 为 Me

	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1007]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
[1008]		OCH <sub>3</sub>		2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1009]	R <sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基; R <sup>3d</sup> 为 Me			
	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1010]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
[1011]	R <sup>2</sup> 为 6-溴-3-吡啶基; R <sup>3d</sup> 为 Me			

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1012]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1013]	R <sup>2</sup> 为 6-甲基-3-吡啶基 ; R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1014]	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1015]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1016]	R <sup>2</sup> 为 3-吡啶基 R <sup>3d</sup> 为 Me			

	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1017]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1018]	$R^2$ 为 4- 嘧啶基 $R^{3d}$ 为 Me			
	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[1019]	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1020]	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1021]	$R^2$ 为 2- 甲基 -4- 嘧啶基 ; $R^{3d}$ 为 Me			

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1022] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1023]  $R^2$  为 N-甲基-4-吡唑基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1024] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1025]  $R^2$  为 CF<sub>3</sub>;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1026] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1027]  $R^2$  为  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ;  $R^{3d}$  为 Me

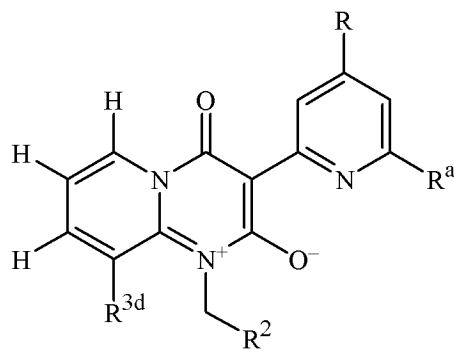
$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
氰基	4-氯-2-氟苯基	$\text{CH}_3$	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
$\text{OCH}_3$	4-氯-2-氟苯基	$\text{OCH}_3$	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
$\text{OCH}_3$	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	$\text{OCH}_3$	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		$\text{OCH}_3$	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1029]  $R^2$  为  $\text{CH}_2\text{CFCF}_2$ ;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
氰基	4-氯-2-氟苯基	$\text{CH}_3$	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\text{CH}_3$	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
$\text{OCH}_3$	4-氯-2-氟苯基	$\text{OCH}_3$	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
$\text{OCH}_3$	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	$\text{OCH}_3$	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		$\text{OCH}_3$	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1032] 表 17b

[1033]

[1034]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1035] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1036]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Ome

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1037] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1038]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基;  $R^{3d}$  为 Cl

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1039] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1040] R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基 ;R<sup>3d</sup> 为 Br

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
[1041]	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[1042]	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1043] R<sup>2</sup> 为 2- 溴 -5- 噻唑基 ;R<sup>3d</sup> 为 Me

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1044]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1045] R<sup>2</sup> 为 2- 氟 -5- 噻唑基 ;R<sup>3d</sup> 为 Me



$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1046] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基

[1047] | OCH<sub>3</sub> 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1048] R<sup>2</sup> 为 5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1049] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1050] R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1051]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1052]	$R^2$ 为 6-氟-3-吡啶基; $R^{3d}$ 为 Me			
[1053]	$R^a$	$R$	$R^a$	$R$
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1054]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1055]	$R^2$ 为 6-氟-3-吡啶基; $R^{3d}$ 为 Me			

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1056]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1057]	R <sup>2</sup> 为 6-溴-3-吡啶基 ; R <sup>3d</sup> 为 Me			
	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[1058]	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1059]	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1060]	R <sup>2</sup> 为 6-甲基-3-吡啶基 ; R <sup>3d</sup> 为 Me			

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1061] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1062]  $R^2$  为 3-吡啶基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1063] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1064]  $R^2$  为 4-嘧啶基  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1065] 氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1066]  $R^2$  为 2-甲基-4-嘧啶基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1068]  $R^2$  为 N-甲基-4-吡啶基;  $R^{3d}$  为 Me

$R^a$	R	$R^a$	R
H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
		OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

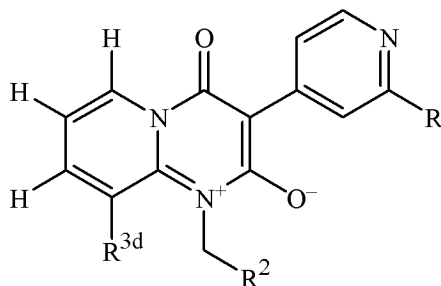
[1071]  $R^2$  为 CF<sub>3</sub>;  $R^{3d}$  为 Me

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1072]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1073]	R <sup>2</sup> 为 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ; R <sup>3d</sup> 为 Me			
	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
[1074]	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
[1075]	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1076]	R <sup>2</sup> 为 CH <sub>2</sub> CFC1CHF <sub>2</sub> ; R <sup>3d</sup> 为 Me			

	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R</u>
	H	4-氯-2-氟苯基	F	4-氯-2-氟苯基
	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
[1077]	氰基	4-氯-2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
	氰基	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
	氰基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基
	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基
			OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基

[1078] 表 17c

[1079]

[1080] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
[1081]	4-氯-2-氟苯基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-4-氰基苯基
	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	4-氯-2-甲基苯基
	4-氰基-2-氟苯基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	

[1082] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Ome

	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
[1083]	4-氯-2-氟苯基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-4-氰基苯基
	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	4-氯-2-甲基苯基
	4-氰基-2-氟苯基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	

[1084] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Cl

	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
[1085]	4-氯-2-氟苯基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-4-氰基苯基
	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	4-氯-2-甲基苯基
	4-氰基-2-氟苯基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	

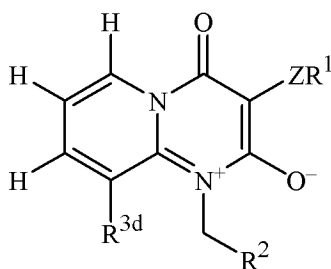
[1086] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Br

	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
[1087]	4-氯-2-氟苯基	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-4-氰基苯基
	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氟-5-(三氟甲基)苯基	4-氯-2-甲基苯基
	4-氰基-2-氟苯基	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	





[1106]	$R^2$ 为 3-吡啶基; $R^{3d}$ 为 Me		
[1107]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1108]	$R^2$ 为 4-嘧啶基; $R^{3d}$ 为 Me		
[1109]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1110]	$R^2$ 为 2-甲基-4-嘧啶基; $R^{3d}$ 为 Me		
[1111]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1112]	$R^2$ 为 N-甲基-4-吡唑基; $R^{3d}$ 为 Me		
[1113]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1114]	$R^2$ 为 $CF_3$ ; $R^{3d}$ 为 Me		
[1115]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1116]	$R^2$ 为 $CH_2CF_3$ ; $R^{3d}$ 为 Me		
[1117]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1118]	$R^2$ 为 $CH_2CFC1CHF_2$ ; $R^{3d}$ 为 Me		
[1119]	$\underline{R}$ 4-氯-2-氟苯基 2-氟-4-(三氟甲基)苯基 4-氟基-2-氟苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲基)苯基 2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	$\underline{R}$ 2-氯-4-氟基苯基 4-氯-2-甲基苯基
[1120]	表 18		
[1121]			



[1122] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>
	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	2-CN-4-吡啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CN-2-吡啶基
[1123]	2-Cl-4-吡啶基	2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-Cl-2-吡啶基
	2-F-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基
	2-Br-4-吡啶基	2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CN-2-吡啶基
		6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-Cl-2-吡啶基

[1124] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Ome

	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>
[1125]	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	2-CN-4-吡啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CN-2-吡啶基
	2-Cl-4-吡啶基	2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-Cl-2-吡啶基
	2-F-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基
[1126]	2-Br-4-吡啶基	2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CN-2-吡啶基
		6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-Cl-2-吡啶基

[1127] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Cl

	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>
[1128]	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	2-CN-4-吡啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CN-2-吡啶基
	2-Cl-4-吡啶基	2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-Cl-2-吡啶基
	2-F-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基
	2-Br-4-吡啶基	2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CN-2-吡啶基
		6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-Cl-2-吡啶基

[1129] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Br

	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>
[1130]	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	2-CN-4-吡啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CN-2-吡啶基
	2-Cl-4-吡啶基	2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-Cl-2-吡啶基
	2-F-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基
	2-Br-4-吡啶基	2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CN-2-吡啶基
		6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-Cl-2-吡啶基

[1131] R<sup>2</sup> 为 2-溴-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>	<u>ZR<sup>1</sup></u>
[1132]	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	2-CN-4-吡啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CN-2-吡啶基
	2-Cl-4-吡啶基	2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-Cl-2-吡啶基
	2-F-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基
	2-Br-4-吡啶基	2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基	4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CN-2-吡啶基
		6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-Cl-2-吡啶基

[1133] R<sup>2</sup> 为 2-氟-5-噻唑基; R<sup>3d</sup> 为 Me

[1134]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1135]	R <sup>2</sup> 为 5- 噻唑基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1136]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1137]	R <sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 噻唑基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1138]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1139]	R <sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1140]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1141]	R <sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1142]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1143]	R <sup>2</sup> 为 6- 溴 -3- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1144]	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{\text{ZR}}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1145]	R <sup>2</sup> 为 6- 甲基 -3- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			

[1146]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1147]	R <sup>2</sup> 为 3- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1148]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1149]	R <sup>2</sup> 为 4- 嘧啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1150]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1151]	R <sup>2</sup> 为 2- 甲基 -4- 嘧啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1152]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基
[1153]	2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1154]	R <sup>2</sup> 为 N- 甲基 -4- 吡啶基 ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1155]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1156]	R <sup>2</sup> 为 CF <sub>3</sub> ;R <sup>3d</sup> 为 Me			
[1157]	$\underline{ZR}^1$ 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	$\underline{ZR}^1$ 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
[1158]	R <sup>2</sup> 为 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ;R <sup>3d</sup> 为 Me			

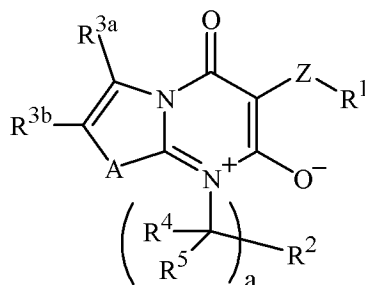
	<u>ZR<sup>1</sup></u> 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
--	--	--	--	---

[1160] R<sup>2</sup> 为 CH<sub>2</sub>CFC1CHF<sub>2</sub>; R<sup>3d</sup> 为 Me

	<u>ZR<sup>1</sup></u> 4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 2-Cl-4-吡啶基 2-F-4-吡啶基 2-Br-4-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 2-CN-4-吡啶基 2-CF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCF <sub>3</sub> -4-吡啶基 2-OCH <sub>3</sub> -4-吡啶基 6-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCF <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 4-OCH <sub>3</sub> -2-吡啶基	<u>ZR<sup>1</sup></u> 4-CN-2-吡啶基 4-Cl-2-吡啶基 6-CH <sub>3</sub> -2-吡啶基 6-CN-2-吡啶基 6-Cl-2-吡啶基
--	--	--	--	---

[1162] 表 19

[1163]



[1164] Z-R<sup>1</sup> 为苯基; R<sup>3b</sup> 为 H; A 为 CH = CMe; R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H; a 为 1; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	<u>R<sup>3a</sup></u> H Cl Br 氰基	<u>R<sup>3a</sup></u> CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R<sup>3a</sup></u> Me Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	<u>R<sup>3a</sup></u> OMe OEt OCF <sub>3</sub> SMe	<u>R<sup>3a</sup></u> CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CF <sub>3</sub> pH	<u>R<sup>3a</sup></u> OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	<u>R<sup>3a</sup></u> 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--	--	--	---	--	--	---	--

[1166] Z-R<sup>1</sup> 为苯基; R<sup>3a</sup> 为 H; A 为 CH = CMe; R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H; a 为 1; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	<u>R<sup>3b</sup></u> Cl Br 氰基 pH	<u>R<sup>3b</sup></u> CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R<sup>3b</sup></u> Me Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	<u>R<sup>3b</sup></u> OMe OEt OCF <sub>3</sub> SMe	<u>R<sup>3b</sup></u> CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CF <sub>3</sub>	<u>R<sup>3b</sup></u> OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	<u>R<sup>3b</sup></u> 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--	---	--	---	--	--	---	--

[1168] Z-R<sup>1</sup> 为苯基; R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H; A 为 C(R<sup>3c</sup>) = CH; R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H; a 为 1;

[1169] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	<u>R<sup>3c</sup></u> Cl Br 氰基	<u>R<sup>3c</sup></u> CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et	<u>R<sup>3c</sup></u> Me Et <i>i</i> -Pr	<u>R<sup>3c</sup></u> OMe OEt OCF <sub>3</sub>	<u>R<sup>3c</sup></u> CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CF <sub>3</sub>	<u>R<sup>3c</sup></u> OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	<u>R<sup>3c</sup></u> 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--	---	--	---	---	--	---	--

[1171] pH | C(O)NMe<sub>2</sub> | *c*-Pr | SMe | | |

[1172] Z-R<sup>1</sup> 为苯基; R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H; A 为 CH = C(R<sup>3d</sup>); R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H; a 为 1;

[1173]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$
	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1174]	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	氰基	pH	

[1175]  $Z-R^1$  为苯基;  $R^{3b}$  为 H; A 为 O;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1176]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	2-氰基-4-吡啶基

[1177]  $Z-R^1$  为苯基;  $R^{3b}$  为 H; A 为 S;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1178]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	2-氰基-4-吡啶基

[1179]  $Z-R^1$  为苯基;  $R^{3b}$  为 H; A 为 NMe;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1180]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO

[1181] 氰基 | C(O)NMe<sub>2</sub> | *c*-Pr | SMe | pH |

[1182]  $Z-R^1$  为苯基;  $R^{3a}$  和  $R^{3b}$  为 H; A 为 NR<sup>3e</sup>;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$
	氰基	C(O)Me	<i>i</i> -Pr	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1183]	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	<i>c</i> -Pr	OEt	C≡CH	pH
	CHO	C(O)NMe <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		2-氰基-4-吡啶基

[1184]  $Z-R^1$  为 2-氟苯基;  $R^{3b}$  为 H; A 为 CH=CMe;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	H	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1185]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	2-氰基-4-吡啶基

[1186]  $Z-R^1$  为 2-氟苯基;  $R^{3a}$  为 H; A 为 CH=CMe;  $R^4$  和  $R^5$  为 H; a 为 1;  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$
[1187]	Cl	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1188] Z-R1 为 2-氟苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 C(R<sup>3c</sup>) = CH;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$
[1189]	Cl	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1190] Z-R1 为 2-氟苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH = C(R<sup>3d</sup>);R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$
[1191]	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh		3-F-2-吡啶基
	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>		4-Me-3-吡啶基
	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO		2-氰基-4-吡啶基
	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	氰基	pH		

[1192] Z-R1 为 2-氟苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 O;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
[1193]	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1194] Z-R1 为 2-氟苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 S;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
[1195]	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1196] Z-R1 为 2-氟苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
[1197]	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1198] Z-R<sup>1</sup> 为 2-氟苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NR<sup>3e</sup>;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3e}$ 氰基	$\underline{R}^{3e}$ C(O)Me	$\underline{R}^{3e}$ <i>i</i> -Pr	$\underline{R}^{3e}$ OMe	$\underline{R}^{3e}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3e}$ OPh	$\underline{R}^{3e}$ 3-F-2-吡啶基
[1199]	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	<i>c</i> -Pr	OEt	C≡CH	pH	4-Me-3-吡啶基
	CHO	C(O)NMe <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>			2-氰基-4-吡啶基

[1200] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$ H	$\underline{R}^{3a}$ CHO	$\underline{R}^{3a}$ Me	$\underline{R}^{3a}$ OMe	$\underline{R}^{3a}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3a}$ OPh	$\underline{R}^{3a}$ 3-F-2-吡啶基
[1201]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1202] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3a</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3b}$ Cl	$\underline{R}^{3b}$ CHO	$\underline{R}^{3b}$ Me	$\underline{R}^{3b}$ OMe	$\underline{R}^{3b}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3b}$ OPh	$\underline{R}^{3b}$ 3-F-2-吡啶基
[1203]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1204] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 C(R<sup>3c</sup>)=CH;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3c}$ Cl	$\underline{R}^{3c}$ CHO	$\underline{R}^{3c}$ Me	$\underline{R}^{3c}$ OMe	$\underline{R}^{3c}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3c}$ OPh	$\underline{R}^{3c}$ 3-F-2-吡啶基
[1205]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1206] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=C(R<sup>3d</sup>);R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3d}$ CHO	$\underline{R}^{3d}$ Me	$\underline{R}^{3d}$ OMe	$\underline{R}^{3d}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3d}$ OPh	$\underline{R}^{3d}$ 3-F-2-吡啶基
[1207]	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	氰基	pH	

[1208] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 O;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$ F	$\underline{R}^{3a}$ CHO	$\underline{R}^{3a}$ Me	$\underline{R}^{3a}$ OMe	$\underline{R}^{3a}$ CH=CH <sub>2</sub>	$\underline{R}^{3a}$ OPh	$\underline{R}^{3a}$ 3-F-2-吡啶基
[1209]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1210] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 S;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基



	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1211]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1212] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1213]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1214] Z-R<sup>1</sup> 为 3,5-二氯苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NR<sup>3e</sup>;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;

[1215] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$
	氰基	C(O)Me	<i>i</i> -Pr	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1216]	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	<i>c</i> -Pr	OEt	C≡CH	pH	4-Me-3-吡啶基
	CHO	C(O)NMe <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>			2-氰基-4-吡啶基

[1217] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	H	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1218]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1219] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3a</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$	$\underline{R}^{3b}$
	Cl	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1220]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1221] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 C(R<sup>3c</sup>)=CH;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$	$\underline{R}^{3c}$
	Cl	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1222]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1223] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=C(R<sup>3d</sup>);R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$	$\underline{R}^{3d}$
	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh	3-F-2-吡啶基
[1224]	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	氰基	pH	

[1225] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 O;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1226]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	
						2-氰基-4-吡啶基

[1227] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 S;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1228]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	
						2-氰基-4-吡啶基

[1229] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	F	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1230]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	
						2-氰基-4-吡啶基

[1231] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(三氟甲基)苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NR<sup>3e</sup>;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$	$\underline{R}^{3e}$
	氰基	C(O)Me	<i>i</i> -Pr	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1232]	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	<i>c</i> -Pr	OEt	C≡CH	pH
	CHO	C(O)NMe <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		
						2-氰基-4-吡啶基

[1233] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;

[1234] a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$	$\underline{R}^{3a}$
	H	CHO	Me	OMe	CH=CH <sub>2</sub>	OPh
[1235]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH	
						2-氰基-4-吡啶基

[1236] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3a</sup> 为 H;A 为 CH=CMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;

[1237] a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3b}}{Cl}$	$\frac{R^{3b}}{CHO}$	$\frac{R^{3b}}{Me}$	$\frac{R^{3b}}{OMe}$	$\frac{R^{3b}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3b}}{OPh}$	$\frac{R^{3b}}{3-F-2-吡啶基}$
[1238]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1239] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 C(R<sup>3c</sup>)=CH;

[1240] R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3c}}{Cl}$	$\frac{R^{3c}}{CHO}$	$\frac{R^{3c}}{Me}$	$\frac{R^{3c}}{OMe}$	$\frac{R^{3c}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3c}}{OPh}$	$\frac{R^{3c}}{3-F-2-吡啶基}$
[1241]	Br	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
[1242]	氰基	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe			

[1243] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 CH=C(R<sup>3d</sup>);

[1244] R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3d}}{CHO}$	$\frac{R^{3d}}{Me}$	$\frac{R^{3d}}{OMe}$	$\frac{R^{3d}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3d}}{OPh}$	$\frac{R^{3d}}{3-F-2-吡啶基}$
[1245]	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	氰基	pH	

[1246] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 0;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3a}}{F}$	$\frac{R^{3a}}{CHO}$	$\frac{R^{3a}}{Me}$	$\frac{R^{3a}}{OMe}$	$\frac{R^{3a}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3a}}{OPh}$	$\frac{R^{3a}}{3-F-2-吡啶基}$
[1247]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1248] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 S;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3a}}{F}$	$\frac{R^{3a}}{CHO}$	$\frac{R^{3a}}{Me}$	$\frac{R^{3a}}{OMe}$	$\frac{R^{3a}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3a}}{OPh}$	$\frac{R^{3a}}{3-F-2-吡啶基}$
[1249]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	Br	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	氰基	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	SMe	pH		

[1250] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基;R<sup>3b</sup> 为 H;A 为 NMe;R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H;a 为 1;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

	$\frac{R^{3a}}{F}$	$\frac{R^{3a}}{CHO}$	$\frac{R^{3a}}{Me}$	$\frac{R^{3a}}{OMe}$	$\frac{R^{3a}}{CH=CH_2}$	$\frac{R^{3a}}{OPh}$	$\frac{R^{3a}}{3-F-2-吡啶基}$
[1251]	Cl	C(O)Me	Et	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基

[1252] 

Br 氟基	CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub> SMe	CF <sub>3</sub> pH	NHCHO	2-氟基-4-吡啶基
----------	--	------------------------------	-------------------------	-----------------------	-------	------------

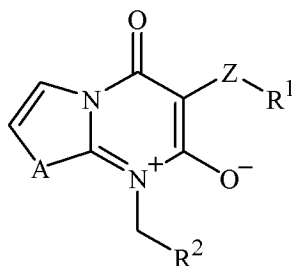
[1253] Z-R<sup>1</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)苯基; R<sup>3a</sup> 和 R<sup>3b</sup> 为 H; A 为 NR<sup>3e</sup>; R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 为 H; a 为 1; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1254] 

<u>R<sup>3e</sup></u> 氟基	<u>R<sup>3e</sup></u> C(O)Me	<u>R<sup>3e</sup></u> <i>i</i> -Pr	<u>R<sup>3e</sup></u> OMe	<u>R<sup>3e</sup></u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R<sup>3e</sup></u> OPh	<u>R<sup>3e</sup></u> 3-F-2-吡啶基
NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	<i>c</i> -Pr	OEt	C≡CH	pH	4-Me-3-吡啶基
CHO	C(O)NMe <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>			2-氟基-4-吡啶基

[1255] 表 20

[1256]



[1257] A 为 NCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1258] 

<u>ZR<sup>1</sup></u> pH	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-MeO-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> -Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1259] A 为 NCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基

[1260] 

<u>ZR<sup>1</sup></u> pH	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-MeO-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> -Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1261] A 为 NCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> 为 5-噻唑基

[1262] 

<u>ZR<sup>1</sup></u> pH	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-MeO-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> -Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1263] A 为 NCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> 为 CF<sub>3</sub>

[1264] 

<u>ZR<sup>1</sup></u> pH	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-MeO-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> -Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	<u>ZR<sup>1</sup></u> 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1265] A 为 NCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

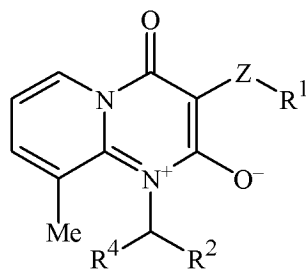
[1266]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1267]	A 为 NCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> ; R <sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基				
[1268]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1269]	A 为 NCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> ; R <sup>2</sup> 为 1- 甲基 -4- 吡啶基;				
[1270]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1271]	A 为 NEt; R <sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基				
[1272]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1273]	A 为 NEt; R <sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 噻唑基				
[1274]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1275]	A 为 NEt; R <sup>2</sup> 为 5- 噻唑基				
[1276]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1277]	A 为 NEt; R <sup>2</sup> 为 CF <sub>3</sub>				
[1278]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1279]	A 为 NEt; R <sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基				

[1280]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1281]	A 为 NEt ;R <sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基				
[1282]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1283]	A 为 NEt ;R <sup>2</sup> 为 1- 甲基 -4- 吡啶基 ;				
[1284]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1285]	A 为 NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ;R <sup>2</sup> 为 H ;				
[1286]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1287]	A 为 NCH <sub>2</sub> (6- 氯 -3- 吡啶基) ;R <sup>2</sup> 为 H ;				
[1288]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1289]	A 为 NCH <sub>2</sub> (6- 氟 -3- 吡啶基) ;R <sup>2</sup> 为 H ;				
[1290]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1291]	A 为 NCH <sub>2</sub> (2- 氯 -5- 噻唑基) ;R <sup>2</sup> 为 H ;				
[1292]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1293]	A 为 NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ;R <sup>2</sup> 为 Me				
[1294]	$\underline{\text{ZR}}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{\text{ZR}}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1295]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1296]	A 为 NCH <sub>2</sub> (6-氯-3-吡啶基); R <sup>2</sup> 为 Me				
[1297]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1298]	A 为 NCH <sub>2</sub> (6-氟-3-吡啶基); R <sup>2</sup> 为 Me				
[1299]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1300]	A 为 NCH <sub>2</sub> (2-氯-5-噻唑基); R <sup>2</sup> 为 Me				
[1301]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1302] 表 21

[1303]

[1304] R<sup>4</sup> 为 F; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1305]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
--------	---	---	--	---	--

[1306] R<sup>4</sup> 为 F; R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基

[1307]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
--------	---	---	--	---	--

[1308]  $R^4$  为 F ;  $R^2$  为 5- 噻唑基

	$\underline{ZR^1}$ pH	$\underline{ZR^1}$ 3-MeO-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
[1309]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1310]  $R^4$  为 F ;  $R^2$  为 CF<sub>3</sub>

	$\underline{ZR^1}$ pH	$\underline{ZR^1}$ 3-MeO-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
[1311]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1312]  $R^4$  为 F ;  $R^2$  为 6- 氯 -3- 吡啶基

	$\underline{ZR^1}$ pH	$\underline{ZR^1}$ 3-MeO-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
[1313]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1314]  $R^4$  为 F ;  $R^2$  为 6- 氟 -3- 吡啶基

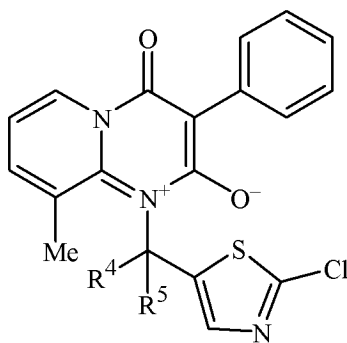
	$\underline{ZR^1}$ pH	$\underline{ZR^1}$ 3-MeO-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
[1315]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1316]  $R^4$  为 F ;  $R^2$  为 1- 甲基 -4- 吡啶基 ;

	$\underline{ZR^1}$ pH	$\underline{ZR^1}$ 3-MeO-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph	$\underline{ZR^1}$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph
[1317]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

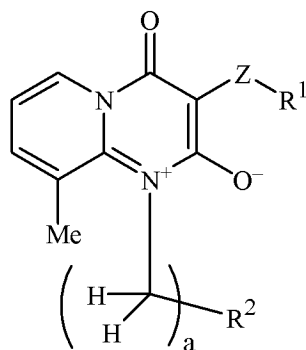
[1318] 表 22

[1319]

[1320]  $R^5$  为 H



[1321]	$\underline{R}^4$ Cl Br 氰基 pH	$\underline{R}^4$ CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^4$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}^4$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^4$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1322]	R <sup>5</sup> 为 Me						
[1323]	$\underline{R}^4$ Cl Br 氰基 pH	$\underline{R}^4$ CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^4$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}^4$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^4$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1324]	R <sup>5</sup> 为 <i>c</i> -Pr						
[1325]	$\underline{R}^4$ Cl Br 氰基 pH	$\underline{R}^4$ CHO C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^4$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^4$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}^4$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^4$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1326]	表 23						
[1327]							



[1328]	a 为 2 ; R <sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基				
[1329]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1330]	a 为 2 ; R <sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 噻唑基				
[1331]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1332]	a 为 2 ; R <sup>2</sup> 为 5- 噻唑基				
[1333]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1334] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 2- 氟 -5- 噻唑基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1335]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1336] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1337]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1338] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1339]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1340] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 CF<sub>3</sub>

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1341]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1342] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1343]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1344] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1345]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1346] a 为 2 ;R<sup>2</sup> 为 1- 甲基 -4- 吡啶基

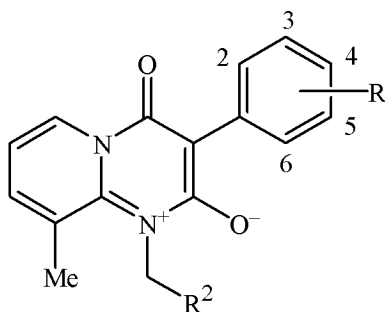
	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1347]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
[1348]	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1349] a 为 3 ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

	$\frac{ZR^1}{pH}$	$\frac{ZR^1}{3-MeO-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-CF_3O-Ph}$	$\frac{ZR^1}{3-Cl, 5-CF_3-Ph}$
[1350]	2-F-Ph	C(O)CF <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et-Ph	3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph	3-Me-Ph
	3-CN-Ph	C(O)Ph	CO <sub>2</sub> Et	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph

[1351] a 为 3 ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 噻唑基

[1352]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1353]	a 为 3 ; R <sup>2</sup> 为 5- 噻唑基				
[1354]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1355]	a 为 3 ; R <sup>2</sup> 为 CF <sub>3</sub>				
[1356]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1357]	a 为 3 ; R <sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基				
[1358]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1359]	a 为 3 ; R <sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基				
[1360]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1361]	a 为 3 ; R <sup>2</sup> 为 1- 甲基 -4- 吡啶基				
[1362]	$\underline{ZR}^1$ pH 2-F-Ph 3-CN-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-MeO-Ph C(O)CF <sub>3</sub> C(O)Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> -Ph 3-CO <sub>2</sub> Et-Ph CO <sub>2</sub> Et	$\underline{ZR}^1$ 3-CF <sub>3</sub> O-Ph 3-C(O)NMe <sub>2</sub> -Ph 3,5-二 Cl-Ph	$\underline{ZR}^1$ 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub> -Ph 3-Me-Ph 3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
[1363]	表 24				
[1364]					



[1365] R 为 2-F

[1366]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1367] R 为 3-Me

[1368]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1369] R 为 3-CN

[1370]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1371] R 为 3-Ome

[1372]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1373] R 为 3-CF<sub>3</sub>

[1374]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1375] R 为 3-Cl、5-Cl

[1376]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

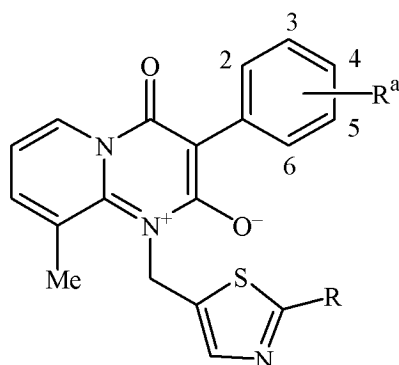
[1377] R 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)

[1378]

$\underline{R}^2$ 氰基 CHO pH	$\underline{R}^2$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}^2$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}^2$ CH <sub>2</sub> OMe CH <sub>2</sub> OEt CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^2$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH CH <sub>2</sub> SMe	$\underline{R}^2$ OPh CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}^2$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------------------------------------	---	---	---	--	---	--

[1379] 表 25

[1380]

[1381] R<sup>a</sup> 为 2-F

	<u>R</u> 氰基	<u>R</u> C(O)Me	<u>R</u> Et	<u>R</u> OMe	<u>R</u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R</u> OPh	<u>R</u> 3-F-2-吡啶基
[1382]	CHO	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	CF <sub>3</sub>						

[1383] R<sup>a</sup> 为 3-Me

	<u>R</u> 氰基	<u>R</u> C(O)Me	<u>R</u> Et	<u>R</u> OMe	<u>R</u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R</u> OPh	<u>R</u> 3-F-2-吡啶基
[1384]	CHO	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	CF <sub>3</sub>						

[1385] R<sup>a</sup> 为 3-CN

	<u>R</u> 氰基	<u>R</u> C(O)Me	<u>R</u> Et	<u>R</u> OMe	<u>R</u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R</u> OPh	<u>R</u> 3-F-2-吡啶基
[1386]	CHO	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	CF <sub>3</sub>						

[1387] R<sup>a</sup> 为 3-Ome

	<u>R</u> 氰基	<u>R</u> C(O)Me	<u>R</u> Et	<u>R</u> OMe	<u>R</u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R</u> OPh	<u>R</u> 3-F-2-吡啶基
[1388]	CHO	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
[1389]	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	CF <sub>3</sub>						

[1390] R<sup>a</sup> 为 3-CF<sub>3</sub>

	<u>R</u> 氰基	<u>R</u> C(O)Me	<u>R</u> Et	<u>R</u> OMe	<u>R</u> CH=CH <sub>2</sub>	<u>R</u> OPh	<u>R</u> 3-F-2-吡啶基
[1391]	CHO	CO <sub>2</sub> Et	<i>i</i> -Pr	OEt	C≡CH	NMe <sub>2</sub>	4-Me-3-吡啶基
	pH	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
	CF <sub>3</sub>						

[1392] R<sup>a</sup> 为 3-Cl, 5-Cl

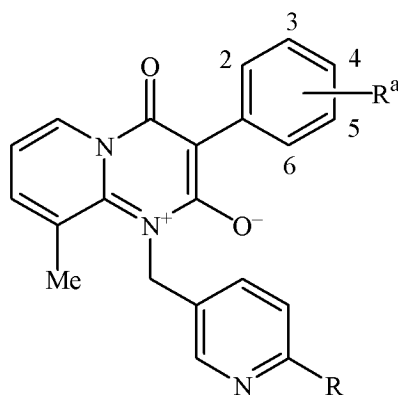
[1393]	$\underline{\text{R}}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------	--	--	--	--	---	--	---

[1394] R<sup>a</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)

[1395]	$\underline{\text{R}}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------	--	--	--	--	---	--	---

[1396] 表 26

[1397]



[1398] R<sup>a</sup> 为 2-F

[1399]	$\underline{\text{R}}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------	--	--	--	--	---	--	---

[1400] R<sup>a</sup> 为 3-Me

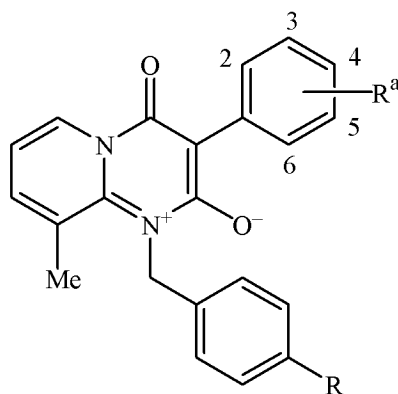
[1401]	$\underline{\text{R}}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------	--	--	--	--	---	--	---

[1402] R<sup>a</sup> 为 3-CN

[1403]	$\underline{\text{R}}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
--------	--	--	--	--	---	--	---

[1404] R<sup>a</sup> 为 3-Ome

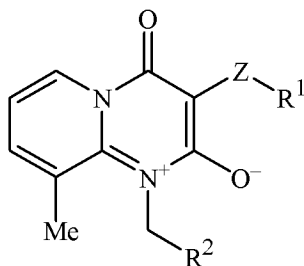
[1405]	$\underline{R}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1406]	R <sup>a</sup> 为 3-CF <sub>3</sub>						
[1407]	$\underline{R}$ 氰基 CHO	$\underline{R}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et	$\underline{R}$ Et <i>i</i> -Pr	$\underline{R}$ OMe OEt	$\underline{R}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH	$\underline{R}$ OPh NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基
[1408]	pH CF <sub>3</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	<i>c</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>	SMe	NHCHO	2-氰基-4-吡啶基
[1409]	R <sup>a</sup> 为 3-Cl, 5-Cl						
[1410]	$\underline{R}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1411]	R <sup>a</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)						
[1412]	$\underline{R}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr	$\underline{R}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1413]	表 27						
[1414]							



[1415]	R <sup>a</sup> 为 2-F						
[1416]	$\underline{R}$ 氰基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{R}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{R}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{R}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{R}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{R}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氰基-4-吡啶基
[1417]	R <sup>a</sup> 为 3-Me						

[1418]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氟基-4-吡啶基
[1419]	R <sup>a</sup> 为 3-CN						
[1420]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氟基-4-吡啶基
[1421]	R <sup>a</sup> 为 3-Ome						
[1422]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氟基-4-吡啶基
[1423]	R <sup>a</sup> 为 3-CF <sub>3</sub>						
[1424]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氟基-4-吡啶基
[1425]	R <sup>a</sup> 为 3-Cl, 5-Cl						
[1426]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub>	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基
[1427]	pH CF <sub>3</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub> Me	<i>c</i> -Pr Cl	OCF <sub>3</sub> Br	SMe	NHCHO	2-氟基-4-吡啶基
[1428]	R <sup>a</sup> 为 3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)						
[1429]	$\underline{\text{R}}$ 氟基 CHO pH CF <sub>3</sub>	$\underline{\text{R}}$ C(O)Me CO <sub>2</sub> Et C(O)NMe <sub>2</sub> Me	$\underline{\text{R}}$ Et <i>i</i> -Pr <i>c</i> -Pr Cl	$\underline{\text{R}}$ OMe OEt OCF <sub>3</sub> Br	$\underline{\text{R}}$ CH=CH <sub>2</sub> C≡CH SMe	$\underline{\text{R}}$ OPh NMe <sub>2</sub> NHCHO	$\underline{\text{R}}$ 3-F-2-吡啶基 4-Me-3-吡啶基 2-氟基-4-吡啶基
[1430]	表 28						
[1431]							





[1432] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1433]

ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>
Cl	Br	I	氰基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	2-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
F	C(O)NMe <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	NHCHO	5-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	4-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
CF <sub>3</sub>	<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	Et	<i>i</i> -Pr	2-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
Me	CH=CH <sub>2</sub>	C≡CH	2-噻吩基	5-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
<i>c</i> -Pr	C(O)CF <sub>3</sub>	C(O)Ph	3-噻吩基	C(O)(2-F-Ph)	C(O)(3,5-二 Cl-Ph)
C(O)Me	CHO	CO <sub>2</sub> Et		C(O)(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	C(O)(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1434] R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

[1435]

ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>
Cl	Br	I	氰基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	2-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
F	C(O)NMe <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	NHCHO	5-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	4-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
CF <sub>3</sub>	<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	Et	<i>i</i> -Pr	2-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
Me	CH=CH <sub>2</sub>	C≡CH	2-噻吩基	5-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
<i>c</i> -Pr	C(O)CF <sub>3</sub>	C(O)Ph	3-噻吩基	C(O)(2-F-Ph)	C(O)(3,5-二 Cl-Ph)
C(O)Me	CHO	CO <sub>2</sub> Et		C(O)(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	C(O)(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1436] R<sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基

[1437]

ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>
Cl	Br	I	氰基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	2-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
F	C(O)NMe <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	NHCHO	5-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	4-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
CF <sub>3</sub>	<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	Et	<i>i</i> -Pr	2-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
Me	CH=CH <sub>2</sub>	C≡CH	2-噻吩基	5-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
<i>c</i> -Pr	C(O)CF <sub>3</sub>	C(O)Ph	3-噻吩基	C(O)(2-F-Ph)	C(O)(3,5-二 Cl-Ph)
C(O)Me	CHO	CO <sub>2</sub> Et		C(O)(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	C(O)(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1438] R<sup>2</sup> 为 5-噻唑基

[1439]

ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>	ZR <sup>1</sup>
Cl	Br	I	氰基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	2-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
F	C(O)NMe <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	NHCHO	5-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	4-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
CF <sub>3</sub>	<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	Et	<i>i</i> -Pr	2-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
Me	CH=CH <sub>2</sub>	C≡CH	2-噻吩基	5-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
<i>c</i> -Pr	C(O)CF <sub>3</sub>	C(O)Ph	3-噻吩基	C(O)(2-F-Ph)	C(O)(3,5-二 Cl-Ph)
C(O)Me	CHO	CO <sub>2</sub> Et		C(O)(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	C(O)(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

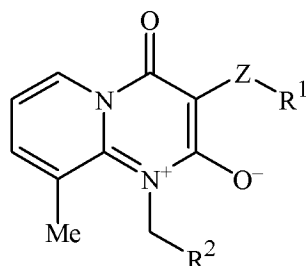
[1440] R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基

[1441]

$\underline{ZR}^1$	$\underline{ZR}^1$	$\underline{ZR}^1$	$\underline{ZR}^1$	$\underline{ZR}^1$	$\underline{ZR}^1$
Cl	Br	I	氰基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	2-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
F	C(O)NMe <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	NHCHO	5-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基	4-CF <sub>3</sub> -5-噻唑基
CF <sub>3</sub>	<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	Et	<i>i</i> -Pr	2-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
Me	CH=CH <sub>2</sub>	C≡CH	2-噻吩基	5-CF <sub>3</sub> -4-噻唑基	1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基
<i>c</i> -Pr	C(O)CF <sub>3</sub>	C(O)Ph	3-噻吩基	C(O)(2-F-Ph)	C(O)(3,5-二 Cl-Ph)
C(O)Me	CHO	CO <sub>2</sub> Et		C(O)(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	C(O)(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1442] 表 29

[1443]

[1444] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1445]

$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$
CH=CH(Ph)	CH=CH(2-F-Ph)	CH=CH(3-F-Ph)	CH=CH(4-F-Ph)
CH=CH(2-Me-Ph)	CH=CH(3-Me-Ph)	CH=CH(4-Me-Ph)	CH=CH(2-CF <sub>3</sub> -Ph)
CH=CH(3-CF <sub>3</sub> O-Ph)	CH=CH(4-CF <sub>3</sub> O-Ph)	CH=CH(Me)	CH=CH(Et)
CH=CH( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr))	CH=CH(C(O)Me)	CH=CH(CO <sub>2</sub> Et)	CH=CH(C(O)NMe <sub>2</sub> )
CH=CH(2-MeO-Ph)	CH=CH(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	CH=CH( <i>i</i> -Pr)	CH=CH(4-MeO-Ph)
CH=CH(3-MeO-Ph)	CH=CH(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	CH=CH( <i>c</i> -Pr)	CH=CH(2-CF <sub>3</sub> O-Ph)
CH=CH(CF <sub>3</sub> )	CH=CH(3,5-二 Cl-Ph)		CH=CH(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1446] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

[1447]

$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$	$\underline{R}^1$
CH=CH(Ph)	CH=CH(2-F-Ph)	CH=CH(3-F-Ph)	CH=CH(4-F-Ph)
CH=CH(2-Me-Ph)	CH=CH(3-Me-Ph)	CH=CH(4-Me-Ph)	CH=CH(2-CF <sub>3</sub> -Ph)
CH=CH(3-CF <sub>3</sub> O-Ph)	CH=CH(4-CF <sub>3</sub> O-Ph)	CH=CH(Me)	CH=CH(Et)
CH=CH( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr))	CH=CH(C(O)Me)	CH=CH(CO <sub>2</sub> Et)	CH=CH(C(O)NMe <sub>2</sub> )
CH=CH(2-MeO-Ph)	CH=CH(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	CH=CH( <i>i</i> -Pr)	CH=CH(4-MeO-Ph)
CH=CH(3-MeO-Ph)	CH=CH(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	CH=CH( <i>c</i> -Pr)	CH=CH(2-CF <sub>3</sub> O-Ph)
CH=CH(CF <sub>3</sub> )	CH=CH(3,5-二 Cl-Ph)		CH=CH(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)

[1448] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基

[1449]

$\underline{R}^1$ CH=CH(Ph) CH=CH(2-Me-Ph) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) CH=CH(2-MeO-Ph) CH=CH(3-MeO-Ph) CH=CH(CF <sub>3</sub> )	$\underline{R}^1$ CH=CH(2-F-Ph) CH=CH(3-Me-Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(C(O)Me) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ CH=CH(3-F-Ph) CH=CH(4-Me-Ph) CH=CH(Me) CH=CH(CO <sub>2</sub> Et) CH=CH( <i>i</i> -Pr) CH=CH( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ CH=CH(4-F-Ph) CH=CH(2-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(Et) CH=CH(C(O)NMe <sub>2</sub> ) CH=CH(4-MeO-Ph) CH=CH(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	--	--

[1450] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

[1451] $\underline{R}^1$ CH=CH(Ph)	$\underline{R}^1$ CH=CH(2-F-Ph)	$\underline{R}^1$ CH=CH(3-F-Ph)	$\underline{R}^1$ CH=CH(4-F-Ph)
---------------------------------------	------------------------------------	------------------------------------	------------------------------------

[1452]

CH=CH(2-Me-Ph) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) CH=CH(2-MeO-Ph) CH=CH(3-MeO-Ph) CH=CH(CF <sub>3</sub> )	CH=CH(3-Me-Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(C(O)Me) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(3,5-二 Cl-Ph)	CH=CH(4-Me-Ph) CH=CH(Me) CH=CH(CO <sub>2</sub> Et) CH=CH( <i>i</i> -Pr) CH=CH( <i>c</i> -Pr)	CH=CH(2-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(Et) CH=CH(C(O)NMe <sub>2</sub> ) CH=CH(4-MeO-Ph) CH=CH(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	--	--

[1453] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

[1454]

$\underline{R}^1$ CH=CH(Ph) CH=CH(2-Me-Ph) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) CH=CH(2-MeO-Ph) CH=CH(3-MeO-Ph) CH=CH(CF <sub>3</sub> )	$\underline{R}^1$ CH=CH(2-F-Ph) CH=CH(3-Me-Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(C(O)Me) CH=CH(3-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(4-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ CH=CH(3-F-Ph) CH=CH(4-Me-Ph) CH=CH(Me) CH=CH(CO <sub>2</sub> Et) CH=CH( <i>i</i> -Pr) CH=CH( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ CH=CH(4-F-Ph) CH=CH(2-CF <sub>3</sub> -Ph) CH=CH(Et) CH=CH(C(O)NMe <sub>2</sub> ) CH=CH(4-MeO-Ph) CH=CH(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) CH=CH(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	--	--

[1455] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[1456]

$\underline{R}^1$ C≡CPh C≡C(2-Me-Ph) C≡C(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) C≡C(2-MeO-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^1$ C≡C(2-F-Ph) C≡C(3-Me-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡CC(O)Me C≡C(3-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ C≡C(3-F-Ph) C≡C(4-Me-Ph) C≡CMe C≡CCO <sub>2</sub> Et C≡C( <i>i</i> -Pr) C≡C(4-MeO-Ph) C≡C(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ C≡C(4-F-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CEt C≡CC(O)NMe <sub>2</sub> C≡C(3-MeO-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	---	---

[1457] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

[1458]

$\underline{R}^1$ C≡CPh C≡C(2-Me-Ph) C≡C(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) C≡C(2-MeO-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^1$ C≡C(2-F-Ph) C≡C(3-Me-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡CC(O)Me C≡C(3-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ C≡C(3-F-Ph) C≡C(4-Me-Ph) C≡CMe C≡CCO <sub>2</sub> Et C≡C( <i>i</i> -Pr) C≡C(4-MeO-Ph) C≡C(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ C≡C(4-F-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CEt C≡CC(O)NMe <sub>2</sub> C≡C(3-MeO-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	---	---

[1459] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

[1460]

$\underline{R}^1$ C≡CPh C≡C(2-Me-Ph) C≡C(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) C≡C(2-MeO-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^1$ C≡C(2-F-Ph) C≡C(3-Me-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡CC(O)Me C≡C(3-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ C≡C(3-F-Ph) C≡C(4-Me-Ph) C≡CMe C≡CCO <sub>2</sub> Et C≡C( <i>i</i> -Pr) C≡C(4-MeO-Ph) C≡C(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ C≡C(4-F-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CEt C≡CC(O)NMe <sub>2</sub> C≡C(3-MeO-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	---	---

[1461] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

[1462]

$\underline{R}^1$ C≡CPh C≡C(2-Me-Ph) C≡C(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) C≡C(2-MeO-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^1$ C≡C(2-F-Ph) C≡C(3-Me-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡CC(O)Me C≡C(3-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ C≡C(3-F-Ph) C≡C(4-Me-Ph) C≡CMe C≡CCO <sub>2</sub> Et C≡C( <i>i</i> -Pr) C≡C(4-MeO-Ph) C≡C(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ C≡C(4-F-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CEt C≡CC(O)NMe <sub>2</sub> C≡C(3-MeO-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	---	---

[1463] Z 为直接键 ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

[1464]

$\underline{R}^1$ C≡CPh C≡C(2-Me-Ph) C≡C(3-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)) C≡C(2-MeO-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CCF <sub>3</sub>	$\underline{R}^1$ C≡C(2-F-Ph) C≡C(3-Me-Ph) C≡C(4-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡CC(O)Me C≡C(3-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡C( <i>c</i> -Pr)	$\underline{R}^1$ C≡C(3-F-Ph) C≡C(4-Me-Ph) C≡CMe C≡CCO <sub>2</sub> Et C≡C( <i>i</i> -Pr) C≡C(4-MeO-Ph) C≡C(3,5-二 Cl-Ph)	$\underline{R}^1$ C≡C(4-F-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> -Ph) C≡CEt C≡CC(O)NMe <sub>2</sub> C≡C(3-MeO-Ph) C≡C(2-CF <sub>3</sub> O-Ph) C≡C(3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph)
--	--	---	---

[1465] Z 为 0 ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[1466]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1467] Z 为 0 ; R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

[1468]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1469] Z 为 0 ; R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

[1470]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1471] Z 为 0 ; R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

[1472]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1473] Z 为 0 ; R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

[1474]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1475] Z 为 NMe ; R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[1476]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1477] Z 为 NMe ;R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

[1478]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1479] Z 为 NMe ;R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

[1480]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1481] Z 为 NMe ;R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

[1482]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1483] Z 为 NMe ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

[1484]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1485] *c*-Pr | 3-MeO-Ph | 4-CF<sub>3</sub>-Ph | | |

[1486] Z 为 C(O) ;R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[1487]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1488] Z 为 C(0); R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

[1489]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1490] Z 为 C(0); R<sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基

[1491]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1492] Z 为 C(0); R<sup>2</sup> 为 5-嘧啶基

[1493]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1494] Z 为 C(0); R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-嘧啶基

[1495]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1496] Z 为 C(0)NMe; R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1497]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1498] Z 为 C(O)NMe ;R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

[1499]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1500] Z 为 C(O)NMe ;R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

[1501]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1502] Z 为 C(O)NMe ;R<sup>2</sup> 为 5- 嘧啶基

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph

[1504]

3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1505] Z 为 C(O)NMe ;R<sup>2</sup> 为 2- 甲基 -5- 嘧啶基

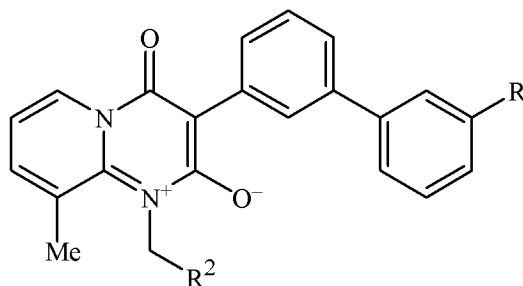
[1506]

$\underline{R}^1$ pH	$\underline{R}^1$ 2-F-Ph	$\underline{R}^1$ 3-F-Ph	$\underline{R}^1$ 4-F-Ph	$\underline{R}^1$ 2-MeO-Ph	$\underline{R}^1$ 4-MeO-Ph
2-Me-Ph	3-Me-Ph	4-Me-Ph	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CF <sub>3</sub> O-Ph
3-CF <sub>3</sub> O-Ph	4-CF <sub>3</sub> O-Ph	Me	Et	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>c</i> -Pr-2-( <i>c</i> -Pr)	C(O)Me	CO <sub>2</sub> Et	C(O)NMe <sub>2</sub>	3,5-二 Cl-Ph	3-(2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -Ph)Ph
<i>c</i> -Pr	3-MeO-Ph	4-CF <sub>3</sub> -Ph			

[1507] 表 30

[1508]





[1509] R<sup>2</sup> 为 2- 氯 -5- 噻唑基

[1510]

<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
Br	CH <sub>2</sub> F	O- <i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	6-Cl-3-吡啶基
I	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-F-3-吡啶基
Me	OMe	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
Et	OEt	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	3-Me-5-异噻唑基
<i>c</i> -Pr	O- <i>n</i> -Pr	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
pH	OPh	SCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	3-ClPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1511] R<sup>2</sup> 为 6- 氯 -3- 吡啶基

<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
Br	CH <sub>2</sub> F	O- <i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	6-Cl-3-吡啶基

[1513]

I	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-F-3-吡啶基
Me	OMe	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
Et	OEt	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	3-Me-5-异噻唑基
<i>c</i> -Pr	O- <i>n</i> -Pr	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
pH	OPh	SCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	3-ClPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1514] R<sup>2</sup> 为 6- 氟 -3- 吡啶基

[1515]

<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
Br	CH <sub>2</sub> F	O- <i>i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	6-Cl-3-吡啶基
I	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-F-3-吡啶基
Me	OMe	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
Et	OEt	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	3-Me-5-异噻唑基
<i>c</i> -Pr	O- <i>n</i> -Pr	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
pH	OPh	SCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	3-ClPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1516] R<sup>2</sup> 为 5- 噻唑基

[1517]

$\underline{R}$ Br	$\underline{R}$ CH <sub>2</sub> F	$\underline{R}$ O- <i>i</i> -Pr	$\underline{R}$ SCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)NHMe	$\underline{R}$ 6-Cl-3-吡啶基
I	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-F-3-吡啶基
Me	OMe	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
Et	OEt	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	3-Me-5-异噁唑基
<i>c</i> -Pr	O- <i>n</i> -Pr	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
pH	OPh	SCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	3-ClPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基 1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1518]  $R^2$  为 2-甲基-5-噻唑基

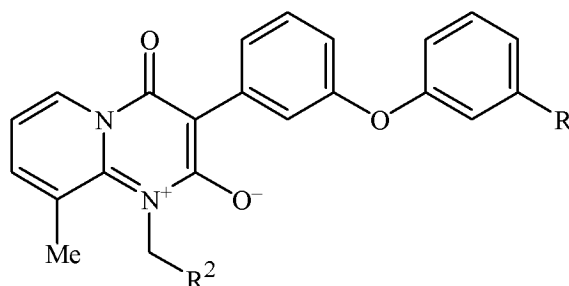
$\underline{R}$ Br	$\underline{R}$ CH <sub>2</sub> F	$\underline{R}$ O- <i>i</i> -Pr	$\underline{R}$ SCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)NHMe	$\underline{R}$ 6-Cl-3-吡啶基
I	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-F-3-吡啶基

[1520]

Me	OMe	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
Et	OEt	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	3-Me-5-异噁唑基
<i>c</i> -Pr	O- <i>n</i> -Pr	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
pH	OPh	SCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	3-ClPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基 1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1521] 表 31

[1522]



[1523]  $R^2$  为 2-氯-5-噻唑基

[1524]

$\underline{R}$ H	$\underline{R}$ <i>c</i> -Pr	$\underline{R}$ O- <i>i</i> -Pr	$\underline{R}$ SCF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ C(O)NHMe	$\underline{R}$ 3-ClPh
F	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-Cl-3-吡啶基
Cl	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	6-F-3-吡啶基
Br	CHF <sub>2</sub>	O- <i>c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	<i>N</i> -Me-4-吡唑基
I	OMe	OCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	3-Me-5-异噁唑基
Me	OEt	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	pH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
Et	O- <i>n</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	氰基	OPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基 1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1525] R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

[1526]

<u>R</u> H F	<u>R</u> <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	<u>R</u> O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	<u>R</u> SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	<u>R</u> C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R</u> 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup> O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氟基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 N-Me-4-吡啶基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1527] R<sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基

[1528]

<u>R</u> H F	<u>R</u> <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	<u>R</u> O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	<u>R</u> SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	<u>R</u> C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R</u> 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup> O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氟基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 N-Me-4-吡啶基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1529] R<sup>2</sup> 为 5-噻啶基

[1530]

<u>R</u> H F	<u>R</u> <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	<u>R</u> O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=CH <sup>2</sup>	<u>R</u> SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	<u>R</u> C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R</u> 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr	OCH <sub>2</sub> C≡CH <sup>2</sup> O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氟基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 N-Me-4-吡啶基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

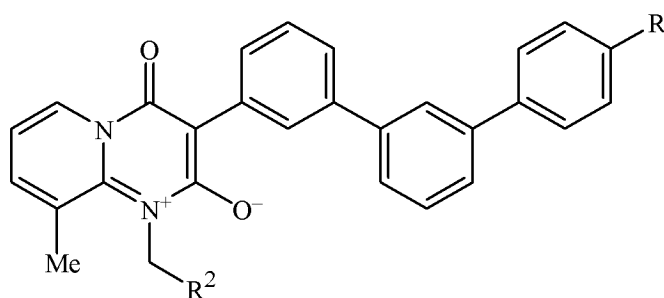
[1531] R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻啶基

[1532]

$\underline{R}$ H F	$\underline{R}$ <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=CH	$\underline{R}$ SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	$\underline{R}$ C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氟基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 <i>N</i> -Me-4-吡啶基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1533] 表 32

[1534]

[1535] R<sup>2</sup> 为 2-氯-5-噻唑基

[1536]

$\underline{R}$ H F	$\underline{R}$ <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	$\underline{R}$ O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=CH	$\underline{R}$ SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	$\underline{R}$ C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	$\underline{R}$ 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> -Pr	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氟基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 <i>N</i> -Me-4-吡啶基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1537] R<sup>2</sup> 为 6-氯-3-吡啶基

[1538]

<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
H	<i>c</i> -Pr	<i>O-i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	3-ClPh
F	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-Cl-3-吡啶基
Cl	CH <sub>2</sub> F	<sup>2</sup> OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	6-F-3-吡啶基
Br	CHF <sub>2</sub>	<i>O-c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
I	OMe	OCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	3-Me-5-异噁唑基
Me	OEt	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	pH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
Et	<i>O-n</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	氰基	OPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1539] R<sup>2</sup> 为 6-氟-3-吡啶基

[1540] R | R | R | R | R | R

[1541]

H	<i>c</i> -Pr	<i>O-i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	3-ClPh
F	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=C H <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-Cl-3-吡啶基
Cl	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	6-F-3-吡啶基
Br	CHF <sub>2</sub>	<i>O-c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
I	OMe	OCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	3-Me-5-异噁唑基
Me	OEt	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	pH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
Et	<i>O-n</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	氰基	OPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1542] R<sup>2</sup> 为 5-噻唑基

[1543]

<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>	<u>R</u>
H	<i>c</i> -Pr	<i>O-i</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	C(O)NHMe	3-ClPh
F	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=C H <sub>2</sub>	SCHF <sub>2</sub>	C(O)NMe <sub>2</sub>	6-Cl-3-吡啶基
Cl	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>2</sub> C≡CH	S(O)CF <sub>3</sub>	C(=NOMe)Me	6-F-3-吡啶基
Br	CHF <sub>2</sub>	<i>O-c</i> -Pr	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	<i>N</i> -Me-4-吡啶基
I	OMe	OCF <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Me	C≡CH	3-Me-5-异噁唑基
Me	OEt	OCHF <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	pH	6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基
Et	<i>O-n</i> -Pr	SCF <sub>3</sub>	氰基	OPh	4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基
					1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1544] R<sup>2</sup> 为 2-甲基-5-噻唑基

[1545]

<u>R</u> H F	<u>R</u> <i>c</i> -Pr CF <sub>3</sub>	<u>R</u> O- <i>i</i> -Pr OCH <sub>2</sub> CH=C H <sub>2</sub>	<u>R</u> SCF <sub>3</sub> SCHF <sub>2</sub>	<u>R</u> C(O)NHMe C(O)NMe <sub>2</sub>	<u>R</u> 3-ClPh 6-Cl-3-吡啶基
Cl Br I Me Et	CH <sub>2</sub> F CHF <sub>2</sub> OMe OEt O- <i>n</i> - Pr	OCH <sub>2</sub> C≡CH O- <i>c</i> -Pr OCF <sub>3</sub> OCHF <sub>2</sub> SCF <sub>3</sub>	S(O)CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me CO <sub>2</sub> Et 氰基	C(=NOMe)Me CH=CH <sub>2</sub> C≡CH pH OPh	6-F-3-吡啶基 <i>N</i> -Me-4-吡唑基 3-Me-5-异噁唑基 6-(6-Cl-3-吡啶基)-3-吡啶基 4-CF <sub>3</sub> -2-噻唑基  1-Me-4-CF <sub>3</sub> -2-咪唑基

[1546] 本发明的化合物一般将用作组合物即制剂中的无脊椎害虫防治活性成分,所述组合物具有至少一种用作载体的附加组分,所述附加组分选自表面活性剂,固体稀释剂和液体稀释剂。选择所述制剂或组合物成分,以与所述活性成分的物理特性,施用方式和环境因素(如土壤类型,湿度和温度)相一致。

[1547] 有用的制剂包括液体和固体组合物。液体组合物包括溶液(包括乳油),悬浮液,乳液(包括微乳液和/或悬乳液)等,它们可以任选地被稠化成凝胶。水性液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、悬浮液浓缩物、胶囊悬浮液、浓缩乳液、微乳液和悬乳液。非水性液体组合物的一般类型为乳油,可微乳化的浓缩物,可分散浓缩物和油分散体。

[1548] 固体组合物的一般类型为粉剂、粉末、颗粒、粒料、球粒、锭剂、片剂、填充薄膜(包括种子包衣)等,它们可以是水分散性的(“可润湿的”)或水溶性的。由成膜溶液或可流动的悬浮液形成的膜和包衣尤其可用于种子处理。活性成分可被(微)胶囊包封,并且进一步形成悬浮液或固体制剂;作为另外一种选择,可将整个活性成分制剂胶囊包封(或“包覆”)。胶囊包封可以控制或延迟活性成分的释放。可乳化的颗粒结合了乳油制剂和干颗粒制剂两者的优点。高浓度组合物主要用作其它制剂的中间体。

[1549] 可喷雾的制剂通常在喷雾之前分散在合适的介质中。将此类液体和固体制剂配制成易于在喷雾介质(通常是水)中稀释的制剂。喷雾体积的范围可以为每公顷约一升至数千升,但更通常为每公顷约十至数百升。可喷雾的制剂可在水槽中与水或另一种合适的介质混合,用于通过空气或地面喷药处理叶子,或者施用到植物的生长介质中。液体和干制剂可以直接定量加入到滴灌系统中,或者在种植期间定量加入到垄沟中。液体和固体制剂可以在种植之前的种子处理时施用于作物和其它期望的植物的种子上,以便通过全身吸收来保护发育中的根和其它地面下的植物部分和/或叶。

[1550] 所述制剂通常将包含有效量的活性成分,稀释剂和表面活性剂,其在如下的大概的范围内,总和为按重量计 100%。

		重量百分比		
		活性成分	稀释剂	表面活性剂
[1551]	水分散性的和水溶性的颗粒,片剂和粉末	0.001-90	0-99.999	0-15

	油分散体, 悬浮液, 乳液, 溶液 (包括乳油)	1-50	40-99	0-50
[1552]	粉剂	1-25	70-99	0-5
	颗粒和粒料	0.001-95	5-99.999	0-15
	高浓度组合物	90-99	0-10	0-2

[1553] 固体稀释剂包括例如粘土例如膨润土, 蒙脱石, 绿坡缕石和高岭土, 石膏, 纤维素, 二氧化钛, 氧化锌, 淀粉, 糊精, 糖 (例如乳糖, 蔗糖), 硅石, 滑石, 云母, 硅藻土, 尿素, 碳酸钙, 碳酸钠和碳酸氢钠以及硫酸钠。典型的固体稀释剂描述于 Watkins 等人的 Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers 第 2 版 (Dorland Books, Caldwell, New Jersey) 中。

[1554] 液体稀释剂包括, 例如, 水、N, N- 二甲基烷酰胺 (例如 N, N- 二甲基甲酰胺)、柠檬烯、二甲基亚砷、N- 烷基吡咯烷酮 (例如 N- 甲基吡咯烷酮)、乙二醇、三甘醇、丙二醇、双丙二醇、聚丙二醇、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯、石蜡 (例如白矿物油、正链烷烃、异链烷烃)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨醇、甘油三乙酸酯、芳烃、脱芳构化脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮 (如环己酮、2- 庚酮、异佛尔酮和 4- 羟基 -4- 甲基 -2- 戊酮)、乙酸酯 (如乙酸异戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷基酯和乙酸异冰片酯)、其它酯 (如烷基化乳酸酯、二元酯和  $\gamma$ - 丁内酯)、并且可以是直链、支链、饱和或不饱和的醇 (如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、正己醇、2- 乙基己醇、正辛醇、癸醇、异癸醇、异十八醇、鲸蜡醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、环己醇、四氢糠醇、双丙酮醇和苜醇)。液体稀释剂还包括饱和的和饱和的脂肪酸 (通常为  $C_6-C_{22}$ ) 的甘油酯, 如植物种子和果实的油 (例如橄榄油、蓖麻油、亚麻籽油、芝麻油、玉米油、花生油、葵花籽油、葡萄籽油、红花油、棉籽油、豆油、油菜籽油、椰子油和棕榈仁油), 动物源脂肪 (例如牛脂、猪脂、猪油、鲑鱼肝油、鱼油), 以及它们的混合物。液体稀释剂还包括烷基化 (例如甲基化、乙基化、丁基化) 的脂肪酸, 其中脂肪酸可以通过源自植物和动物的甘油酯的水解获得, 并且可通过蒸馏进行纯化。典型的液体稀释剂描述于 Marsden 的 Solvents Guide 第 2 版 (Interscience, New York, 1950) 中。

[1555] 本发明的固体和液体组合物通常包含一种或多种表面活性剂。当加到液体中时, 表面活性剂 (也被称为“具有表面活性的试剂”) 通常改变, 最通常降低液体的表面张力。根据表面活性剂分子中的亲水基团和亲油基团的性质, 表面活性剂可用作润湿剂, 分散剂, 乳化剂或消泡剂。

[1556] 表面活性剂可分为非离子, 阴离子或阳离子表面活性剂。可用于本组合物的非离子表面活性剂包括但不限于: 醇烷氧基化物, 如基于天然和合成醇 (其为支化的或直链的) 并且由醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备的醇烷氧基化物; 胺乙氧基化、链烷醇酰胺和乙氧基化的链烷醇酰胺; 烷氧基化的甘油三酯, 如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油; 烷基酚烷氧基化物, 如辛基苯酚乙氧基化物、壬基苯酚乙氧基化物、二壬基苯酚乙氧基化物和十二烷基苯酚乙氧基化物 (由苯酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备); 由环氧乙烷或环氧丙烷制备的嵌段聚合物和其中末端嵌段环氧丙烷制备的由反向嵌段聚合物; 乙氧基化的脂肪酸; 乙氧基化的脂肪族酯和油; 乙氧基化的甲酯; 乙氧基化的三苯乙烯基苯酚 (包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备的那些); 脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂基的衍生物、多乙氧基化酯, 如多乙氧基化的脱水

山梨糖醇脂肪酸酯、多乙氧基化的山梨醇脂肪酸酯和多乙氧基化的甘油脂肪酸酯；其它脱水山梨糖醇衍生物，如脱水山梨糖醇酯；聚合的表面活性剂，如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸 PEG（聚乙二醇）树脂、接枝或梳状聚合物和星形聚合物；聚乙二醇（PEG）；聚乙二醇脂肪酸酯；硅酮基的表面活性剂；和糖衍生物，如蔗糖酯、烷基聚葡萄糖苷和烷基多糖。

[1557] 可用的阴离子表面活性剂包括但不限于：烷基芳基磺酸和它们的盐；羧化的醇或烷基苯酚乙氧基化物；二苯基磺酸酯衍生物；木质素和木质素衍生物，如木质素磺酸盐；马来酸或琥珀酸或它们的酸酐；烯烴磺酸酯；磷酸酯，诸如醇烷氧基化物的磷酸酯，烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯；蛋白质基的表面活性剂；肌氨酸衍生物；苯乙烯基苯酚醚硫酸盐；油和脂肪酸的硫酸盐和磺酸盐；乙氧基化烷基酚的硫酸盐和磺酸盐；醇的硫酸盐；乙氧基化醇的硫酸盐；胺和酰胺的磺酸盐，如 N，N- 烷基牛磺酸盐；苯、异丙基、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐；缩聚萘的磺酸盐；萘和烷基萘的磺酸盐；石油馏分的磺酸盐；磺基琥珀酰胺酸盐；以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物，如二烷基磺基琥珀酸盐。

[1558] 可用的阳离子表面活性剂包括但不限于：酰胺和乙氧基化酰胺；胺，如 N- 烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺、以及乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺（由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制得）；胺盐，如胺乙酸盐和二胺盐；季铵盐，如季盐、乙氧基化季盐和二季盐；以及胺氧化物，如烷基二甲基胺氧化物和二-(2-羟基乙基)-烷基胺氧化物。

[1559] 还可用于本发明的组合物的是非离子表面活性剂和阴离子表面活性剂的混合物，或非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂的混合物。非离子、阴离子和阳离子表面活性剂及其推荐应用公开于多种已公布的参考文献中，包括由 McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版的 McCutcheon's Emulsifiers and Detergents（北美和国际年鉴版）；Sisely 和 Wood 的 Encyclopedia of Surface Active Agents（Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964）；以及 A. S. Davidson 和 B. Milwidsky 的“Synthetic Detergents”第七版（John Wiley and Sons, New York, 1987）。

[1560] 本发明的组合物还可包含本领域技术人员已知为辅助制剂的制剂助剂和添加剂（其中一些也可被认为是起到固体稀释剂，液体稀释剂或表面活性剂作用的）。此类制剂助剂和添加剂可控制：pH（缓冲剂）、加工过程中的起泡（消泡剂，如聚有机硅氧烷）、活性成分的沉降（悬浮剂）、粘度（触变增稠剂）、容器内的微生物生长（抗微生物剂）、产品冷冻（防冻剂）、颜色（染料/颜料分散体）、洗脱（成膜剂或粘合剂）、蒸发（防蒸发剂）、以及其它制剂属性。成膜剂包括例如聚乙酸乙烯酯，聚乙酸乙烯酯共聚物，聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物，聚乙烯醇，聚乙烯醇共聚物和蜡。制剂助剂和添加剂的实例包括由 McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版的 McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, 北美和国际年鉴版；和 PCT 公开 W0 03/024222 中列出的那些。

[1561] 通常通过将活性成分溶于溶剂中或通过液体或干稀释剂中研磨活性成分将式 1 的化合物和任何其它的活性成分掺入到本发明的组合物中。可通过简单地混合所述成分来制备溶液，包括乳油。如果将用作乳油的液体组合物的溶剂是与水不混溶的，则通常加入乳化剂使含有活性成分的溶剂在用水稀释时发生乳化。可使用介质磨来湿研磨粒径



为至多 2,000  $\mu\text{m}$  的活性成分浆液,以获得平均直径低于 3  $\mu\text{m}$  的颗粒。水性浆体可以制备为成品悬浮液浓缩物(参见例如 U. S. 3,060,084)或通过喷雾干燥而进一步加工为可在水中分散的颗粒。干制剂通常需要干研磨步骤,其产生 2 至 10  $\mu\text{m}$  范围内的平均粒径。粉剂和粉末可以通过混合,通常通过研磨(例如用锤磨或流体能磨)制备。可通过将活性物质喷雾在预成形颗粒载体上或通过附聚技术来制备颗粒和粒料。参见 Browning 的“Agglomeration”(Chemical Engineering,1967 年 12 月 4 日,第 147-48 页)、Perry 的“Chemical Engineer’s Handbook”第 4 版(McGraw-Hill,New York,1963,第 8-57 页及其后页)和 WO 91/13546。粒料可以如 U. S. 4,172,714 中所述来制备。水分散性的颗粒和水溶性的颗粒可以如 U. S. 4,144,050, U. S. 3,920,442 和 DE 3,246,493 中所教导的来制备。片剂可以如 U. S. 5,180,587, U. S. 5,232,701 和 U. S. 5,208,030 中所教导的来制备。膜剂可以如 GB 2,095,558 和 U. S. 3,299,566 中所教导的来制备。

[1562] 与配制领域相关的其它信息,参见 T. S. Woods 的“The Formulator’s Toolbox Product Forms for Modern Agriculture”(Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food Environment Challenge, T. Brooks 和 T. R. Roberts 编辑, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge,1999,第 120-133 页。还参见 U. S. 3,235,361,第 6 栏,第 16 行至第 7 栏,第 19 行和实施例 10-41 ;U. S. 3,309,192,第 5 栏,第 43 行至第 7 栏,第 62 行和实施例 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 行和实施例 1-4 ;Klingman 的 Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York,1961 年,第 81-96 页 ;Hance 等人的 Weed Control Handbook,第 8 版, Blackwell Scientific Publications, Oxford,1989 年 ;和 Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK,2000 年。

[1563] 在下列实施例中,所有制剂均以常规的方式制备。化合物编号与索引表 A-E 中的化合物相关。无需进一步详尽说明,据信本领域的技术人员使用以上所述内容可将本发明利用至最大限度。因此,以下实施例应理解为仅是例证性的,而不以任何方式限制本发明的公开内容。百分比为重量百分比,除非另外说明。

[1564] 实施例 A

[1565] 高浓度浓缩物

[1566] 化合物 30 98.5%

[1567] 二氧化硅气凝胶 0.5%

[1568] 合成无定形精细二氧化硅 1.0%

[1569] 实施例 B

[1570] 可湿性粉末

[1571]

化合物 50	65.0%
十二烷基苯酚聚乙二醇醚	2.0%
木质素磺酸钠	4.0%
硅酸铝钠	6.0%
蒙脱石(锻烧过的)	23.0%

[1572] 实施例 C

[1573]	<u>颗粒</u>	
[1574]	化合物 113	10.0%
[1575]	绿坡缕石颗粒（低挥发性物质,0.71/0.30mm ;U. S. S.	90.0%
[1576]	No. 25-50 筛目）	
[1577]	<u>实施例 D</u>	
[1578]	<u>挤出的粒料</u>	
[1579]		
	化合物 191	25.0%
	无水硫酸钠	10.0%
	粗木质素磺酸钙	5.0%
[1580]		
	烷基萘磺酸钠	1.0%
	钙/镁膨润土	59.0%
[1581]	<u>实施例 E</u>	
[1582]	<u>可乳化浓缩物</u>	
[1583]	化合物 231	10.0%
[1584]	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	20.0%
[1585]	C <sub>6</sub> -C <sub>10</sub> 脂肪酸甲酯	70.0%
[1586]	<u>实施例 F</u>	
[1587]	<u>微乳液</u>	
[1588]		
	化合物 254	5.0%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
	烷基多苷	30.0%
	油酸单甘油酯	15.0%
	水	20.0%
[1589]	<u>实施例 G</u>	
[1590]	<u>种子处理剂</u>	
[1591]		
	化合物 289	20.00%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
	褐煤酸蜡	5.00%
	木质素磺酸钙	1.00%
	聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
	硬脂醇（POE 20）	2.00%
	聚有机硅	0.20%
	着色剂红色染料	0.05%
	水	65.75%
[1592]	<u>实施例 H</u>	
[1593]	<u>肥料棍</u>	
[1594]		

	化合物 352	2.50%
	吡咯烷酮-苯乙烯共聚物	4.80%
	三苯乙烯基苯基 16-乙氧基化物	2.30%
	滑石	0.80%
	玉米淀粉	5.00%
	缓释肥料	36.00%
	高岭土	38.00%
	水	10.60%
[1595]	<u>实施例 I</u>	
[1596]	<u>悬浮液浓缩物</u>	
[1597]		
	化合物 30	35%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸类聚合物	1.0%
	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	硅酮基的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	水	53.7%
[1598]	<u>实施例 J</u>	
[1599]	<u>水乳液</u>	
[1600]		
	化合物 50	10.0%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸类聚合物	1.0%
	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	硅酮基的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	芳族石油基烃	20.0
	水	58.7%
[1601]	<u>实施例 K</u>	
[1602]	<u>油分散体</u>	
[1603]		
	化合物 30	25%
	六油酸聚氧乙烯山梨醇酯	15%
	有机改性的膨润土粘土	2.5%
	脂肪酸甲酯	57.5%
[1604]	<u>实施例 L</u>	
[1605]	<u>悬乳液</u>	
[1606]		

化合物 50	10.0%
吡虫啉	5.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸类聚合物	1.0%
黄原胶	0.1%
丙二醇	5.0%
硅酮基的消泡剂	0.1%
1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
芳族石油基烃	20.0%
水	53.7%

[1607] 本发明的化合物表现出抗广谱无脊椎害虫活性。这些害虫包括栖息于多种环境诸如植物叶,根,土壤,收割的作物或其它食品,建筑物或动物皮毛中的无脊椎害虫。这些害虫包括例如以叶子(包括叶片,茎秆,花朵和果实),种子,木材,纺织物纤维或动物血液或组织为食的无脊椎害虫,这些害虫对例如生长或储藏的农作物,森林作物,温室作物,观赏植物,苗圃作物,储藏的食品或纤维产品,或住房或其它结构或它们的内容物造成损坏或损害,或对动物健康或公共卫生有害。本领域的技术人员将会知道,不是所有的化合物均对所有害虫的整个生长阶段具有同样的效果。

[1608] 因此,这些本发明的化合物和组合物在农学上可用于保护大田作物免受食植性无脊椎害虫的侵害,并且还可在非农学上用于保护其它园艺作物和植物免受食植性无脊椎害虫的侵害。此用途包括保护包含基因工程(即转基因)或诱变改性引入而提供有利特征的遗传物质的作物和其它植物(即农学和非农学)。此类特征的实例包括耐除草剂,耐食植性害虫(例如昆虫,螨虫,蚜虫,蜘蛛,线虫,蜗牛,植物病原真菌,细菌和病毒),植物生长性改善,对不利生长环境(诸如高温或低温,低土壤湿度或高土壤湿度,和高盐度)的耐受性增强,开花或结果提高,收获量增大,成熟更快,所收获产品的质量/或营养价值更高,或所收获产品的储藏或加工性改善。可将转基因植物改性,以表达多种特征。包含由基因工程或诱变提供的特征的植物实例包括表达除虫性苏云金芽孢杆菌毒素的各种玉米、棉花、大豆和马铃薯,如 YIELD GARD<sup>®</sup>, KNOCKOUT<sup>®</sup>, STARLINK<sup>®</sup>, BOLLGARD<sup>®</sup>, NuCOTN<sup>®</sup>和 NEWLEAF<sup>®</sup>,和各种耐除草剂的玉米、棉花、大豆和油菜籽,如 ROUNDUP READY<sup>®</sup>, LIBERTY LINK<sup>®</sup>, IMI<sup>®</sup>, STS<sup>®</sup>和 CLEARFIELD<sup>®</sup>,以及表达N-乙酰基转移酶(GAT)以提供对草甘膦除草剂抗性的作物,或包含HRA基因,提供对除草剂的抗性,抑制乙酰乳酸合酶(ALS)的作物。本发明的化合物和组合物可与由基因工程或诱变改性引入的特征协同相互作用,从而增强特征的表型表现或效果,或增强本发明的化合物和组合物的无脊椎害虫防治效果。具体地讲,本发明的化合物和组合物可与对无脊椎害虫具有毒性的蛋白质或其它天然产品的表型表现协同相互作用,以提供对这些害虫的大于累加的防治效果。

[1609] 本发明的组合物还可任选地包含植物营养素,例如包含至少一种植物营养素的肥料组合物,所述植物营养素选自氮、磷、钾、硫、钙、镁、铁、铜、硼、锰、锌和钼。值得注意的是包含至少一种肥料组合物的组合物,所述肥料组合物包含至少一种选自氮、磷、钾、硫、钙和镁的植物营养素。还包含至少一种植物营养素的本发明的组合物可为液体或固体形式。值

得注意的是颗粒、小棍或片剂形式的固体制剂。通过将本发明的化合物或组合物与肥料组合物以及配制成分一起混合,然后由诸如成粒或挤出的方法制得制剂,来制备包含肥料组合物的固体制剂。作为另外一种选择,通过将本发明的化合物或组合物在挥发性溶剂中的溶液或悬浮液喷雾到先前制得的尺寸稳定的混合物形式(例如颗粒,小棍或片剂)的肥料组合物上,然后蒸发溶剂,制得固体制剂。

[1610] 农学或非农学无脊椎害虫的实例包括鳞翅目害虫的卵、幼虫和成虫,诸如夜蛾科粘虫、毛虫、尺蠖和棉铃虫(例如大螟(*Sesamia inferens* Walker)、玉米螟(*Sesamia nonagrioides* Lefebvre)、南部灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania* Cramer)、秋粘虫(*Spodoptera fugiperda* J.E. Smith)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner)、棉叶虫(*Spodoptera littoralis* Boisduval)、黄带粘虫(*Spodoptera ornithogalli* Guenée)、小地老虎(*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis* Hübner)、绿果夜蛾(*Lithophane antennata* Walker)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae* Linnaeus)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens* Walker)、卷心菜尺蠖(*Trichoplusia ni* Hübner)、烟草蚜虫(*Heliothis virescens* Fabricius));钻蛀虫、鞘蛾、结网毛虫、松果梢斑螟、菜青虫和得自螟蛾科的雕叶虫(如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis* Hübner)、脐橙螟(*Amyelois transitelka* Walker)、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens)、草地螟(螟蛾科:草螟亚科),如稻切叶野螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker)、甘蔗二点螟(*Chilo infuscatellus* Snellen)、番茄小钻蛀虫(*Neoleucinodes elegantalis* Guenée)、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocerus medinalis*)、葡萄卷叶虫(*Desmia funeralis* Hübner)、甜瓜野螟(*Diaphania nitidalis* Stoll)、卷心菜芯蛴螬(*Hellualahydralis* Guenée)、三化螟(*Scirpophaga incertulas* Walker)、早苗钻蛀虫(*Scirpophaga infuscatellus* Snellen)、白色钻蛀虫(*Scirpophaga innotata* Walker)、顶苗钻蛀虫(*Scirpophaga nivella* Fabricius)、稻多丽螟(*Chilo polychrysus* Meyrick)、卷心菜簇毛虫(*Crociodomia binotalis* English));卷叶蛾科的卷叶虫、蚜虫、种子蠕虫和果虫(如苹果小卷蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)、葡萄浆果蛾(*Endopiza viteana* Clemens)、梨小食心虫(*Grapholita molesta* Busck)、苹果异形小卷蛾(*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick)、柑橘类钻蛀虫(*Ecdytolopha aurantiana* Lima)、红带卷蛾(*Argyrotaenia velutinana* Walker)、玫瑰带纹卷叶蛾(*Choristoneura rosaceana* Harris)、苹果浅褐卷叶蛾(*Epiphyas postvittana* Walker)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella* Hübner)、苹果顶芽卷叶蛾(*Pandemis pyrusana* Kearfott)、杂食卷叶蛾(*Platynotastultana* Walsingham)、条纹的果树卷叶蛾(*Pandemis cerasana* Hübner)、苹褐卷叶蛾(*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller));和许多其它经济上重要的鳞翅目(如小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders)、舞毒蛾(*Lymantria dispar* Linnaeus)、桃小食心虫(*Carposina niponensis* Walsingham)、桃条麦蛾(*Anarsia lineatella* Zeller)、马铃薯块茎蛾(*Phthorimaea operculella* Zeller)、点缘虫状潜叶虫(*Lithocolletis blancardella* Fabricius)、苹果金纹细蛾(*Lithocolletis ringoniella* Matsumura)、稻纵卷叶螟(*Lerodea eufala* Edwards)、旋纹潜叶蛾(*Leucoptera scitella* Zeller));蜚蠊目的卵、蛹和成虫,包括得自姬蠊科和蜚蠊科的蟑螂(如东方蜚蠊(*Blatta orientalis* Linnaeus)、亚洲蟑螂(*Blattella asahinai*

Mizukubo)、德国小蠊 (*Blattella germanica* Linnaeus)、褐带皮蠊 (*Supella longipalpa* Fabricius)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana* Linnaeus)、褐色蜚蠊 (*Periplaneta brunnea* Burmeister)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae* Fabricius); 黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa* Service)、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae* Fabr.)、龙虾蟑螂 (*Nauphoeta cinerea* Olivier) 和平滑蟑螂 (*Symploce pallens* Stephens); 鞘翅目的卵、叶片饲养、果实饲养、根饲养、种子饲养和囊泡组织饲养的幼虫和成虫, 包括得自长角象鼻虫科、豆象科和象甲科的象鼻虫 (如棉籽象鼻虫 (*Anthonomus grandis* Boheman)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、谷象 (*Sitophilus granarius* Linnaeus)、米象 (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); 早熟禾象鼻虫 (*Listronotus maculicollis* Dietz)、牧草长喙象 (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal)、猎长喙象 (*Sphenophorus venatusvestitus*)、丹佛象鼻虫 (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus); 叶甲科中的跳甲、守瓜、根虫、叶甲、马铃薯甲虫和潜叶虫 (如科罗拉多马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、西部玉米根虫 (*Diabrotica virgifera* LeConte)); 得自金龟子科的金龟子和其它甲虫 (如日本金龟子 (*Popillia japonica* Newman)、东方丽金龟 (*Anomala orientalis* Waterhouse)、*Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud)、北方独角仙 (*Cyclocephala borealis* Arrow)、南方独角仙 (*Cyclocephala immaculata* Olivier or *C. lurida* Bland)、蜣螂和蛴螬 (*Aphodius* 属)、黑金龟子 (*Ataenius spretulus* Haldeman)、绿金龟 (*Cotinis nitida* Linnaeus)、栗玛绒金龟 (*Maladera castanea* Arrow)、五月/六月鳃金龟 (*Phyllophaga* 属) 和欧洲金龟子 (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); 皮蠹科皮蠹; 叩头虫科线虫; 小蠹虫科树皮甲虫和拟步甲科面象虫。

[1611] 此外, 农学和非农学害虫包括: 革翅目的卵、成虫和幼虫, 包括蠹蛾科蠹蛾 (如欧洲球蛾 (*Forficula auricularia* Linnaeus)、黑蠹蛾 (*Chelisoche morio* Fabricius)); 半翅目和同翅目的卵、不成熟体、成虫和蛹如得自盲蝽科的盲蝽、蝉科蝉、叶蝉 (如 *Empoasca* 属)、臭虫科臭虫 (例如 *Cimex lectularius* Linnaeus)、蜡蝉科和稻虱科蜡蝉、角蝉科角蝉、木虱科木虱、粉虱科粉虱、蚜科蚜虫、根瘤蚜科根瘤蚜、粉蚧科粉蚧、介壳虫科、盾介壳虫科和硕介壳虫科蚧虫、网蝽科网蝽、蝽科椿象、长蝽科高粱长蝽 (例如毛长蝽 (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) 和南方麦小蝽 (*Blissus insularis* Barber)) 以及长蝽科其它长蝽、沫蝉科沫蝉、缘蝽科南瓜缘蝽、和红蝽科红蝽和污棉虫。

[1612] 农学和非农学害虫也包括: 蜱螨目 (螨虫类) 的卵、幼虫、蛹和成虫, 如叶螨科的叶螨和红螨 (如苹果红蜘蛛 (*Panonychus ulmi* Koch)、二斑叶螨 (*Tetranychus urticae* Koch)、麦氏叶螨 (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); 细须螨科中的葡萄短须螨 (如柑橘红蜘蛛 (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); 瘿螨科中的锈瘿和芽瘿以及其它叶片饲养螨虫和在人类和动物健康中重要的螨虫, 即表皮螨科中的尘螨、蠕形螨科中的蠕形螨、食甜螨科中的谷螨; 硬蜱科中通常已知为硬蜱的壁虱 (如鹿蜱 (*Ixodes scapularis* Say)、澳大利亚麻痹壁虱 (*Ixodes holocyclus* Neumann)、美洲犬蜱 (*Dermacentor variabilis* Say)、孤星蜱 (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) 和隐喙蜱科中通常已知为软蜱的壁虱 (如回归热 (*Ornithodoros turicata*)、普通鸡蜱 (*Argas radiatus*)); 痒螨科、蒲螨科和疥螨科中的痒螨和疥螨; 直翅目的卵、成虫和不成熟体, 包括蚱蜢、蝗虫和蟋蟀 (如迁移蚱蜢 (如血黑蝗, 特种蝗托马斯)、美洲蚱蜢 (如 *Schistocerca americana* Drury)、

沙漠蝗虫 (*Schistocerca gregaria* Forskal)、飞蝗 (*Locusta migratoria* Linnaeus)、矮树蝗虫 (*Zonocerus* 属)、家蟋蟀 (*Acheta domesticus* Linnaeus)、蝼蛄 (如黄褐蝼蛄 (*Scapteriscus vicinus* Scudder) 和南美蝼蛄 (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); 双翅目的卵、成虫和不成熟体, 包括潜叶虫 (如斑潜蝇属, 诸如蔬菜斑潜蝇 (*Liriomyza sativae* Blanchard)); 蠓、实蝇 (实蝇科)、眼蝇 (如黑麦秆蝇)、犹太粪蛆、普通家蝇 (如家蝇)、夏厕蝇 (如夏厕蝇, *F. Femoralis* Stein)、厩蝇 (如厩螯蝇)、牛蝇、角蝇、丽蝇 (如金蝇属、黑花蝇属) 和其它家蝇害虫、马虻 (如虻属)、肤蝇 (如马胃蝇属、狂蝇属)、牛皮蝇 (如牛皮蝇属)、鹿虻 (如斑虻属)、羊蝇 (如羊虱蝇) 和其它短角亚目; 蚊子 (如伊蚊属、疟蚊属、库蚊属)、墨蚊 (如原蚊属、蚊属)、铁蠓、白蛉、尖眼蕈蚊和其它长角亚目; 缨尾目的卵、成虫、不成熟体, 包括葱蓟马 (*Thrips tabaci* Lindeman)、花蓟马 (花蓟马属) 和其它叶片饲养蓟马; 膜翅目的昆虫害虫, 包括蚁科蚂蚁, 包括弓背蚁属 (*Camponotus floridanus* Buckley)、锈色大黑蚁 (*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、黑木工蚁 (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer)、白足狡臭蚁 (*Technomyrmex albipes* fr. Smith)、大头蚁 (*Pheidole* 属)、黑头酸臭蚁 (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); 法老蚁 (*Monomorium pharaonis* Linnaeus)、小火蚁 (*Wasmannia auropunctata* Roger)、火蚁 (*Solenopsis geminata* Fabricius)、入侵红火蚁 (*Solenopsis invicta* Buren)、阿根廷蚁 (*Iridomyrmex humilis* Mayr)、疯蚁 (*Paratrechina longicornis* Latreille)、铺道蚁 (*Tetramorium caespitum* Linnaeus)、玉米毛蚁 (*Lasius alienus* Förster) 和臭家蚁 (*Tapinoma sessile* Say)。其它膜翅目包括蜜蜂 (包括木匠蜂)、大胡蜂、胡蜂、黄蜂和锯蝇 (*Neodiprion* 属; *Cephus* 属); 等翅目的昆虫害虫, 包括白蚁科白蚁 (如大白蚁属, *Odontotermes obesus* Rambur)、木白蚁科 (如砂白蚁属) 和犀白蚁科 (如散白蚁属、乳白蚁属, 大别山散白蚁)、北美散白蚁 (北美散白蚁 Kollar)、西方散白蚁 (西方散白蚁 Banks)、乳白蚁 (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西印度群岛干木白蚁 (*Incisitermes immigrans* Snyder)、粉蠹白蚁 (*Cryptotermes brevis* Walker)、干木白蚁 (*Incisitermes snyderi* Light)、东南地下白蚁 (*Reticulitermes virginicus* Banks)、干木切白蚁 (*Incisitermes minor* Hagen)、树栖白蚁, 如象白蚁属和其它具有经济学重要性的白蚁; 缨尾目的昆虫害虫, 如衣鱼 (*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* Linnaeus)、雏鸡羽虱 (*Menacanthus stramineus* Nitzsch)、狗羽虱 (*Trichodectes canis* De Geer)、绒毛虱 (*Goniocotes gallinae* De Geer)、羊体虱 (*Bovicola ovis* Schrank)、牛盲虱 (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch)、长鼻牲畜虱 (*Linognathus vituli* Linnaeus) 和其它攻击人类和动物的吮吸和咀嚼虱子; 蚤目的昆虫害虫, 包括东方鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis* Rothschild)、猫蚤 (*Ctenocephalides felis* Bouche)、犬蚤 (*Ctenocephalides canis* Curtis)、鸡蚤 (*Ceratophyllus gallinae* Schrank)、吸着蚤 (*Echidnophaga gallinacea* Westwood)、人类跳蚤 (*Pulex irritans* Linnaeus) 和其它使哺乳动物和鸟类痛苦的跳蚤。附加的节肢动物害虫包括: 蜘蛛目蜘蛛, 如棕色隐士蛛 (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) 和黑寡妇毒蛛 (*Latrodectus mactans* Fabricius) 以及鞘翅目蜈蚣, 如蚰蜒 (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。

[1613] 储存的谷物的无脊椎害虫的实例包括大谷蠹 (*Prostephanus truncatus*)、小

谷蠹 (*Rhyzopertha dominica*)、米象 (*Stiophilus oryzae*)、玉米象鼻虫 (*Stiophilus zeamais*)、豇豆象鼻虫 (*Callosobruchus maculatus*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、谷象 (*Stiophilus granarius*)、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、地中海面象虫 (*Ephestia kuhniella*) 和长角扁谷盗或锈赤扁谷盗 (*Cryptolestis ferrugineus*)。

[1614] 本发明的化合物对抵抗以下鳞翅目害虫具有特别高的活性 (例如 *Alabama argillacea* Hübner (衣蛾)、*Archips argyrospila* Walker (果树卷叶蛾)、*A. rosana* Linnaeus (欧洲卷叶蛾)、以及其它黄卷蛾属物种、*Chilo suppressalis* Walker (水稻螟虫)、*Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (稻纵卷叶螟)、*Crambus caliginosellus* Clemens (玉米根部结网毛虫)、*Crambus teterrellus* Zincken (蓝草草螟)、*Cydia pomonella* Linnaeus (苹果小卷蛾)、*Earias insulana* Boisduval (金刚钻)、*Earias vittella* Fabricius (翠纹棉铃虫)、*Helicoverpa armigera* Hübner (美洲棉铃虫)、*Helicoverpa zea* Boddie (棉铃虫)、*Heliothis virescens* Fabricius (烟草蚜虫)、*Herpetogramma licarsisalis* Walker (草地螟)、*Lobesiabotrana* Denis & Schiffermüller (葡萄浆果蛾)、*Pectinophora gossypiella* Saunders (棉红铃虫)、*Phyllocnistis citrella* Stainton (柑橘类潜叶虫)、*Pieris brassicae* Linnaeus (大菜粉蝶)、*Pieris rapae* Linnaeus (菜白蛾)、*Plutella xylostella* Linnaeus (小菜蛾)、*Spodoptera exigua* Hübner (甜菜夜蛾)、*Spodoptera litura* Fabricius (斜纹夜蛾、茶蚕)、*Spodoptera frugiperda* J.E. Smith (秋粘虫)、*Trichoplusia ni* Hübner (甘蓝银纹夜蛾) 和 *Tuta absoluta* Meyrick (番茄斑潜蝇))。

[1615] 本发明的化合物还在得自同翅目的成员上具有显著活性,所述同翅目包括:*Acyrtosiphon pisum* Harris (豆长管蚜)、*Aphis craccivora* Koch (黑豆蚜)、*Aphis fabae* Scopoli (蚕豆蚜)、*Aphis gossypii* Glover (棉蚜,瓜蚜)、*Aphis pomi* De Geer (苹果蚜)、*Aphis spiraecola* Patch (卷叶蚜)、*Aulacorthum solani* Kaltenbach (茄无网长管蚜)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (草莓蚜)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (俄罗斯小麦蚜)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini (红苹果蚜)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann (苹果绵蚜)、*Hyalopterus pruni* Geoffroy (桃大尾蚜)、*Lipaphis erysimi* Kaltenbach (萝卜蚜)、*Metopolophium dirrhodum* Walker (麦蚜)、*Macrosiphum euphorbiae* Thomas (马铃薯蚜)、*Myzus persicae* Sulzer (桃蚜,桃蚜)、*Nasonovia ribisnigri* Mosley (莴苣蚜)、*Pemphigus* 属 (根蚜虫和倍蚜)、*Rhopalosiphum maidis* Fitch (玉米叶蚜)、*Rhopalosiphum padi* Linnaeus (禾谷溢管蚜)、*Schizaphis graminum* Rondani (麦二叉蚜)、*Sitobion avenae* Fabricius (麦长管蚜)、*Therioaphis maculata* Buckton (苜蓿斑蚜)、*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (桔二岔蚜) 和 *Toxoptera citricida* Kirkaldy (褐色橘蚜);*Adelges* 属 (球蚜);*Phylloxera devastatrix* Pergande (美洲山核桃根瘤蚜);*Bemisia tabaci* Gennadius (烟粉虱,甘薯粉虱)、*Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (银叶粉虱)、*Dialeurodes citri* Ashmead (柑桔白粉虱) 和 *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (温室白粉虱);*Empoasca fabae* Harris (马铃薯小绿叶蝉)、*Laodelphax striatellus* Fallen (灰飞虱)、*Macrolestes quadrilineatus* Forbes (二点叶蝉)、*Nephotettix cincticeps* Uhler (青叶蝉)、*Nephotettix nigropictus* Stål (黑尾叶蝉)、*Nilaparvata lugens* Stål (褐飞



虱)、*Peregrinus maidis* Ashmead(玉米蜡蝉)、*Sogatella furcifera* Horvath(白背飞虱)、*Sogatodes orizicola* Muir(稻飞虱)、*Typhlocyba pomaria* McAtee white apple leafhopper, *Erythroneoura* 属(葡萄小叶蝉);*Magacidada septendecim* Linnaeus(周期蝉);*Icerya purchasi* Maskell(吹绵介壳虫)、*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock(圣约瑟虫);*Planococcus citri* Risso(柑桔粉蚧);*Pseudococcus* 属(其它粉蚧络合物);*Cacopsylla pyricola* Foerster(梨黄木虱)、*Trioza diospyri* Ashmead(柿树木虱)。

[1616] 本发明的化合物还在得自半翅目的成员上具有活性,所述半翅目包括:*Acrosternum hilare* Say(稻绿蝽)、*Anasa tristis* De Geer(南瓜缘蝽)、*Blissus leucopterus leucopterus* Say(高粱长蝽)、*Cimex lectularius* Linnaeus(臭虫)*Corythuca gossypii* Fabricius(棉网蝽)、*Cyrtopeltis modesta* Distant(番茄虫)、*Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer(污棉虫)、*Euchistus servus* Say(棕椿象)、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois(一斑点的椿象)、*Graptosthetus* 属(长蝽联合体)、*Leptoglossus corculus* Say(叶根松籽虫)、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois(牧草盲蝽)、*Nezara viridula* Linnaeus(南方稻绿蝽)、*Oebalus pugnax* Fabricius(稻褐蝽)、*Oncopeltus fasciatus* Dallas(大马力筋长蝽)、*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter(棉盲蝽)。被本发明的化合物防治的其它昆虫目包括缨尾目(如 *Frankliniella occidentalis* Pergande(西花蓟马)、*Scirtothrips citri* Moulton(柑桔蓟马)、*Sericothrips variabilis* Beach(大豆蓟马)和 *Thrips tabaci* Lindeman(葱蓟马)) ;和鞘翅目(如 *Leptinotarsa decemlineata* Say(科罗拉多马铃薯甲虫)、*Epilachna varivestis* Mulsant(墨西哥豆瓢虫)和 *Agriotes*、*Athous* 或 *Limonius* 属(线虫))。

[1617] 本发明的化合物对于线虫纲、绦虫纲、吸虫纲和棘头虫纲的成员同样具有活性,包括具有经济重要性的圆线虫目、蛔虫目、尖尾目、小杆目、旋尾目和嘴刺目的成员,诸如但不限于具有经济重要性的农学害虫(即根结线虫属根结线虫,根腐线虫属根腐线虫,毛刺线虫属残根线虫等)和危害动物和人类健康的害虫(即所有具有经济重要性的吸虫,绦虫和蛔虫,诸如马体内的寻常圆线虫,狗体内的犬弓蛔虫,羊体内的捻转血矛线虫,狗体内的犬恶丝虫,马体内的叶形裸头绦虫,反刍动物体内的肝片形吸虫等)。

[1618] 应注意到,某些现代分类系统将同翅目归类于半翅目的亚目。

[1619] 值得注意的是,本发明的化合物在控制马铃薯小绿叶蝉马铃薯小绿叶蝉(*Empoasca fabae*)方面的用途。值得注意的是,本发明的化合物在控制玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)方面的用途。值得注意的是,本发明的化合物在控制棉蚜(*Aphis gossypii*)方面的用途。值得注意的是,本发明的化合物在控制桃蚜(*Myzus persicae*)方面的用途。值得注意的是,本发明的化合物在控制小菜蛾(*Plutella xylostella*)方面的用途。值得注意的是,本发明的化合物在控制秋粘虫(*Spodoptera frugiperda*)方面的用途。

[1620] 值得注意的是,本发明的化合物在控制南部稻绿蝽(*Nezara viridula*), 豆荚盲蝽(*Lygus hesperus*), 稻水象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*), 褐飞虱(*Nilaparvatalugens*), 二点黑尾叶蝉(*Nephotettix virescens*) 和水稻二化螟(*Chilo suppressalis*) 方面的用途。

[1621] 本发明的化合物可与一种或多种其它生物学活性化合物或试剂混合以形成多组分杀虫剂,赋予甚至更广谱的农学和非农学用途,所述生物学活性化合物或试剂包括杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀菌剂、杀螨剂、除草剂、除草剂安全剂,生长调节剂诸如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂,化学不育剂,化学信息素,拒斥剂,诱虫剂,信息素,取食刺激剂,其它生物学活性化合物或昆虫致病细菌,病毒或真菌。因此,本发明还涉及由生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐、至少一种附加组分和至少一种附加的生物学活性化合物或试剂组成的组合物,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。就本发明的混合物而言,可将其它生物学活性化合物或试剂与本发明的化合物(包括式 1 的化合物)配制在一起,以形成预混物,或者可将其它生物学活性化合物或试剂与本发明的化合物(包括式 1 的化合物)分开配制,并且在施用前(例如在喷雾罐中)将两种制剂混合在一起,或者,将两种制剂依次施用。

[1622] 本发明的化合物可配制的此类生物学活性化合物或试剂的实例为杀昆虫剂如阿巴美丁、高灭磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、磺胺菊酯、双甲脒、阿维菌素、印苦楝子素、甲基谷硫磷、杀虫磺、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、扑虱灵、硫线磷、西维因、克百威、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、定虫隆、氯吡硫磷、甲基氯吡硫磷、可芬诺、螨死净、可尼丁、氰虫酰胺、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 $\gamma$ -三氟氯氰菊酯、 $\lambda$ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 $\alpha$ -氯氰菊酯、 $\zeta$ -氯氰菊酯、赛灭净、溴氰菊酯、丁醚脒、敌匹硫磷、迪厄尔丁、除虫脒、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、呋虫胺、二苯丙醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、顺式氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨唑、苯丁锡、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、噁虫胺、氟虫脒、氟胺氰菊酯、 $\tau$ -氟胺氰菊酯、大福松、伐虫脒、噁唑磷、氯虫酰胺、氟铃脒、噁螨酮、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、杀虫皂、异柳磷、虱螨脒、马拉硫磷、氯氟醚菊酯、氰氟虫腓、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、灭虫威、乙肟威、甲氧普烯、甲氧滴滴涕、甲氧卞氟菊酯、久效磷、甲氧虫酰胺、烯啶虫胺、硝乙脒噁唑、双苯氟脒、多氟虫脒脒、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、克螨特、拟除虫菊酯醚类杀虫剂、吡蚜酮、吡嗪氟虫腈、除虫菊酯、哒螨酮、啉虫丙醚、新啉啉啉类杀虫剂、吡啉氟虫腈、蚊蝇醚、鱼藤酮、理阿诺碱、多菌虫素、多杀菌素、季酮螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、硫丙磷、氟啉虫胺腈、虫酰胺、吡啉胺、伏虫脒、七氟菊酯、特丁硫磷、杀虫畏、似虫菊、四氟醚菊酯、噁虫啉、噁虫啉、硫双灭多威、杀虫双、啉虫酰胺、四溴菊酯、啉蚜威、敌百虫、杀虫脒、苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素、昆虫病原、昆虫病原昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。

[1623] 值得注意的是杀昆虫剂,如阿巴美丁、啉虫脒、氟丙菊酯、双甲脒、阿维菌素、印苦楝子素、杀虫磺、联苯菊酯、扑虱灵、硫线磷、西维因、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、氯吡硫磷、可尼丁、氰虫酰胺、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 $\gamma$ -三氟氯氰菊酯、 $\lambda$ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 $\alpha$ -氯氰菊酯、 $\zeta$ -氯氰菊酯、赛灭净、溴氰菊酯、迪厄尔丁、呋虫胺、二苯丙醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、顺式氰戊菊酯、乙虫腈、依芬宁、乙螨唑、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟虫脒、氟胺氰菊酯、伐虫脒、噁唑磷、氟铃脒、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、虱螨脒、氰氟虫腓、灭赐克、乙肟威、甲氧普烯、甲氧虫酰胺、烯啶虫胺、硝乙脒噁唑、双苯氟脒、草氨酰、吡蚜酮、除虫菊酯、哒螨酮、啉虫丙醚、蚊蝇醚、理阿诺碱、多菌虫素、多杀菌素、季酮螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、虫酰胺、似虫菊、噁虫啉、噁虫

嗪、硫双灭多威、杀虫双、四溴菊酯、啞蚜威、杀虫脞、苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株以及核型多角体病毒的所有菌株。

[1624] 用以与本发明的化合物混合的一个生物制剂实施方案包括昆虫致病细菌如苏云金芽孢杆菌,和胶囊包封的苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素如由CellCap<sup>®</sup>方法制得的MVP<sup>®</sup>和MVPII<sup>®</sup>生物杀虫剂(CellCap<sup>®</sup>, MVP<sup>®</sup>和MVPII<sup>®</sup>是Mycogen Corporation(Indianapolis, Indiana, USA)的商标);昆虫病原真菌如绿僵菌;和昆虫病原(天然存在的和遗传修饰的)病毒,包括杆状病毒,核型多角体病毒(NPV)如谷实夜蛾核型多角体病毒(HzNPV),芹菜夜蛾核型多角体病毒(AfNPV);和颗粒体病毒(GV),如苹果蠹蛾颗粒体病毒(CpGV)。

[1625] 尤其值得注意的是其中其它无脊椎害虫控制活性成分属于与式1的化合物不同的化学类别或者具有与其不同作用位点的组合。在某些情况下,与至少一种具有类似控制范围但是不同作用位点的其它无脊椎害虫控制活性成分组合,对于抗性管理将是尤其有利的。因此,本发明的组合物还可包含生物学有效量的至少一种附加无脊椎害虫控制活性成分,所述活性成分具有类似控制范围,但是属于不同的化学类别或者具有不同的作用位点。这些附加的生物学活性化合物或试剂包括但不限于钠通道调节剂,如联苯菊酯、氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 $\lambda$ -三氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、四氟甲醚菊酯、顺式氰戊菊酯、氰戊菊酯、茚虫威、甲氧卞氟菊酯、丙氟菊酯、除虫菊酯和四溴菊酯;胆碱酯酶抑制剂,如氯吡硫磷、乙肟威、草氨酰、硫双灭多威和啞蚜威;新烟碱,如啞虫脒、可尼丁、呋虫胺、吡虫啉、烯啞虫胺、硝乙脲噻唑、噻虫啉和噻虫嗪;杀虫大环内酯,如多菌虫素、多杀菌素、阿巴美丁、阿维菌素和甲氨基阿维菌素;GABA( $\gamma$ -氨基丁酸)调节的氯通道拮抗剂如阿维菌素,或阻断剂如乙虫腈和氟虫腈;甲壳质合成抑制剂如扑虱灵、赛灭净、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、双苯氟脲、多氟虫酰脲和杀虫脞;保幼激素类似物如二苯丙醚、苯氧威、甲氧普烯和蚊蝇醚;章鱼胺受体配体如双甲脒;蜕皮抑制剂和蜕皮激素激动剂如印苦楝子素、甲氧虫酰肼和虫酰肼;鱼尼汀受体配体如理阿诺碱、氨基甲酸二酰胺如氯虫苯甲酰胺、氰虫酰胺和氟虫酰胺;沙蚕毒素类似物如杀螟丹;线粒体电子转运抑制剂如溴虫腈、氟蚁腈和啞螨酮;脂质生物合成抑制剂如季酮螨酯和螺甲螨酯;环二烯类杀虫剂如迪厄尔丁或硫丹;拟除虫菊酯;氨基甲酸根;脲杀真菌剂;以及生物试剂,包括核型多角体病毒(NPV)、苏云金芽孢杆菌成员、胶囊包封的苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素、以及其它天然存在或遗传修饰的杀虫病毒。

[1626] 本发明的化合物可配制的生物学活性化合物或试剂的更多实例为:杀真菌剂,如1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、苯并噻二唑、杀螟丹,吡啶磺菌胺、戊环唑、啞菌酯、苯霜灵、苯菌灵、苯噻菌胺、异丙基苯噻菌胺、binomial、联苯、双苯三唑醇、杀稻瘟菌素-S、波尔多液(三元硫酸铜)、啞酰菌胺(boscalid/nicobifen)、糠菌唑、乙啞酚磺酸酯、丁赛特、萎锈灵、环丙酰菌胺、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、地茂散、百菌清、乙菌利、克霉唑、王铜、铜盐如硫酸铜和氢氧化铜、赛座灭、环氟菌胺、霜脲氰、环唑醇、啞菌环胺、抑菌灵、双氯氟菌胺、啞菌清、氯硝胺、乙霉威、恶醚唑、烯酰吗啉、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨普、discostrobin、二噻农、十二环吗啉、多果定、益康唑、乙环唑、敌瘟磷、氟环唑、噻唑菌胺、乙啞酚、氯唑灵、噁唑菌酮、咪唑菌酮、氯苯啞啞醇、腈苯唑、缬霉威、甲呋酰苯胺、环酰菌胺、氰

菌胺、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、三苯基乙酸锡、三苯基氢氧化锡、福美铁、ferfurazoate、嘧菌胺、氟啶胺、咯菌腈、氟酰胺、氟吡菌胺、氟嘧菌酯、氟啶唑、氟啶唑、氟硅唑、磺菌胺、氟酰胺、粉唑醇、fluxapyroxad、灭菌丹、三乙膦酸铝、四氯苯酞、麦穗宁、呋霜灵、福拉比、己唑醇、恶霉灵、克热净、抑霉唑、酰胺唑、双胍辛胺、iodicarb、种菌唑、异稻瘟净、异菌脲、丙森锌、异康唑、稻瘟灵、异噻菌胺、春雷霉素、克收欣、代森锰锌、双炔酰菌胺、代森锰、嘧菌胺、精甲霜灵、灭锈胺、甲霜灵、叶菌唑、磺菌威、代森联、苯氧菌胺 (metominostrobin/fenominostrobin)、灭派林、苯菌酮、咪康唑、腈菌唑、甲肿铁铵 (甲基肿酸铁)、氟苯嘧啶醇、辛噻酮、呋酰胺、肟醚菌胺、恶霜灵、噁唑酸、噁咪唑、氧化萎锈灵、多效唑、戊菌唑、戊菌隆、戊苯吡菌胺、吡噻菌胺、稻瘟酯、膦酸、苯酞、氟啶酰菌胺、啉氧菌酯、多抗霉素、烯丙异噻唑、咪鲜安、腐霉利、霜霉威、霜霉威盐酸盐、丙环唑、丙森锌、丙氧啉、丙硫菌唑、唑菌胺酯、唑菌酯、唑菌酯、白粉松、啉斑肟、嘧霉胺、啉斑肟、甲氧苯啉菌、硝吡咯菌素、咯唑酮、啉唑、快诺芬、五氯硝基苯、硅噻菌胺、硅氟唑、螺环菌胺、链霉素、硫、戊唑醇、异丁乙氧啉、techrazene、克枯烂、四氯硝基苯、氟醚唑、噻菌灵、噻呋灭、托布津、甲基硫菌灵、二硫四甲秋兰姆、噻酰菌胺、甲基立枯磷、甲苯氟磺胺、三唑酮、三唑醇、嘧菌醇、唑菌嗪、十三吗啉、垂吗酰胺、三环唑、肟菌酯、噻氨灵、灭菌唑、烯效唑、井冈霉素、霜霉灭、乙烯菌核利、代森锌、福美锌和草酰胺；杀线虫剂，如涕灭威、庄无忌、草氨酰和苯线磷；杀菌剂，如链霉素；杀螨剂，如双甲脒、灭螨猛、克氯苯、三环锡、三氯杀螨醇、除螨灵、乙螨唑、啉啉醚、苯丁锡、甲氰菊酯、啉啉酯、噻啉酮、克螨特 (propargite)、啉啉酮和吡啉胺。

[1627] 值得注意的是杀真菌剂和包含杀真菌剂，如 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、嘧菌酯、氢氧化铜、霜脲氰、环唑醇、恶醚唑、噁唑菌酮、氰菌胺、嘧菌胺、氟硅唑、氟酰胺、四氯苯酞、福拉比、己唑醇、稻瘟灵、异噻菌胺、春雷霉素、代森锰锌、苯氧菌胺、肟醚菌胺、戊菌隆、吡噻菌胺、啉氧菌酯、烯丙异噻唑、丙环唑、丙氧啉、咯唑酮、硅氟唑、噻酰菌胺、三环唑、肟菌酯和井冈霉素的组合物。

[1628] 在某些情况下，本发明的化合物与其它生物活性（尤其是无脊椎害虫控制）化合物或试剂（即活性成分）的组合可获得大于累加（即协同）的效应。降低释放到环境中的活性成分量，同时确保有效的害虫控制，一直是所期望的。当在施用量下发生无脊椎害虫控制活性成分协同作用，赋予农学上符合要求的无脊椎害虫控制制度，此类组合可有利地用于降低作物产品成本，并且降低环境载荷。

[1629] 可将本发明的化合物及其组合物施用到植物上，所述植物经转基因以表达对无脊椎害虫有毒的蛋白质（诸如苏云金芽孢杆菌  $\delta$ -内毒素）。此类施用可提供更广谱的植物保护性，并且可有利地用于抗性管理。外施防治无脊椎害虫的本发明的化合物的效果可与表达的毒素蛋白质协同作用。

[1630] 这些农学保护剂（即杀虫剂，杀真菌剂，杀线虫剂，杀螨剂，除草剂和生物制剂）的一般参考文献包括“*The Pesticide Manual*”第 13 版 (C. D. S. Tomlin 编辑, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003) 和“*The BioPesticide Manual*”第 2 版 (L. G. Copping 编辑, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001)。

[1631] 对于其中使用一种或多种这些不同混合组分的实施方案而言，这些不同混合组分（总量）与式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐的重量比通常介于约 1 : 3000 和约 3000 : 1

之间。值得注意的是介于约 1 : 300 和约 300 : 1 之间的重量比（例如介于约 1 : 30 和约 30 : 1 之间的比率）。本领域的技术人员可易于通过简单的实验来确定获得所期望生物活性范围而需要的活性成分生物学有效量。显然,包含这些附加组分可使无脊椎害虫控制范围超出式 1 的化合物自身的控制范围。

[1632] 表 A 列出了式 1 的化合物与其它无脊椎害虫控制剂的具体组合,例证了本发明的混合物、组合物和方法。表 A 第一栏列出了具体的无脊椎害虫控制剂（例如第一栏中的“阿巴美丁”）。表 A 第二栏列出了无脊椎害虫控制剂的作用模式（如果已知的话）或化学类别。表 A 第三栏列出了在无脊椎害虫防治剂施用量下,其相对于式 1 的化合物的重量比范围实施方案（例如阿巴美丁相对于式 1 的化合物的比率按重量计为“50 : 1 至 1 : 50”）。因此例如表 A 第一行具体公开了可以 50 : 1 至 1 : 50 的重量比施用式 1 的化合物与阿巴美丁的组合。表 A 的其余行可类似进行解释。还值得注意的是,表 A 列出了式 1 的化合物与其它无脊椎害虫控制剂的具体组合,例证了本发明的混合物,组合物和方法,并且包括适用于施用量的重量比范围的附加实施方案。

[1633] 表 A

[1634]

无脊椎害虫控制剂	作用模式或化学类别	典型的重量比
阿巴美丁	大环内酯类	50:1 至 1:50
啉虫脒	新烟碱类	150:1 至 1:200
双甲脒	章鱼胺受体配体	200:1 至 1:100
阿维菌素	大环内酯类	50:1 至 1:50
印苦楝子素	蜕皮激素激动剂	100:1 至 1:120
$\beta$ -氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
联苯菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:10
扑虱灵	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:50
杀螟丹	沙蚕毒素类似物	100:1 至 1:200
氯虫苯甲酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
溴虫腈	线粒体电子转运抑制剂	300:1 至 1:200
氯吡硫磷	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:200
可尼丁	新烟碱类	100:1 至 1:400
氟虫酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
三氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
赛灭净	甲壳质合成抑制剂	400:1 至 1:50
溴氰菊酯	钠通道调节剂	50:1 至 1:400
迪厄尔丁	环二烯类杀虫剂	200:1 至 1:100
呋虫胺	新烟碱类	150:1 至 1:200
二苯丙醚	蜕皮抑制剂	150:1 至 1:200
甲氨基阿维菌素	大环内酯类	50:1 至 1:10
硫丹	环二烯类杀虫剂	200:1 至 1:100
顺式氟戊菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:400
乙虫腈	GABA 调节的氯离子通道阻隔剂	200:1 至 1:100
苯硫威		150:1 至 1:200
苯氧威	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
氟戊菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
氟虫腈	GABA 调节的氯离子通道阻隔剂	150:1 至 1:100
氟啉虫酰胺		200:1 至 1:100
氟虫酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
氟虫脲	甲壳质合成抑制剂	200:1 至 1:100
氟铃脲	甲壳质合成抑制剂	300:1 至 1:50
氟蚁腠	线粒体电子转运抑制剂	150:1 至 1:250
吡虫啉	新烟碱类	1000:1 至 1:1000
茚虫威	钠通道调节剂	200:1 至 1:50
$\lambda$ -三氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	50:1 至 1:250

[1635]

无脊椎害虫控制剂	作用模式或化学类别	典型的重量比
虱螨脲	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:250
氰氟虫腙		200:1 至 1:200
乙炔威	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:100
甲氧普烯	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
甲氧虫酰肼	蜕皮激素激动剂	50:1 至 1:50
烯啶虫胺	新烟碱类	150:1 至 1:200
硝乙脲噻唑	新烟碱类	150:1 至 1:200
双苯氟脲	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:150
草氨酰	胆碱酯酶抑制剂	200:1 至 1:200
吡蚜酮		200:1 至 1:100
除虫菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:10
哒螨酮	线粒体电子转运抑制剂	200:1 至 1:100
啶虫丙醚		200:1 至 1:100
蚊蝇醚	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
理阿诺碱	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
多菌虫素	大环内酯类	150:1 至 1:100
多杀菌素	大环内酯类	500:1 至 1:10
季酮螨酯	脂质生物合成抑制剂	200:1 至 1:200
螺甲螨酯	脂质生物合成抑制剂	200:1 至 1:200
虫酰肼	蜕皮激素激动剂	500:1 至 1:250
噻虫啉	新烟碱类	100:1 至 1:200
噻虫嗪	新烟碱类	1250:1 至 1:1000
硫双灭多威	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:400
杀虫双		150:1 至 1:100
四溴菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
唑蚜威	胆碱酯酶抑制剂	250:1 至 1:100
杀虫脲	甲壳质合成抑制剂	200:1 至 1:100
苏云金芽孢杆菌	生物剂	50:1 至 1:10
苏云金芽孢杆菌 $\delta$ -内毒素	生物剂	50:1 至 1:10
NPV (例如 Gemstar)	生物剂	50:1 至 1:10

[1636] 值得注意的是本发明的组合物,其中所述至少一种附加的生物学活性化合物或试剂选自上表 A 中列出的无脊椎害虫防治剂。

[1637] 包括式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐的化合物与附加无脊椎害虫防治剂的重量比通常介于 1000 : 1 和 1 : 1000 之间,一个实施方案介于 500 : 1 和 1 : 500 之间,另一个实施方案介于 250 : 1 和 1 : 200 之间,并且另一个实施方案介于 100 : 1 和 1 : 50 之间。

[1638] 下表 B1 至 B81 中列出的是包含式 1 的化合物(化合物编号(Cmpd. No.) 参考索引表 A-E 中的化合物)和附加无脊椎害虫防治剂的具体组合物实施方案。

[1639] 表 B1

[1640]

混合物编号	Cmpd. No.	和	无脊椎害虫控制剂	混合物编号	Cmpd. No.	和	无脊椎害虫控制剂
B1-1	1	和	阿巴美丁	B1-36	1	和	吡虫啉
B1-2	1	和	啉虫脒	B1-37	1	和	茚虫威
B1-3	1	和	双甲脒	B1-38	1	和	$\lambda$ -三氟氯氰菊酯
B1-4	1	和	阿维菌素	B1-39	1	和	虱螨脲
B1-5	1	和	印苦楝子素	B1-40	1	和	氰氟虫腓
B1-5a	1	和	杀虫磺	B1-41	1	和	乙肟威
B1-6	1	和	$\beta$ -氟氯氰菊酯	B1-42	1	和	甲氧普烯
B1-7	1	和	联苯菊酯	B1-43	1	和	甲氧虫酰胺
B1-8	1	和	扑虱灵	B1-44	1	和	烯啶虫胺
B1-9	1	和	杀螟丹	B1-45	1	和	硝乙脲噻唑
B1-10	1	和	氯虫苯甲酰胺	B1-46	1	和	双苯氟脲
B1-11	1	和	溴虫腈	B1-47	1	和	草氨酰
B1-12	1	和	氯吡硫磷	B1-48	1	和	亚胺硫磷
B1-13	1	和	可尼丁	B1-49	1	和	吡蚜酮
B1-14	1	和	氟虫酰胺	B1-50	1	和	除虫菊酯
B1-15	1	和	氟氯氰菊酯	B1-51	1	和	哒螨酮
B1-16	1	和	三氟氯氰菊酯	B1-52	1	和	啉虫丙醚
B1-17	1	和	氯氟菊酯	B1-53	1	和	蚊蝇醚
B1-18	1	和	赛灭净	B1-54	1	和	理阿诺碱
B1-19	1	和	溴氟菊酯	B1-55	1	和	多菌虫素
B1-20	1	和	迪厄尔丁	B1-56	1	和	多杀菌素
B1-21	1	和	呋虫胺	B1-57	1	和	季酮螨酯
B1-22	1	和	二苯丙醚	B1-58	1	和	螺甲螨酯
B1-23	1	和	甲氨基阿维菌素	B1-59	1	和	螺虫乙酯
B1-24	1	和	硫丹	B1-60	1	和	虫酰胺
B1-25	1	和	顺式氟戊菊酯	B1-61	1	和	噻虫啉
B1-26	1	和	乙虫腈	B1-62	1	和	噻虫嗪
B1-27	1	和	苯硫威	B1-63	1	和	硫双灭多威
B1-28	1	和	苯氧威	B1-64	1	和	杀虫双
B1-29	1	和	氟戊菊酯	B1-65	1	和	啉虫酰胺
B1-30	1	和	氟虫腈	B1-66	1	和	四溴菊酯
B1-31	1	和	氟啉虫酰胺	B1-67	1	和	啉蚜威
B1-32	1	和	氟虫酰胺	B1-68	1	和	杀虫脲

[1641]

混合物编号	Cmpd. No.	和	无脊椎害虫控制剂	混合物编号	Cmpd. No.	和	无脊椎害虫控制剂
B1-33	1	和	氟虫脲	B1-69	1	和	苏云金芽孢杆菌
B1-34	1	和	氟铃脲	B1-70	1	和	苏云金芽孢杆菌 $\delta$ - 内毒素
B1-35	1	和	氟蚁脲	B1-71	1	和	NPV (例如 Gemstar)



[1642] 表 B2

[1643] 表 B2 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 18 的引用。例如,表 B2 中的第一混合物指定为 B2-1 并且其为化合物 18 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1644] 表 B3

[1645] 表 B3 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 19 的引用。例如,表 B3 中的第一混合物指定为 B3-1 并且其为化合物 19 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1646] 表 B4

[1647] 表 B4 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 20 的引用。例如,表 B4 中的第一混合物指定为 B4-1 并且其为化合物 20 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1648] 表 B5

[1649] 表 B5 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 21 的引用。例如,表 B5 中的第一混合物指定为 B5-1 并且其为化合物 21 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1650] 表 B6

[1651] 表 B6 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 23 的引用。例如,表 B6 中的第一混合物指定为 B6-1 并且其为化合物 23 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1652] 表 B7

[1653] 表 B7 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 26 的引用。例如,表 B7 中的第一混合物指定为 B7-1 并且其为化合物 26 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1654] 表 B8

[1655] 表 B8 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 29 的引用。例如,表 B8 中的第一混合物指定为 B8-1 并且其为化合物 29 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1656] 表 B9

[1657] 表 B9 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 30 的引用。例如,表 B9 中的第一混合物指定为 B9-1 并且其为化合物 30 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1658] 表 B10

[1659] 表 B10 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 33 的引用。例如,表 B10 中的第一混合物指定为 B10-1 并且其为化合物 33 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1660] 表 B11

[1661] 表 B11 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 36 的引用。例如,表 B11 中的第一混合物指定为 B11-1 并且其为化合物

36 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1662] 表 B12

[1663] 表 B12 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 37 的引用。例如,表 B12 中的第一混合物指定为 B12-1 并且其为化合物 37 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1664] 表 B13

[1665] 表 B13 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 40 的引用。例如,表 B13 中的第一混合物指定为 B13-1 并且其为化合物 40 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1666] 表 B14

[1667] 表 B14 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 44 的引用。例如,表 B14 中的第一混合物指定为 B14-1 并且其为化合物 44 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1668] 表 B15

[1669] 表 B15 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 47 的引用。例如,表 B15 中的第一混合物指定为 B15-1 并且其为化合物 47 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1670] 表 B16

[1671] 表 B16 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 49 的引用。例如,表 B16 中的第一混合物指定为 B16-1 并且其为化合物 49 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1672] 表 B17

[1673] 表 B17 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 50 的引用。例如,表 B17 中的第一混合物指定为 B17-1 并且其为化合物 50 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1674] 表 B18

[1675] 表 B18 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 51 的引用。例如,表 B18 中的第一混合物指定为 B18-1 并且其为化合物 51 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1676] 表 B19

[1677] 表 B19 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 52 的引用。例如,表 B19 中的第一混合物指定为 B2-1 并且其为化合物 52 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1678] 表 B20

[1679] 表 B20 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 53 的引用。例如,表 B20 中的第一混合物指定为 B20-1 并且其为化合物 53 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1680] 表 B21

[1681] 表 B21 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引

用替换为对化合物 56 的引用。例如,表 B21 中的第一混合物指定为 B21-1 并且其为化合物 56 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1682] 表 B22

[1683] 表 B22 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 57 的引用。例如,表 B22 中的第一混合物指定为 B22-1 并且其为化合物 57 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1684] 表 B23

[1685] 表 B23 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 58 的引用。例如,表 B23 中的第一混合物指定为 B23-1 并且其为化合物 58 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1686] 表 B24

[1687] 表 B24 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 59 的引用。例如,表 B24 中的第一混合物指定为 B24-1 并且其为化合物 59 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1688] 表 B25

[1689] 表 B25 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 60 的引用。例如,表 B25 中的第一混合物指定为 B25-1 并且其为化合物 60 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1690] 表 B26

[1691] 表 B26 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 62 的引用。例如,表 B26 中的第一混合物指定为 B26-1 并且其为化合物 62 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1692] 表 B27

[1693] 表 B27 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 63 的引用。例如,表 B27 中的第一混合物指定为 B27-1 并且其为化合物 63 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1694] 表 B28

[1695] 表 B28 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 65 的引用。例如,表 B28 中的第一混合物指定为 B28-1 并且其为化合物 65 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1696] 表 B29

[1697] 表 B29 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 71 的引用。例如,表 B29 中的第一混合物指定为 B29-1 并且其为化合物 71 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1698] 表 B30

[1699] 表 B30 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 74 的引用。例如,表 B30 中的第一混合物指定为 B30-1 并且其为化合物 74 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1700] 表 B31

[1701] 表 B31 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 77 的引用。例如,表 B31 中的第一混合物指定为 B31-1 并且其为化合物 77 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1702] 表 B32

[1703] 表 B32 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 79 的引用。例如,表 B32 中的第一混合物指定为 B32-1 并且其为化合物 79 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1704] 表 B33

[1705] 表 B33 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 80 的引用。例如,表 B33 中的第一混合物指定为 B33-1 并且其为化合物 80 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1706] 表 B34

[1707] 表 B34 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 81 的引用。例如,表 B34 中的第一混合物指定为 B34-1 并且其为化合物 81 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1708] 表 B35

[1709] 表 B35 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 82 的引用。例如,表 B35 中的第一混合物指定为 B35-1 并且其为化合物 82 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1710] 表 B36

[1711] 表 B36 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 83 的引用。例如,表 B36 中的第一混合物指定为 B36-1 并且其为化合物 83 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1712] 表 B37

[1713] 表 B37 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 84 的引用。例如,表 B37 中的第一混合物指定为 B37-1 并且其为化合物 84 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1714] 表 B38

[1715] 表 B38 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 85 的引用。例如,表 B38 中的第一混合物指定为 B38-1 并且其为化合物 85 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1716] 表 B39

[1717] 表 B39 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 86 的引用。例如,表 B39 中的第一混合物指定为 B39-1 并且其为化合物 86 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1718] 表 B40

[1719] 表 B40 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 87 的引用。例如,表 B40 中的第一混合物指定为 B40-1 并且其为化合物 87 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1720] 表 B41

[1721] 表 B41 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 89 的引用。例如,表 B41 中的第一混合物指定为 B41-1 并且其为化合物 89 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1722] 表 B42

[1723] 表 B42 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 99 的引用。例如,表 B42 中的第一混合物指定为 B42-1 并且其为化合物 99 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1724] 表 B43

[1725] 表 B43 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 102 的引用。例如,表 B43 中的第一混合物指定为 B43-1 并且其为化合物 102 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1726] 表 B44

[1727] 表 B44 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 113 的引用。例如,表 B44 中的第一混合物指定为 B44-1 并且其为化合物 113 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1728] 表 B45

[1729] 表 B45 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 118 的引用。例如,表 B45 中的第一混合物指定为 B45-1 并且其为化合物 118 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1730] 表 B46

[1731] 表 B46 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 125 的引用。例如,表 B46 中的第一混合物指定为 B46-1 并且其为化合物 125 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1732] 表 B47

[1733] 表 B47 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 137 的引用。例如,表 B47 中的第一混合物指定为 B47-1 并且其为化合物 137 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1734] 表 B48

[1735] 表 B48 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 183 的引用。例如,表 B48 中的第一混合物指定为 B48-1 并且其为化合物 183 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1736] 表 B49

[1737] 表 B49 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 190 的引用。例如,表 B49 中的第一混合物指定为 B49-1 并且其为化合物 190 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1738] 表 B50

[1739] 表 B50 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 191 的引用。例如,表 B50 中的第一混合物指定为 B50-1 并且其为化合

物 191 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1740] 表 B51

[1741] 表 B51 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 196 的引用。例如,表 B51 中的第一混合物指定为 B51-1 并且其为化合物 196 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1742] 表 B52

[1743] 表 B52 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 229 的引用。例如,表 B52 中的第一混合物指定为 B52-1 并且其为化合物 229 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1744] 表 B53

[1745] 表 B53 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 231 的引用。例如,表 B53 中的第一混合物指定为 B53-1 并且其为化合物 231 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1746] 表 B54

[1747] 表 B54 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 254 的引用。例如,表 B54 中的第一混合物指定为 B54-1 并且其为化合物 254 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1748] 表 B55

[1749] 表 B55 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 257 的引用。例如,表 B55 中的第一混合物指定为 B55-1 并且其为化合物 257 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1750] 表 B56

[1751] 表 B56 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 272 的引用。例如,表 B56 中的第一混合物指定为 B56-1 并且其为化合物 272 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1752] 表 B57

[1753] 表 B57 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 289 的引用。例如,表 B57 中的第一混合物指定为 B57-1 并且其为化合物 289 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1754] 表 B58

[1755] 表 B58 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 296 的引用。例如,表 B58 中的第一混合物指定为 B58-1 并且其为化合物 296 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1756] 表 B59

[1757] 表 B59 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 299 的引用。例如,表 B59 中的第一混合物指定为 B59-1 并且其为化合物 299 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1758] 表 B60

[1759] 表 B60 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引

用替换为对化合物 307 的引用。例如,表 B60 中的第一混合物指定为 B60-1 并且其为化合物 307 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1760] 表 B61

[1761] 表 B61 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 308 的引用。例如,表 B61 中的第一混合物指定为 B61-1 并且其为化合物 308 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1762] 表 B62

[1763] 表 B62 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 315 的引用。例如,表 B62 中的第一混合物指定为 B62-1 并且其为化合物 315 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1764] 表 B63

[1765] 表 B63 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 343 的引用。例如,表 B63 中的第一混合物指定为 B63-1 并且其为化合物 343 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1766] 表 B64

[1767] 表 B64 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 344 的引用。例如,表 B64 中的第一混合物指定为 B64-1 并且其为化合物 344 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1768] 表 B65

[1769] 表 B65 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 352 的引用。例如,表 B65 中的第一混合物指定为 B65-1 并且其为化合物 352 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1770] 表 B66

[1771] 表 B66 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 363 的引用。例如,表 B66 中的第一混合物指定为 B66-1 并且其为化合物 363 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1772] 表 B67

[1773] 表 B67 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 364 的引用。例如,表 B67 中的第一混合物指定为 B67-1 并且其为化合物 364 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1774] 表 B68

[1775] 表 B68 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 368 的引用。例如,表 B68 中的第一混合物指定为 B68-1 并且其为化合物 368 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1776] 表 B69

[1777] 表 B69 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 381 的引用。例如,表 B69 中的第一混合物指定为 B69-1 并且其为化合物 381 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1778] 表 B70

[1779] 表 B70 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 385 的引用。例如,表 B70 中的第一混合物指定为 B70-1 并且其为化合物 385 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1780] 表 B71

[1781] 表 B71 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物的引用。例如,表中的第一混合物指定为 -1 并且其为化合物 421 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1782] 表 B72

[1783] 表 B72 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 433 的引用。例如,表 B72 中的第一混合物指定为 B72-1 并且其为化合物 433 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1784] 表 B73

[1785] 表 B73 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 435 的引用。例如,表 B73 中的第一混合物指定为 B73-1 并且其为化合物 435 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1786] 表 B74

[1787] 表 B74 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 448 的引用。例如,表 B74 中的第一混合物指定为 B74-1 并且其为化合物 448 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1788] 表 B75

[1789] 表 B75 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 449 的引用。例如,表 B75 中的第一混合物指定为 B75-1 并且其为化合物 449 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1790] 表 B76

[1791] 表 B76 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 450 的引用。例如,表 B76 中的第一混合物指定为 B76-1 并且其为化合物 450 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1792] 表 B77

[1793] 表 B77 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 451 的引用。例如,表 B77 中的第一混合物指定为 B77-1 并且其为化合物 451 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1794] 表 B78

[1795] 表 B78 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 462 的引用。例如,表 B78 中的第一混合物指定为 B78-1 并且其为化合物 462 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1796] 表 B79

[1797] 表 B79 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 482 的引用。例如,表 B79 中的第一混合物指定为 B79-1 并且其为化合物 482 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。



## [1798] 表 B80

[1799] 表 B80 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 490 的引用。例如,表 B80 中的第一混合物指定为 B80-1 并且其为化合物 490 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

## [1800] 表 B81

[1801] 表 B81 与表 B1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 493 的引用。例如,表 B81 中的第一混合物指定为 B81-1 并且其为化合物 493 和附加无脊椎害虫防治剂阿巴美丁的混合物。

[1802] 列于表 B1 至 B81 中的具体混合物通常以表 A 中指定的比率来组合式 1 的化合物和并且其它无脊椎害虫防治剂。

[1803] 下表 C1 至 C81 中列出的是包含式 1 的化合物(化合物编号(Cmpd. No.)与索引表 A-E 中的化合物相关)和附加杀真菌剂的具体组合物实施方案。

## [1804] 表 C1

[1805]

混合物编号	Cmpd. No.	和	杀真菌剂	混合物编号	Cmpd. No.	和	杀真菌剂
C1-1	1	和	烯丙异噻唑	C1-17	1	和	恶醚唑
C1-2	1	和	噻酰菌胺	C1-18	1	和	环唑醇
C1-3	1	和	异噻菌胺	C1-19	1	和	丙环唑
C1-4	1	和	咯嗪酮	C1-20	1	和	氟菌胺
C1-5	1	和	苯氧菌胺	C1-21	1	和	啉菌胺
C1-6	1	和	氟酰胺	C1-22	1	和	四氯苯酞
C1-7	1	和	井冈霉素	C1-23	1	和	春雷霉素
C1-8	1	和	福拉比	C1-24	1	和	啉氧菌酯
C1-9	1	和	戊菌隆	C1-25	1	和	吡噻菌胺
C1-10	1	和	硅氟唑	C1-26	1	和	噁唑菌酮
C1-11	1	和	肟醚菌胺	C1-27	1	和	霜脍氰

[1806]

混合物编号	Cmpd. No.	和	杀真菌剂	混合物编号	Cmpd. No.	和	杀真菌剂
C1-12	1	和	肟菌酯	C1-28	1	和	丙氧喹啉
C1-13	1	和	稻瘟灵	C1-29	1	和	氟硅唑
C1-14	1	和	啉菌酯	C1-30	1	和	代森锰锌
C1-15	1	和	三环唑	C1-31	1	和	氢氧化铜
C1-16	1	和	己唑醇	C1-32	1	和	(a)

[1807] (a) 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮

## [1808] 表 C2

[1809] 表 C2 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 18 的引用。例如,表 C2 中的第一混合物指定为 C2-1 并且其为化合物 18

和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1810] 表 C3

[1811] 表 C3 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 19 的引用。例如,表 C3 中的第一混合物指定为 C3-1 并且其为化合物 19 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1812] 表 C4

[1813] 表 C4 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 20 的引用。例如,表 C4 中的第一混合物指定为 C4-1 并且其为化合物 20 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1814] 表 C5

[1815] 表 C5 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 21 的引用。例如,表 C5 中的第一混合物指定为 C5-1 并且其为化合物 21 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1816] 表 C6

[1817] 表 C6 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 23 的引用。例如,表 C6 中的第一混合物指定为 C6-1 并且其为化合物 23 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1818] 表 C7

[1819] 表 C7 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 26 的引用。例如,表 C7 中的第一混合物指定为 C7-1 并且其为化合物 26 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1820] 表 C8

[1821] 表 C8 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 29 的引用。例如,表 C8 中的第一混合物指定为 C8-1 并且其为化合物 29 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1822] 表 C9

[1823] 表 C9 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 30 的引用。例如,表 C9 中的第一混合物指定为 C9-1 并且其为化合物 30 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1824] 表 C10

[1825] 表 C10 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 33 的引用。例如,表 C10 中的第一混合物指定为 C10-1 并且其为化合物 33 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1826] 表 C11

[1827] 表 C11 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 36 的引用。例如,表 C11 中的第一混合物指定为 C11-1 并且其为化合物 36 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1828] 表 C12

[1829] 表 C12 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引

用替换为对化合物 37 的引用。例如,表 C12 中的第一混合物指定为 C12-1 并且其为化合物 37 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1830] 表 C13

[1831] 表 C13 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 40 的引用。例如,表 C13 中的第一混合物指定为 C13-1 并且其为化合物 40 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1832] 表 C14

[1833] 表 C14 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 44 的引用。例如,表 C14 中的第一混合物指定为 C14-1 并且其为化合物 44 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1834] 表 C15

[1835] 表 C15 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 47 的引用。例如,表 C15 中的第一混合物指定为 C15-1 并且其为化合物 47 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1836] 表 C16

[1837] 表与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 49 的引用。例如,表 C16 中的第一混合物指定为 C16-1 并且其为化合物 49 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1838] 表 C17

[1839] 表 C17 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 50 的引用。例如,表 C17 中的第一混合物指定为 C17-1 并且其为化合物 50 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1840] 表 C18

[1841] 表 C18 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 51 的引用。例如,表 C18 中的第一混合物指定为 C18-1 并且其为化合物 51 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1842] 表 C19

[1843] 表 C19 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 52 的引用。例如,表 C19 中的第一混合物指定为 C19-1 并且其为化合物 52 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1844] 表 C20

[1845] 表 C20 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 53 的引用。例如,表 C20 中的第一混合物指定为 C20-1 并且其为化合物 53 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1846] 表 C21

[1847] 表 C21 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 56 的引用。例如,表 C21 中的第一混合物指定为 C21-1 并且其为化合物 56 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1848] 表 C22

[1849] 表 C22 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 57 的引用。例如,表 C22 中的第一混合物指定为 C22-1 并且其为化合物 57 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1850] 表 C23

[1851] 表 C23 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 58 的引用。例如,表 C23 中的第一混合物指定为 C23-1 并且其为化合物 58 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1852] 表 C24

[1853] 表 C24 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 59 的引用。例如,表 C24 中的第一混合物指定为 C24-1 并且其为化合物 59 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1854] 表 C25

[1855] 表 C25 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 60 的引用。例如,表 C25 中的第一混合物指定为 C25-1 并且其为化合物 60 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1856] 表 C26

[1857] 表 C26 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 62 的引用。例如,表 C26 中的第一混合物指定为 C26-1 并且其为化合物 62 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1858] 表 C27

[1859] 表 C27 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 63 的引用。例如,表 C27 中的第一混合物指定为 C27-1 并且其为化合物 63 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1860] 表 C28

[1861] 表 C28 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 65 的引用。例如,表 C28 中的第一混合物指定为 C28-1 并且其为化合物 65 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1862] 表 C29

[1863] 表 C29 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 71 的引用。例如,表 C29 中的第一混合物指定为 C29-1 并且其为化合物 71 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1864] 表 C30

[1865] 表 C30 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 74 的引用。例如,表 C30 中的第一混合物指定为 C30-1 并且其为化合物 74 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1866] 表 C31

[1867] 表 C31 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 77 的引用。例如,表 C31 中的第一混合物指定为 C31-1 并且其为化合物 77 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1868] 表 C32

[1869] 表 C32 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 79 的引用。例如,表 C32 中的第一混合物指定为 C32-1 并且其为化合物 79 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1870] 表 C33

[1871] 表 C33 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 80 的引用。例如,表 C33 中的第一混合物指定为 C33-1 并且其为化合物 80 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1872] 表 C34

[1873] 表 C34 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 81 的引用。例如,表 C34 中的第一混合物指定为 C34-1 并且其为化合物 81 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1874] 表 C35

[1875] 表 C35 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 82 的引用。例如,表 C35 中的第一混合物指定为 C35-1 并且其为化合物 82 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1876] 表 C36

[1877] 表 C36 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 83 的引用。例如,表 C36 中的第一混合物指定为 C36-1 并且其为化合物 83 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1878] 表 C37

[1879] 表 C37 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 84 的引用。例如,表 C37 中的第一混合物指定为 C37-1 并且其为化合物 84 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1880] 表 C38

[1881] 表 C38 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 85 的引用。例如,表 C38 中的第一混合物指定为 C38-1 并且其为化合物 85 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1882] 表 C39

[1883] 表 C39 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 86 的引用。例如,表 C39 中的第一混合物指定为 C39-1 并且其为化合物 86 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1884] 表 C40

[1885] 表 C40 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 87 的引用。例如,表 C40 中的第一混合物指定为 C40-1 并且其为化合物 87 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1886] 表 C41

[1887] 表 C41 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 89 的引用。例如,表 C41 中的第一混合物指定为 C41-1 并且其为化合物

89 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1888] 表 C42

[1889] 表 C42 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 99 的引用。例如,表 C42 中的第一混合物指定为 C42-1 并且其为化合物 99 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1890] 表 C43

[1891] 表 C43 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 102 的引用。例如,表 C43 中的第一混合物指定为 C43-1 并且其为化合物 102 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1892] 表 C44

[1893] 表 C44 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 113 的引用。例如,表 C44 中的第一混合物指定为 C44-1 并且其为化合物 113 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1894] 表 C45

[1895] 表 C45 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 118 的引用。例如,表 C45 中的第一混合物指定为 C45-1 并且其为化合物 118 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1896] 表 C46

[1897] 表 C46 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 125 的引用。例如,表 C46 中的第一混合物指定为 C46-1 并且其为化合物 125 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1898] 表 C47

[1899] 表 C47 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 137 的引用。例如,表 C47 中的第一混合物指定为 C47-1 并且其为化合物 137 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1900] 表 C48

[1901] 表 C48 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 183 的引用。例如,表 C48 中的第一混合物指定为 C48-1 并且其为化合物 183 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1902] 表 C49

[1903] 表 C49 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 190 的引用。例如,表 C49 中的第一混合物指定为 C49-1 并且其为化合物 190 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1904] 表 C50

[1905] 表 C50 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 191 的引用。例如,表 C50 中的第一混合物指定为 C50-1 并且其为化合物 191 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1906] 表 C51

[1907] 表 C51 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引

用替换为对化合物 196 的引用。例如,表 C51 中的第一混合物指定为 C51-1 并且其为化合物 196 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1908] 表 C52

[1909] 表 C52 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 229 的引用。例如,表 C52 中的第一混合物指定为 C52-1 并且其为化合物 229 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1910] 表 C53

[1911] 表 C53 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 231 的引用。例如,表 C53 中的第一混合物指定为 C53-1 并且其为化合物 231 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1912] 表 C54

[1913] 表 C54 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 254 的引用。例如,表 C54 中的第一混合物指定为 C54-1 并且其为化合物 254 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1914] 表 C55

[1915] 表 C55 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 257 的引用。例如,表 C55 中的第一混合物指定为 C55-1 并且其为化合物 257 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1916] 表 C56

[1917] 表 C56 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 272 的引用。例如,表 C56 中的第一混合物指定为 C56-1 并且其为化合物 272 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1918] 表 C57

[1919] 表 C57 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 289 的引用。例如,表 C57 中的第一混合物指定为 C57-1 并且其为化合物 289 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1920] 表 C58

[1921] 表 C58 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 296 的引用。例如,表 C58 中的第一混合物指定为 C58-1 并且其为化合物 296 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1922] 表 C59

[1923] 表 C59 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 299 的引用。例如,表 C59 中的第一混合物指定为 C59-1 并且其为化合物 299 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1924] 表 C60

[1925] 表 C60 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 307 的引用。例如,表 C60 中的第一混合物指定为 C60-1 并且其为化合物 307 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1926] 表 C61

[1927] 表 C61 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 308 的引用。例如,表 C61 中的第一混合物指定为 C61-1 并且其为化合物 308 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1928] 表 C62

[1929] 表 C62 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 315 的引用。例如,表 C62 中的第一混合物指定为 C62-1 并且其为化合物 315 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1930] 表 C63

[1931] 表 C63 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 343 的引用。例如,表 C63 中的第一混合物指定为 C63-1 并且其为化合物 343 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1932] 表 C64

[1933] 表 C64 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 344 的引用。例如,表 C64 中的第一混合物指定为 C64-1 并且其为化合物 344 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1934] 表 C65

[1935] 表 C65 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 352 的引用。例如,表 C65 中的第一混合物指定为 C65-1 并且其为化合物 352 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1936] 表 C66

[1937] 表 C66 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 363 的引用。例如,表 C66 中的第一混合物指定为 C66-1 并且其为化合物 363 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1938] 表 C67

[1939] 表 C67 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 364 的引用。例如,表 C67 中的第一混合物指定为 C67-1 并且其为化合物 364 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1940] 表 C68

[1941] 表 C68 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 368 的引用。例如,表 C68 中的第一混合物指定为 C68-1 并且其为化合物 368 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1942] 表 C69

[1943] 表 C69 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 381 的引用。例如,表 C69 中的第一混合物指定为 C69-1 并且其为化合物 381 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1944] 表 C70

[1945] 表 C70 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 385 的引用。例如,表 C70 中的第一混合物指定为 C70-1 并且其为化合物 385 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。



[1946] 表 C71

[1947] 表 C71 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 421 的引用。例如,表 C71 中的第一混合物指定为 C71-1 并且其为化合物 421 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1948] 表 C72

[1949] 表 C72 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 433 的引用。例如,表 C72 中的第一混合物指定为 C72-1 并且其为化合物 433 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1950] 表 C73

[1951] 表 C73 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 435 的引用。例如,表 C73 中的第一混合物指定为 C73-1 并且其为化合物 435 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1952] 表 C74

[1953] 表 C74 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 448 的引用。例如,表 C74 中的第一混合物指定为 C74-1 并且其为化合物 448 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1954] 表 C75

[1955] 表 C75 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 449 的引用。例如,表 C75 中的第一混合物指定为 C75-1 并且其为化合物 449 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1956] 表 C76

[1957] 表 C76 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 450 的引用。例如,表 C76 中的第一混合物指定为 C76-1 并且其为化合物 450 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1958] 表 C77

[1959] 表 C77 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 451 的引用。例如,表 C77 中的第一混合物指定为 C77-1 并且其为化合物 451 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1960] 表 C78

[1961] 表 C78 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 462 的引用。例如,表 C78 中的第一混合物指定为 C78-1 并且其为化合物 462 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1962] 表 C79

[1963] 表 C79 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 482 的引用。例如,表 C79 中的第一混合物指定为 C79-1 并且其为化合物 482 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1964] 表 C80

[1965] 表 C80 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 490 的引用。例如,表 C80 中的第一混合物指定为 C80-1 并且其为化合

物 490 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1966] 表 C81

[1967] 表 C81 与表 C1 相同,不同的是标题为“Cmpd. No.”的栏中的对化合物 1 的每个引用替换为对化合物 493 的引用。例如,表 C81 中的第一混合物指定为 C81-1 并且其为化合物 493 和附加杀真菌剂烯丙异噻唑的混合物。

[1968] 在农学和非农学应用中,通过将生物学有效量的一种或多种通常为组合物形式的本发明的化合物施用到害虫环境中,包括侵染的农学 and / 或非农学场所,施用到要保护的区域中,或直接施用到要控制的害虫上,来防治无脊椎害虫。

[1969] 因此本发明包括在农学 and / 或非农学应用中防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境接触生物学有效量的一种或多种本发明的化合物,或接触包含至少一种此类化合物的组合物,或接触包含至少一种此类化合物和生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或试剂的组合物。包含本发明的化合物和生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或试剂的合适组合物的实例包括颗粒状组合物,其中所述附加活性化合物存在于与本发明的化合物颗粒相同的颗粒上,或者存在于与本发明的化合物的那些颗粒不相同的颗粒上。

[1970] 本发明的方法的实施方案包括接触所述环境。值得注意的是其中所述环境为植物的所述方法。还值得注意的是其中所述环境为动物的所述方法。还值得注意的是其中所述环境为种子的所述方法。

[1971] 为实现与本发明的化合物或组合物接触以保护大田作物免受无脊椎害虫的侵害,通常在种植之前将所述化合物或组合物施用到作物种子上,施用到作物植株的叶子(例如叶片,茎秆,花朵,果实)上,或在作物种植之前或之后施用到土壤或其它生长介质中。

[1972] 接触方法的一个实施方案是通过喷雾。作为另外一种选择,可将包含本发明的化合物的颗粒状组合物施用到植物叶子上或土壤中。还可通过使植物与以浸壤液体制剂形式,以施用到土壤中的颗粒状制剂形式,以育苗箱处理物或移植浸泡形式施用的包含本发明的化合物的组合物接触,经由植物摄入来有效递送本发明的化合物。值得注意的是浸壤液体制剂形式的本发明的组合物。还值得注意的是防治无脊椎害虫的方法,所述方法包括使无脊椎害虫或其环境接触生物学有效量的本发明的化合物,或接触包含生物学有效量的本发明的化合物的组合物。还值得注意的是这样的方法,其中环境为土壤,并且将所述组合物作为浸壤制剂施用到土壤中。还值得注意的是,还可通过局部施用到所侵染的位置上来使本发明的化合物生效。其它接触方法包括通过直接喷雾和滞留喷雾,航空喷洒,凝胶,种子包衣,微胶囊化,全身吸收,饵料,耳标,大丸剂,喷雾器,熏剂,气溶胶,粉剂以及其它许多方法,来施用本发明的化合物或组合物。接触方法的一个实施方案是尺寸上稳定的肥料颗粒,包含本发明的化合物或组合物的小棍或片剂。本发明的化合物还可浸渍到用于组装无脊椎动物防治装置(例如防昆虫网)的物质中。

[1973] 本发明的组合物还可用于提供保护种子免受无脊椎害虫的侵害的种子处理剂中。在本公开和权利要求上下文中,处理种子是指,使种子接触通常被配成本发明的组合物的生物学有效量的本发明的化合物。这样的种子处理剂保护种子免受无脊椎土壤害虫的侵害,并且一般还可保护由发芽的种子发育成的幼苗的根和其它接触土壤的植物部分。所述种子处理剂还通过使本发明的化合物或第二活性成分在发育的植株中移动,向叶子提供保

护。可将种子处理剂施用到各种类型种子上,包括可发芽形成转基因植株以表达特定特征的那些种子。代表性实例包括表达对无脊椎害虫具有毒性的蛋白质的那些,诸如苏云金芽孢杆菌毒素,或表达抗除草剂性的那些,诸如提供草甘膦抗性的草甘膦乙酰转移酶。

[1974] 种子处理的一种方法是在播撒种子之前,用本发明的化合物(即作为配制好的组合物)喷雾或撒粉于种子上。配制用于种子处理的组合物一般包含成膜剂或粘合剂。因此,本发明的种子包衣组合物通常包含生物学有效量的式 1 的化合物,N-氧化物或其盐和成膜剂或粘合剂。通过将可流动的悬浮液浓缩液直接喷雾到种子滚动床中,然后将种子干燥,来将种子包衣。作为另外一种选择,可将其它制剂类型如湿粉,溶液,悬乳液,乳油和乳液的水溶液喷雾到种子上。该方法尤其可用于将膜包衣施用到种子上。本领域技术人员可采用各种包衣设备和方法。合适的方法包括 P. Koster 等人的“Seed Treatment: Progress and Prospects”(1994BCPC 专著 No. 57) 以及其中所列参考文献中列出的那些。

[1975] 经处理的种子通常包含本发明的化合物,其量为约 0.1g 至 1kg 每 100kg 种子(即处理前按所述种子的重量计为约 0.0001 至 1%)。用于种子处理的可流动的悬浮液制剂通常包含约 0.5 至约 70% 的活性成分,约 0.5 至约 30% 的成膜粘合剂,约 0.5 至约 20% 的分散剂,0 至约 5% 的增稠剂,0 至约 5% 的颜料和 / 或染料,0 至约 2% 的消泡剂,0 至约 1% 的防腐剂,和 0 至约 75% 的挥发性液体稀释剂。

[1976] 本发明的化合物可被掺入到饵料组合物中,所述饵料组合物可被无脊椎害虫食用,或用于装置如诱捕器,饵料站等中。此类饵料组合物可为颗粒形式,其包含 (a) 活性成分即生物学有效量的式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐;(b) 一种或多种食物物料;任选的 (c) 诱虫剂,和任选的 (d) 一种或多种湿润剂。值得注意的是颗粒或饵料组合物,其包含约 0.001-5% 的活性成分,约 40-99% 的食物物料和 / 或诱虫剂;以及任选约 0.05-10% 的湿润剂,其可在非常低的施用量下,尤其是在摄取而不是直接接触时致命的活性成分剂量下,有效控制土壤无脊椎害虫。某些食物物料既可用于食物源,也可用作诱虫剂。食物物料包括碳水化合物,蛋白质和脂质。食物物料的实例是蔬菜粉,糖,淀粉,动物脂,植物油,酵母提取物和乳固体。诱虫剂的实例是增味剂和调味剂,诸如水果或植物提取物,香料,或其它动物或植物组分,信息素或已知用于吸引目标无脊椎害虫的其它试剂。湿润剂即保水剂实例是乙二醇和其它多元醇,甘油和山梨醇。值得注意的是用于控制至少一种选自蚂蚁,白蚁和蟑螂的无脊椎害虫的饵料组合物(以及使用此类饵料组合物的方法)。用于防治无脊椎害虫的装置包括本发明的饵料组合物和适于容纳所述饵料组合物的外罩,其中所述外罩具有至少一个开口,所述开口的尺寸能够使无脊椎害虫通过,以使无脊椎害虫能够从位于外罩外部的位臵触及所述饵料组合物,并且其中所述外罩还适于放置在潜在或已知的无脊椎害虫活动场所之中或附近。

[1977] 可在无其它辅剂的情况下施用本发明的化合物,但是最常见的施用是施用制剂,所述制剂包含一种或多种具有合适载体,稀释剂和表面活性剂的活性成分,并且根据所设想的最终用途,有可能与食物组合。一种施用方法涉及将本发明的化合物的水分散体或精炼油溶液进行喷雾。与喷雾油,喷雾油浓缩液,粘展剂,辅剂,其它溶剂以及增效剂诸如胡椒基丁醚的组合通常可增强化合物效果。就非农学用途而言,此类喷雾可从喷雾容器诸如罐,瓶或其它容器中,经由泵或通过将其从加压容器例如加压气溶胶喷雾罐中释出来施用。此类喷雾组合物可采取多种形式,例如喷雾,薄雾,泡沫,烟雾或尘雾。因此,此类喷雾组合物

还可根据应用的需要,包含推进剂,发泡剂等。值得注意的是喷雾组合物,所述组合物包含生物学有效量的本发明的化合物或组合物,以及载体。此类喷雾组组合物的一个实施方案包含生物学有效量的本发明的化合物或组合物,以及推进剂。代表性的推进剂包括但不限于甲烷,乙烷,丙烷,丁烷,异丁烷,丁烯,戊烷,异戊烷,新戊烷,戊烯,氢氟烃,氯氟烃,二甲基醚,以及前述的混合物。值得注意的是用于控制至少一种无脊椎害虫的喷雾组合物(以及使用由喷雾容器分配出的此类喷雾组组合物的方法),所述无脊椎害虫选自蚊子,墨蚊,厩蝇,鹿虻,马虻,黄蜂,胡蜂,大胡蜂,壁虱,蜘蛛,蚂蚁,蚋等,包括各种上述害虫或其组合。

[1978] 非农学用途是指在非农作物田地的区域中防治无脊椎害虫。本发明的化合物和组合物的非农学用途包括控制储藏的谷物,菜豆和其它食品中的以及纺织物诸如衣服和地毯中的无脊椎害虫。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括控制观赏植物,森林作物,庭院,沿路边和铁路的公用事业用地,以及草皮如草坪,高尔夫球场和牧场上的无脊椎害虫。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括控制由人和/或伴侣动物,家畜,农场动物,动物园动物或其它动物居住的居室和其它建筑物中的无脊椎害虫。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括控制会损坏用于建筑中的木头或其它建筑物质的害虫如白蚁。

[1979] 本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括通过控制寄生或传播传染病的无脊椎害虫来保护人和动物的健康。控制动物寄生虫包括控制寄生在宿主动物身体表面(例如肩部,腋窝,腹部,大腿内侧)的体外寄生虫以及寄生在宿主动物身体内部(例如胃,肠,肺,静脉,皮下,淋巴组织)中的体内寄生虫。体外寄生性或疾病传播性害虫包括例如恙螨,壁虱,虱子,蚊子,苍蝇,螨虫和跳蚤。体内寄生虫包括犬恶丝虫,钩虫和蠕虫。本发明的化合物和组合物尤其适于抗击体外寄生性或疾病传播性害虫。本发明的化合物和组合物适于全身和/或非全身性控制由寄生虫对动物造成的侵染或感染。

[1980] 本发明的化合物和组合物适于抗击以动物为寄生对象的寄生虫,所述动物包括那些野生动物,牲畜和农学役用动物,如牛,绵羊,山羊,马,猪,驴,骆驼,野牛,水牛,兔子,母鸡,火鸡,鸭和鹅(例如饲养以获得肉,奶,黄油,蛋,毛皮,皮革,羽毛和/或羊毛)。通过抗击寄生虫,减少了死亡率并且缓解了收益降低(在肉,奶,羊毛,毛皮,蛋,蜂蜜等方面),使得包含本发明的化合物的组合物的施用能够更加经济并且使动物的饲养更加简便。

[1981] 本发明的化合物和组合物尤其适于抗击以伴侣动物和宠物(例如狗,猫,宠物鸟和观赏鱼),研究和实验动物(例如仓鼠,豚鼠,大鼠和小鼠)以及饲养于动物园,野外栖息地和/或马戏团中的动物为寄生体的寄生虫。

[1982] 在本发明的实施方案中,所述动物优选地为脊椎动物,并且更优选地为哺乳动物、禽类或鱼类。在特定实施方案中,动物对象为哺乳动物(包括大猿类,诸如人类)。其它哺乳类对象包括灵长目动物(例如猴子)、牛科动物(例如畜牛或奶牛)、猪科动物(例如家养猪或野猪)、羊科动物(例如山羊或绵羊)、马科动物(例如马)、犬科动物(例如狗)、猫科动物(例如家猫)、骆驼、鹿、驴、野牛、水牛、羚羊、兔子和啮齿动物(例如豚鼠、松鼠、大鼠、小鼠、沙鼠和仓鼠)。禽类包括鸭科动物(天鹅、鸭和鹅)、鸠鸽科动物(例如斑鸠和家鸽)、雉科动物(例如鹌鹑、松鸡和火鸡)、鸡科动物(例如家鸡)、鸚鵡科动物(例如长尾小鸚鵡、金刚鸚鵡和鸚鵡)、猎禽和平胸鸟(例如鸵鸟)。

[1983] 由本发明的化合物处理或保护的鸟与商业或非商业鸟类饲养相关。这些包括鸭科动物如天鹅,鹅和鸭,鸠鸽科动物如斑鸠和家鸽,雉科动物如鹌鹑,松鸡和火鸡,鸡科动物如

家鸡,以及鸚鵡科动物如长尾小鸚鵡,金刚鸚鵡和为宠物或收集市场饲养的鸚鵡等等。

[1984] 就本发明目的而言,术语“鱼”应被理解为无限制地包括真骨鱼类鱼即硬骨鱼。鲑目(其包括鲑科)和鲈形目(其包括棘臀鱼科)均包含在真骨鱼类中。可能的鱼受体实例包括鲑科,鲟科,鲟科,丽鱼科和棘臀鱼科等等。

[1985] 还设想受益于本发明的方法的其它动物,包括有袋目哺乳动物(诸如袋鼠),爬行动物(诸如养殖鳖)以及本发明的方法可安全有效地为其处理或预防寄生虫感染或侵染的其它具有经济重要性的家畜。

[1986] 通过向待保护动物施用杀寄生虫有效量的本发明的化合物而受控的无脊椎寄生虫实例包括体外寄生虫(节肢类,蠕虫类等)和体内寄生虫(蠕虫类,例如线虫,吸虫,绦虫,棘头虫等)。

[1987] 一般描述为蠕虫病的疾病或一类疾病应归因于动物宿主被称为蠕虫的寄生虫感染。术语“蠕虫”旨在包括线虫,吸虫,绦虫和棘头虫。蠕虫病是与驯养动物诸如猪,绵羊,马,牛,山羊,狗,猫和家禽相关的普遍并且严重的经济问题。

[1988] 在蠕虫中,描述为线虫的一类蠕虫可在多种类型动物中引发广泛并且有时严重的感染。设想可用本发明的组合物和本发明的方法处理的线虫动物无限制地包括下列属:棘唇线虫属、猫圆线虫属、钩口线虫属、血管圆线虫属、鸡蛔虫属、蛔虫属、布鲁格氏丝虫属、仰口线虫属、毛细线虫属、夏氏线虫属、古柏线虫属、环体线虫属、网尾线虫属、膨结线虫属、棘唇线虫属、裂头绦虫属、恶丝虫属、龙线虫属、蛲虫属、类丝虫属、血矛线虫属、异刺线虫属、兔唇蛔虫属、罗阿丝虫属、曼森线虫属、缪勒线虫属、板口线虫属、细颈线虫属、结节线虫属、胃线虫属、尖尾线虫属、副丝虫属、副蛔虫属、泡翼线虫属、原圆线虫属、鬃丝虫属、旋尾线虫属、冠丝虫属、类圆线虫属、圆线虫属、吸吮线虫属、弓蛔虫属、弓蛔虫属、毛线虫属、毛线属、毛圆线虫属、鞭虫属、钩虫属和吴策线虫属。

[1989] 在上文中,可感染上述动物的最常见线虫属是血矛线虫属,毛圆线虫属,胃线虫属,细颈线虫属,古柏线虫属,蛔虫属,仰口线虫属,结节线虫属,夏氏线虫属,鞭虫属,圆线虫属,毛线属,网尾线虫属,毛细线虫属,异刺线虫属,弓蛔虫属,鸡蛔虫属,尖尾线虫属,钩口线虫属,钩虫属,弓蛔虫属和副蛔虫属。这些中的某些诸如细颈线虫属,古柏线虫属和结节线虫属主要攻击肠道,而另一些诸如血矛线虫属和胃线虫属更盛行于胃部,而另一些诸如网尾线虫属存在于肺中。其它寄生虫还位于其它组织中,诸如心脏和血管,皮下组织和淋巴组织等。

[1990] 设想可用本发明的组合物和本发明的方法处理的吸虫无限制地包括下列属:重翼吸虫属、片吸虫属、侏形吸虫属、后睾吸虫属、并殖吸虫属和血吸虫属。

[1991] 设想可用本发明的组合物和本发明的方法处理的绦虫无限制地包括下列属:裂头绦虫属、复孔绦虫属、迭宫绦虫属和带绦虫属。

[1992] 人胃肠道的最常见寄生虫属是钩口线虫属、板口线虫属、蛔虫属、类圆线虫属、毛线虫属、毛细线虫属、鞭虫属和蛲虫属。其它存在于血液或胃肠道外其它组织和器官中的具有医学重要性的寄生虫属是丝虫诸如吴策线虫属,布鲁格氏丝虫属,旋盘尾丝虫和罗阿丝虫属以及龙线虫属丝虫,以及其它肠段蛔虫类圆线虫属和毛线虫属丝虫。

[1993] 众多其它蠕虫属和物种是本领域已知的,并且也可设想用本发明的化合物处理。这些更详细地列举于 Textbook of Veterinary Clinical Parasitology, 第1卷,

Helminths, E. J. L. Soulsby, F. Davis Co., Philadelphia, Pa.) ; Helminths, Arthropods and Protozoa (Monnig 的 Veterinary Helminthology and Entomology 第 6 版), E. J. L. Soulsby, The Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md) 中。

[1994] 还设想,本发明的化合物可有效地抵抗多种动物体外寄生虫,例如哺乳动物和鸟类的节肢动物体外寄生虫,然而也可设想,某些节肢动物还可以是体内寄生虫。

[1995] 因此,昆虫和蜱螨害虫包括例如叮咬昆虫如苍蝇和蚊子,螨虫,壁虱,虱子,跳蚤,椿象,寄生蛆等。

[1996] 苍蝇成虫包括,例如,角蝇或扰血蝇,马虻或马蝇,厩蝇或厩螯蝇,墨蚊或黑蝇,鹿虻或斑虻,虱蝇或飞虱,采采蝇或舌蝇。寄生性蝇蛆包括例如肤蝇(胃蝇和狂蝇),绿头苍蝇或丽蝇,旋蝇蛆或旋丽蝇幼虫,牛皮蝇或足跟蝇,羊毛蝇蛆和马胃蝇蛆。蚊子包括例如库蚊属,按蚊属和伊蚊属。

[1997] 螨虫包括中气门目属,如中国巨刺螨,诸如鸡螨、鸡皮刺螨;疥螨或痒螨,如疥螨科属,例如疥螨;兽疥螨,如痒螨科属,包括牛足螨和羊痒螨;恙螨,如恙螨科属,例如北美恙螨、阿氏真恙螨。

[1998] 扁虱包括,如软体蜱,包括隐喙蜱科属,例如锐缘蜱属和纯绿蜱属;硬体蜱包括硬蜱科属,例如血红扇头蜱、变异革蜱、安氏革蜱、美洲钝眼蜱、肩突硬蜱牛蜱属。

[1999] 虱子包括,如吸虱,如禽虱属和牛毛虱属;食毛虱,如血虱属、长颚虱属和盲虱属。

[2000] 跳蚤包括例如栲头蚤属类型诸如犬蚤 (*Ctenocephalides canis*) 和猫蚤 (*Ctenocephalides felis*);客蚤属,如东方鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis*);和蚤属,如人蚤 (*Pulex irritans*)。

[2001] 椿象包括例如臭虫属椿象或例如常见的臭虫 (*Cimex lectularius*);椎猎蝽亚科属,包括还被称为猎蝽的猎蝽;例如长红猎蝽和锥蝽属。

[2002] 一般来讲,苍蝇,跳蚤,虱子,蚊子,蚋,螨虫,壁虱和蠕虫对对牲畜和伴侣动物领域造成了巨大的损失。节肢动物寄生虫还对人造成麻烦,并且可以是人和动物致病生物体的载体。

[2003] 众多其它节肢动物害虫和体外寄生虫是本领域已知的,并且也可设想用本发明的化合物处理。这些在 D. S. Kettle 的 *Medical and Veterinary Entomology*, John Wiley & Sons, New York and Toronto; *Control of Arthropod Pests of Livestock: A Review of Technology*, R. O. Drummand, J. E. George, 和 S. CRC Press, Boca Raton, Fla. 中极详细地枚举。

[2004] 本发明的化合物和组合物还可有效抵抗众多动物原虫体内寄生虫,包括下表 1 中总结的那些。

[2005]

表 1				
示例性寄生原生动物和相关的人体疾病				
门	亚门	具有代表性的属	人体疾病或不适	
肉足鞭毛虫门 (带有鞭毛, 伪足或两者)	鞭毛虫亚门 (鞭毛)	利什曼原虫属	内脏, 皮肤和粘膜 皮肤感染	
		锥虫属	昏睡病 恰加斯氏病	
		梨形鞭毛虫属	痢疾	
			毛滴虫属	阴道炎
		肉足虫纲 (伪足)	内阿米巴属	痢疾, 肝脓肿
			双核阿米巴属	结肠炎
			纳氏虫属和棘阿米巴属	中枢神经系统和角 膜溃疡
			巴贝虫属	巴贝西虫病
	顶复门 (顶复体)		疟原虫属	疟疾
			等孢子球虫属	痢疾
		肉孢子虫属	痢疾	
		隐孢子虫属	痢疾	
		弓首线虫属	弓形体病	
		艾美虫属	鸡球虫病	
微孢子门			肠胞虫属	痢疾
纤毛门 (具有纤毛)		肠袋虫属	痢疾	
未分类		肺囊虫属	肺炎	

[2006] 具体地讲, 本发明的化合物可有效地抵抗体外寄生虫, 包括: 跳蚤如 *Ctenocephalides felis* (猫蚤) 和 *Ctenocephalides canis* (犬蚤)。

[2007] 本发明的化合物还可有效地抵抗其它体外寄生虫, 包括飞虫, 如 *Haematobia* (角蝇属)、*irritans* (角蝇)、*Stomoxys calcitrans* (厩蝇)、*Simulium* 属 (黑蝇)、*Glossina* 属 (舌蝇)、*Hydrotaea irritans* (大头苍蝇)、*Musca autumnalis* (秋家蝇)、*Musca domestica* (家蝇)、*Morellia simplex* (筒莫蝇)、*Tabanus* 属 (马虻)、牛皮蝇、纹皮蝇、丝光绿蝇、铜绿蝇 (丝光绿蝇)、*Calliphora* 属 (丽蝇)、库蠅属、*Oestrus ovis* (羊鼻蝇)、*Culicoides* 属 (蠅)、马蝇、马胃蝇、赤马胃蝇和马鼻胃蝇; 虱子, 如牛虱 (畜虱属)、马毛虱、驴血虱、猫鸟虱、犬虱、棘颚虱和犬啮毛虱; 羊蝉蝇, 如羊蝉; 螨虫, 如痒螨属、疥螨、牛足螨、马蠕螨、姬螯螨属、猫耳螨、恙螨属和耳螨 (耳螨); 和扁虱, 如硬蜱属、牛蜱属、扇头蜱属、钝眼蜱属、革蜱属、璃眼蜱属和血蜱属。

[2008] 可用于本发明的组合物中的生物学活性化合物或试剂包括有机磷酸酯杀虫剂。此类杀虫剂作为杀昆虫剂具有非常广泛的活性, 并且在某些情况下, 具有驱虫活性。有机磷酸酯杀虫剂包括例如百治磷、特丁硫磷、乐果、敌匹硫磷、乙拌磷、敌百虫、甲基谷硫磷、氯蜱硫磷、马拉硫磷、乙酰甲胺磷、甲胺磷、高灭磷、乙基对硫磷、甲基对硫磷、速灭磷、甲拌磷、三硫磷和伏杀硫磷。还设想包括本发明的方法和组合物与氨基甲酸酯型杀虫剂的组合, 以及与有机氯型杀虫剂的组合, 所述氨基甲酸酯型杀虫剂包括例如西维因、克百威、涕灭威、禾草

特、乙肟威、克百威等。还设想包括与生物杀虫剂的组合,所述生物杀虫剂包括拒斥剂、除虫菊酯(以及其合成变体,例如丙烯菊酯,灭虫菊,扑灭司林,四溴菊酯)和通常用作杀螨剂的尼古丁。其它设想的组合为混杂的杀虫剂,包括:芽孢杆菌、克氯苯、甲脒(如双甲脒)、铜化合物(如氢氧化铜和氧氯硫酸铜盐)、氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、三氯杀螨醇、硫丹、高氰戊菊酯、氰戊菊酯、 $\lambda$ -三氟氯氰菊酯、甲氧滴滴涕和硫。

[2009] 值得注意的是附加的生物学活性化合物或试剂,其选自本领域已知的驱肠虫剂,诸如阿维菌素(例如伊维菌素,莫西菌素,米尔倍霉素),苯并咪唑(例如阿苯达唑,三氯苯咪唑),N-水杨酰苯胺(例如氯生太尔,羟氯扎胺),取代的苯酚(例如硝羟碘苜腈),嘧啶(例如噻嘧啶),咪唑噻唑(例如左咪唑)和吡啶酮。

[2010] 可用于本发明的组合物中的其它生物学活性化合物或试剂可选自昆虫生长调节剂(IGR)和保幼激素类似物(JHA),诸如除虫脲,杀虫脲,氟佐隆,赛灭净,甲氧普烯等,从而向动物对象以及动物对象的环境提供对寄生虫的初始和持续防治(在昆虫生长的所有阶段,包括卵)。

[2011] 值得注意的是可用于本发明的组合物中的生物学活性化合物或试剂,其选自抗寄生虫类阿维菌素化合物。如上所述,阿维菌素类化合物是已知可用于抵抗广谱哺乳动物体内寄生虫和体外寄生虫的一系列强效抗寄生虫剂。

[2012] 可用于本发明范畴内的值得注意的化合物是伊维菌素。伊维菌素是阿维菌素的半合成衍生物,并且一般被制成至少 80% 22,23-二氢阿维菌素 B<sub>1a</sub> 和小于 20% 22,23-二氢阿维菌素 B<sub>1b</sub> 的混合物。伊维菌素公开于 U. S. 4, 199, 569 中。

[2013] 阿巴美丁是在 U. S. 4, 310, 519 中作为阿维菌素 B<sub>1a</sub>/B<sub>1b</sub> 公开的阿维菌素。阿巴美丁包含至少 80% 的阿维菌素 B<sub>1a</sub> 和不超过 20% 的阿维菌素 B<sub>1b</sub>。

[2014] 另一种值得注意的阿维菌素是多拉菌素,其还被称为 25-环己基阿维菌素 B<sub>1</sub>。多拉菌素的结构和制备公开于 U. S. 5, 089, 480 中。

[2015] 另一种值得注意的阿维菌素是莫西菌素。莫西菌素还被称为 LL-F28249  $\alpha$ , 由 U. S. 4, 916, 154 中获知。

[2016] 另一种值得注意的阿维菌素是塞拉菌素。塞拉菌素是 25-环己基-25-脱(1-甲基丙基)-5-脱氧-22,23-二氢-5-(异亚硝基)-阿维菌素 B<sub>1</sub> 单糖。

[2017] 米尔倍霉素或 B41 是从产生米尔倍霉素的链霉菌属菌株发酵液中分离出的物质。微生物,发酵条件和分离方法更充分地描述于 U. S. 3, 950, 360 和 U. S. 3, 984, 564 中。

[2018] 按照 U. S. 5, 288, 710 或 U. S. 5, 399, 717 所述制得的甲氨基阿维菌素(4''-脱氧-4''-表-甲基氨基阿维菌素 B<sub>1</sub>) 是两种同系物 4''-脱氧-4'-表-甲基氨基阿维菌素 B<sub>1a</sub> 和 4''-脱氧-4''-表-甲基氨基阿维菌素 B<sub>1b</sub> 的混合物。优选地使用甲氨基阿维菌素的盐。可用于本发明中的甲氨基阿维菌素盐的非限制性实例包括 U. S. 5, 288, 710 中所述的盐,例如衍生自苯甲酸,取代的苯甲酸,苯磺酸,柠檬酸,磷酸,酒石酸,马来酸等的盐。可用于本发明中的甲氨基阿维菌素盐最优选地为甲氨基阿维菌素苯甲酸盐。

[2019] 依立诺克丁在化学上被称为 4''-表-乙酰基氨基-4''-脱氧-阿维菌素 B<sub>1</sub>。特别研制依立诺克丁,以用于所有牛类别和年龄组。它是对体内和体外寄生虫显示出广谱活性,同时还在肉和奶中留有极少残留物的第一阿维菌素。当局部递送时,它具有高效的附加优点。



[2020] 本发明的组合物任选地包含一种或多种下列杀寄生虫药化合物的组合：咪唑并[1,2-b] 哒嗪化合物，如由提交于 2004 年 12 月 22 日的美国专利申请系列号 11/019,597，和如公布于 2005 年 8 月 18 日的 US 2005-0182059A1 中所述；1-(4-一和二卤甲基磺酰基苯基)-2- 酰氨基-3- 氟丙醇化合物，如由提交于 2004 年 12 月 21 日的美国专利申请系列号 11/018,156，现在的美国专利 7,361,689 中所述；三氟甲烷磺酰苯胺脒醚衍生物，如由提交于 2005 年 9 月 21 日的美国专利申请系列号 11/231,423，现在的美国专利 7,312,248 中所述；和提交于 2005 年 6 月 9 日的美国临时申请系列号 60/688,898 和公布于 2006 年 12 月 14 日的 US 2006-0281695A1 中所述的 n-[( 苯氧基) 苯基]-1,1,1- 三氟甲磺酰胺和 n-[( 苯硫基) 苯基]-1,1,1- 三氟甲磺酰胺衍生物。

[2021] 本发明的组合物还可包含杀吸虫剂。合适的杀吸虫剂包括例如三氯苯咪唑，芬苯哒唑，阿苯达唑，氯舒隆和奥苯达唑。应当理解，上文的组合还可包括抗生素，抗寄生虫和抗吸虫活性化合物的组合。

[2022] 除了上述组合以外，还设想提供如本文所述的本发明的方法和化合物与其它动物健康药物的组合，所述动物健康药物如痕量元素，抗炎剂，抗感染剂，激素，皮肤病制剂（包括防腐剂和消毒剂）和免疫制剂如用于预防疾病的疫苗和抗血清。

[2023] 例如，此类抗感染剂包括在使用本发明的化合物或方法处理期间，任选可以例如组合的组合物形式和 / 或分开的剂型同时施用的一种或多种抗生素。适用于此目的的本领域已知的抗生素包括例如下列那些。

[2024] 一种可用的抗生素是氟苯尼考，其还被称为 D-( 苏式)-1-(4- 甲磺酰苯基)-2- 二氯乙酰氨基-3- 氟-1- 丙醇。另一种值得注意的抗生素化合物是 D-( 苏式)-1-(4- 甲磺酰苯基)-2- 二氟乙酰氨基-3- 氟-1- 丙醇。另一种可用的抗生素是甲砒氯霉素。用于制造这些可用于此类方法的抗生素化合物和中间体的方法描述于 U. S. 4,311,857 ;U. S. 4,582,918 ;U. S. 4,973,750 ;U. S. 4,876,352 ;U. S. 5,227,494 ;U. S. 4,743,700 ;U. S. 5,567,844 ;U. S. 5,105,009 ;U. S. 5,382,673 ;U. S. 5,352,832 和 U. S. 5,663,361 中。其它氟苯尼考类似物和 / 或药物前体已被公开，并且此类类似物也被用于本发明的组合物和方法中（参见例如美国专利申请公布 2004/0082553，现在的美国专利 7,041,670，和美国专利公开申请序列号 11/016,794，现在的美国专利 7,153,842）。

[2025] 另一种可用的抗生素化合物是替米考星。替米考星是大环内酯抗生素，其在化学上被定义为 20- 二氢-20- 脱氧-20-( 顺式-3,5- 二甲基哌啶-1- 基)- 脱碳酶糖泰乐菌素，并且据报道，其公开于 U. S. 4,820,695 中。

[2026] 另一种可用于本发明中的有用抗生素是土拉霉素。土拉霉素还被称为 (2R,3S,4R,5R,8R,10R,11R,12S,13S,14R) 13-[(2,6- 二脱氧-3-C- 甲基-3-O- 甲基-4-C-[( 丙基氨基) 甲基]- $\alpha$ -L- 核-己吡喃糖基] 氧基]-2- 乙基-3,4,10- 三羟基-3,5,8,10,12,14- 六甲基-11-[[3,4,6- 三脱氧-3-( 二甲基氨基)- $\beta$ -D- 木-己吡喃糖基] 氧基]-1- 氧杂-6- 氮杂环十五烷-15- 酮。土拉霉素可根据美国专利公布 2003/0064939A1 中所述的方法制得。

[2027] 可用于本发明更多的抗生素包括头孢菌素，例如头孢噻吩、头孢喹诺等。本发明制剂中先锋霉素的浓度任选地在介于约 1mg/mL 至 500mg/mL 之间变化。

[2028] 另一种可用的抗生素包括氟喹诺酮，如恩诺沙星，达氟沙星，二氟沙星，奥比沙星和马波沙星。恩诺沙星的施用浓度通常为约 100mg/mL。达氟沙星的施用浓度通常为约

180mg/mL。

[2029] 其它可用的大环内酯抗生素包括酮内酯类,或更具体地讲氮杂内酯类化合物。此类化合物描述于例如 U. S. 6, 514, 945, U. S. 6, 472, 371, U. S. 6, 270, 768, U. S. 6, 437, 151, U. S. 6, 271, 255, U. S. 6, 239, 112, U. S. 5, 958, 888, U. S. 6, 339, 063 和 U. S. 6, 054, 434 中。

[2030] 其它可用的抗生素包括四环素,尤其是氯四环素和氧四环素。其它抗生素可包括  $\beta$ -内酰胺诸如青霉素,例如青霉素、氨苄青霉素、阿莫西林、或阿莫西林与棒酸或其它  $\beta$ -内酰胺酶抑制剂的组合。

[2031] 在兽医部门中的非农学应用为通过常规的方法,如通过以例如片剂、胶囊、饮料、浸液制剂、颗粒、糊剂、大丸剂、喂入操作或栓剂的形式肠道给药;或通过以例如注射(包括肌肉注射、皮下注射、静脉注射、腹膜内注射)或植入的形式非肠道给药;通过经鼻给药;通过例如以浸入或浸渍、喷雾、洗涤、用粉末涂覆或施用到所述动物的小区域,以及通过包含本发明的组合物的制品如颈圈、耳标、尾带、肢带或缰绳的形式局部给药。

[2032] 本发明的任一种化合物或此类化合物的合适组合可被直接施用到动物对象上,和/或通过将其施用到动物所居住的局部环境(诸如垫草,围栏等)中来非直接施用。直接施用包括使动物对象的皮肤、毛皮或羽毛与所述化合物接触,或将所述化合物喂入动物或注射到动物体内。

[2033] 本发明的化合物可以受控释放形式施用,例如为皮下缓慢释放制剂,或为固定在动物上的受控释放装置形式如灭蚤项圈。用于受控释放杀昆虫剂以长期保护伴侣动物免受跳蚤侵染的项圈是本领域已知的,并且描述于例如 U. S. 3, 852, 416, U. S. 4, 224, 901, U. S. 5, 555, 848 和 U. S. 5, 184, 573 中。

[2034] 通常,根据本发明的杀寄生虫组合物包含式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐与一种或多种医药学或兽医学可接受的载体的混合物,所述载体包含赋形剂和助剂,其根据旨在的给药途径(例如口腔给药、局部给药或非肠道给药诸如注射)并且根据标准操作来选择。此外,根据与所述组合物中一种或多种活性成分的相容性,包括诸如对 pH 和含水量的相对稳定性的存在,来选择合适载体。因此,值得注意的是用于保护动物免受无脊椎寄生虫的侵害的组合物,所述组合物包含至少一种载体和杀寄生虫有效量的本发明的化合物。

[2035] 就非肠道给药(包括静脉注射,肌肉注射和皮下注射)而言,本发明的化合物可在油性或水性载体中被配制成悬浮液、溶液或乳液,并且可包含助剂,诸如悬浮剂、稳定剂和/或分散剂。还可配制本发明的化合物,以供快速浓注或连续滴注。供注射的药物组合物包括水溶性形式的活性成分(例如活性化合物的盐)水溶液,优选地在如药物制剂领域已知的包含其它赋形剂或助剂的生理相容缓冲液中。此外,可在亲脂性载体中制备活性化合物的悬浮液。合适的亲脂性载体包括脂肪油诸如芝麻油,合成脂肪酸酯诸如油酸乙酯和甘油三酯,或诸如脂质体的物质。注射悬浮液水溶液可包含增加所述悬浮液粘度的物质,诸如羧甲基纤维素钠,山梨醇或葡聚糖。用于注射的制剂可以单位剂型存在于例如安瓿(ampoules)容器或多剂量容器中。作为另外一种选择,所述活性成分可为粉末形式,在使用前与合适载体例如不含热原的无菌水组合。

[2036] 除了上述制剂以外,本发明的化合物还可被配成长效制剂。此类长效制剂可通过植入(例如皮下或肌肉)或通过肌肉注射或皮下注射来施用。就此给药途径而言,可将本发明的化合物与合适的聚合材料或疏水材料(例如在含有药物药学可接受的油的乳液

中),与离子交换树脂配制在一起,或将所述化合物配制成微溶性衍生物,诸如但不限于微溶性盐。

[2037] 就通过吸入给药而言,使用加压包装或喷雾器以及合适的推进剂可以气溶胶喷雾形式递送本发明的组合物,所述推进剂例如但不限于二氯二氟甲烷、三氯氟甲烷、二氯四氟乙烷或二氧化碳。就加压气溶胶而言,可通过提供阀门来控制剂量单位以递送定量的量。可配制用于吸入机或吹药器的明胶胶囊和药筒,以包含所述化合物的粉末混合物和合适的粉末基料诸如乳糖或淀粉。

[2038] 已发现,本发明的化合物具有有利的药代动力学和药效动力学特性,由口服和摄取提供全身利用度。因此,在要保护的动物摄取后,本发明的化合物在血液中的杀寄生虫有效浓度可保护被治疗的动物免受吸血性害虫诸如跳蚤,壁虱和虱子的侵害。因此值得注意的是保护动物免受无脊椎寄生害虫的侵害的口服形式的组合物(即除了杀寄生虫有效量的本发明的化合物以外,还包含一种或多种载体,所述载体选自适于口服的粘合剂和填料以及浓缩饲料载体)。

[2039] 就以溶液(最易得的吸收形式)、乳液、悬浮液、糊剂、凝胶、胶囊、片剂、大丸剂、粉末、颗粒、瘤胃保留物和饲料/水/舔砖形式的口服而言,可用本领域已知的适用于口服组合物的粘合剂/填料来配制本发明的化合物,诸如糖和糖衍生物(例如乳糖、蔗糖、甘露醇、山梨糖醇)、淀粉(例如玉米淀粉、小麦淀粉、大米淀粉、马铃薯淀粉)、纤维素及衍生物(例如甲基纤维素、羧甲基纤维素、乙基羟基纤维素)、蛋白质衍生物(例如玉米蛋白、凝胶)和合成聚合物(例如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮)。如果需要,可加入润滑剂(例如硬脂酸镁)、崩解剂(例如交联聚乙烯吡咯烷酮,琼脂,藻酸)以及染料或颜料。糊剂和凝胶通常还包含粘合剂(例如金合欢、藻酸、膨润土、纤维素、黄原胶、胶态硅酸铝镁),以有助于使组合物保持与口腔接触,并且不易被排出。

[2040] 如果杀寄生虫组合物为浓缩饲料形式,则所述载体通常选自高性能饲料,饲料用谷类或浓缩蛋白质。除了杀寄生虫活性成分以外,此类包含浓缩饲料的组合物还包含可促进动物健康或生长,改善来自宰杀动物的肉质或可用于畜牧业的添加剂。这些添加剂包括例如维生素、抗生素、化疗剂、抑菌剂、抑真菌剂、抗球虫药和激素。

[2041] 使用例如常规的栓剂基料如可可油或其它甘油酯,还可将式1的化合物配制到直肠给药组合物中,如栓剂或保留灌肠剂。

[2042] 用于局部给药的制剂通常为粉末、霜膏、悬浮液、喷雾、乳液、泡沫、糊剂、气溶胶、油膏剂、软膏或凝胶形式。局部用制剂更典型地为水溶性溶液,其可为使用前稀释的浓缩物形式。适于局部给药的杀寄生虫组合物通常包含本发明的化合物和一种或多种局部用合适载体。在将杀寄生虫组合物以线或点的形式(即准确疗法)局部施用到动物体外部时,活性成分在动物体表上迁移,以覆盖其大部分或所有的外表面积。因此,可保护被治疗的动物免受尤其从动物表皮取食的无脊椎害虫如壁虱、跳蚤和虱子的侵害。因此,用于局部定点给药的制剂通常包含至少一种有机溶剂,以有利于活性成分在动物皮肤上传递和/或渗透到动物表皮中。此类制剂中的载体包括丙二醇、石蜡、芳族化合物、酯(诸如肉豆蔻酸异丙酯)、乙二醇醚、醇(诸如乙醇、正丙醇,2-辛基十二烷醇或油醇);一羧酸酯的溶液,诸如肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、月桂酸草酸酯、油酸油基酯、油酸癸酯、月桂酸己酯、油酸油基酯、油酸癸酯、链长 $C_{12}$ - $C_{18}$ 的饱和脂肪醇的己酸酯;二羧酸酯的溶液,诸如邻苯二甲酸二丁酯、

间苯二酸二异丙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二正丁酯或脂族酸的（例如乙二醇）酯溶液。存在药物或化妆品工业已知的结晶抑制剂或分散剂可能也是有利的。

[2043] 还可配制浇淋制剂，以控制具有农学价值动物的寄生虫。本发明的浇淋制剂可为液体、粉末、乳液、泡沫、糊剂、气溶胶、油膏剂、软膏或凝胶形式。浇淋制剂通常为液体。这些浇淋制剂可有效地施用于绵羊、牛、山羊、其它反刍动物、骆驼科哺乳动物、猪和马。通常通过将浇淋制剂以一条或多条细线的形式，或准确浇淋在动物背部中线（背部）或肩部，来施用所述浇淋制剂。更典型通过将所述制剂沿着动物背部，顺着脊椎浇淋来施用。还可经由其它常规方法来施用所述制剂，包括用浸渍过的物质在动物的至少一小块面积上擦拭，或者使用可商购获得的施用装置来将其施用，通过注射器施用，通过喷雾施用或通过使用喷雾栅栏过道来施用。浇淋制剂包括载体，并且还可包含一种或多种附加成分。合适的附加成分的实例是稳定剂如抗氧化剂、铺展剂、防腐剂、粘附促进剂、活性增溶剂如油酸、粘度调节剂、紫外线阻隔剂或吸收剂、以及着色剂。表面活性剂也可包含于这些制剂中，包括阴离子、阳离子、非离子和两性表面活性剂。

[2044] 本发明的制剂通常包含抗氧化剂，如 BHT（丁基化羟基甲苯）。所述抗氧化剂一般以 0.1% 至 5%（重量 / 体积）的含量存在。某些制剂需要增溶剂，如油酸，以溶解活性剂，尤其是在使用多杀菌素时。用于这些浇淋制剂中的常见铺展剂是：IPM、IPP、饱和  $C_{12}$ - $C_{18}$  脂肪醇的辛酸 / 癸酸酯、油酸、油醇酯、油酸乙酯、甘油三酯、硅油和 DPM。可根据已知的技术来制备本发明的浇淋制剂。当浇淋剂为溶液时，如果需要，采用加热和搅拌将驱虫剂 / 杀昆虫剂与载体或媒介物混合。可将辅助或附加成分加入到活性剂和载体的混合物中，或者在加入载体前将它们与活性剂混合。如果浇淋剂为乳液或悬浮液，则可类似地采用已知技术来制备这些制剂。

[2045] 可使用用于较疏水的药物化合物的其它递送体系。脂质体和乳液是用于疏水性药物的熟知递送媒介物或载体的实例。此外，如果需要，可使用有机溶剂诸如二甲基亚砜。

[2046] 就农学施用而言，有效控制所需的施用量（即“生物学有效量”）将取决于如下列因素：待控制的无脊椎害虫种类，害虫的生命周期，生命阶段，其大小，位置，一年中的时期，宿主作物或动物，摄食行为，交配行为，环境水分，温度等。在正常情况下，约 0.01 至 2kg 活性成分每公顷的施用量足以防治农学生态系统内的害虫，但是低至 0.0001kg 每公顷的施用量可能也是足够的，或者高达 8kg 每公顷的施用量可能也是需要的。就非农学施用而言，有效用量将在约 1.0 至 50mg 每平方米范围内，但是低至 0.1mg 每平方米的施用量可能也是足够的，或者高达 150mg 每平方米的施用量可能也是需要的。本领域的技术人员易于确定为达到所期望的无脊椎害虫防治水平所需的生物学有效量。

[2047] 一般来讲，就兽用而言，以杀寄生虫有效量将式 1 的化合物、其 N-氧化物或其盐施用于动物，保护其免受无脊椎寄生害虫的侵害。杀寄生虫有效量是为达到观察得到的目标无脊椎寄生害虫出现率或活跃度降低的效果所需的活性分量。本领域的技术人员将会知道，杀寄生虫有效剂量可根据本发明的化合物和组合物、所期望的杀寄生虫效果和持续时间、目标无脊椎害虫物种、要保护的动物、施用模式等的不同而变化，并且达到具体效果所需的量可通过简单的实验来确定。

[2048] 就向恒温动物口腔给药而言，本发明的化合物的日剂量通常在 0.01mg/kg 动物体重至约 100mg/kg 动物体重，更典型地约 0.5mg/kg 动物体重至约 100mg/kg 动物体重范围

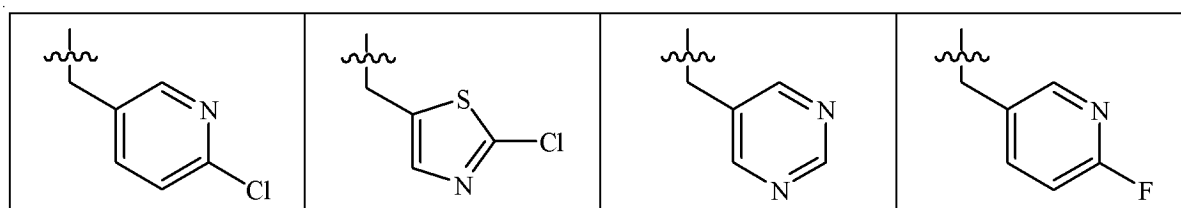
内。就局部（例如皮肤）给药而言，蘸料和喷雾通常包含约 0.5ppm 至约 5000ppm，更典型地约 1ppm 至约 3000ppm 的本发明的化合物。

[2049] 由本发明代表性的方法制得的本发明的化合物示于索引表 A-E 中。关于  $^1\text{H}$  NMR 数据参见索引表。就质谱数据 ( $\text{AP}^+(\text{M}+1)$ ) 而言，记录的数值是采用大气压化学电离 ( $\text{AP}^+$ )，由质谱观测到的  $\text{H}^+$  (分子量为 1) 加在所述分子上获得  $\text{M}+1$  峰所形成的母分子离子的分子量 ( $\text{M}$ )。没有报导包含多个卤素的化合物出现的间隔分子离子峰（例如  $\text{M}+2$  或  $\text{M}+4$ ）。索引表 C 中的变量“RA”代表如索引表 C 中列出的一个取代基或取代基的组合。

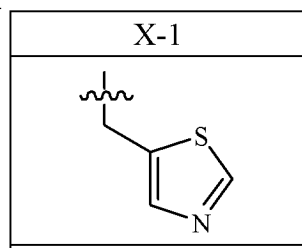
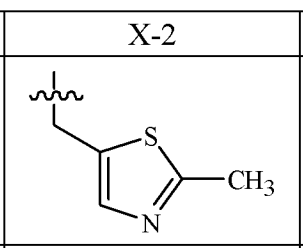
[2050] 以下索引表中使用如下缩写：表示化合物，Me 为甲基，Et 为乙基，i-Pr 为异丙基，n-Bu 为正丁基，t-Bu 为叔丁基，Ph 为苯基，CHO 为甲酰基，Ac 为乙酰基（即  $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ ）并且  $\text{SO}_2\text{Me}$  为甲基磺酰基。

[2051] 下文所示片段 X-1 至 X-6 涉及索引表。波形线代表片段与分子其余部分的连接点。

[2052]

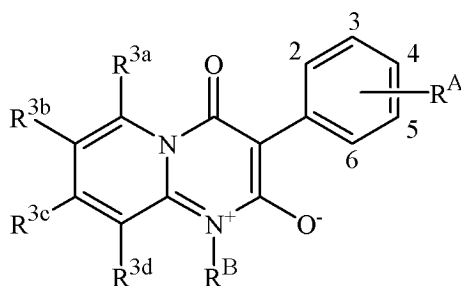


[2053]

X-1	X-2	X-3	X-4
			
X-5	X-6		

[2054] 索引表 A

[2055]



[2056]

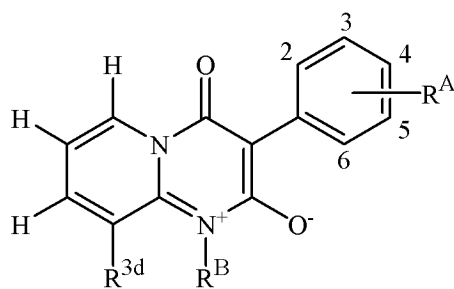
Cmpd	$R^A$	$R^B$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^{3c}$	$R^{3d}$	$\overline{AP+}$ (M+1)
1	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Br	532
2	H	Pr	H	CH <sub>3</sub>	H	H	295
3	H	Pr	H	H	CH <sub>3</sub>	H	295
4	H	Pr	CH <sub>3</sub>	H	H	H	295
5	H	Pr	H	氰基	H	H	306
6	H	Pr	Cl	H	H	H	315
8	H	Pr	H	H	H	Cl	315
9	H	X-1	F	H	H	H	382
10	4-F	X-1	F	H	H	H	400
11	3-OCF <sub>3</sub>	X-1	F	H	H	H	466
12	2-F, 4-F	X-1	F	H	H	H	418
13	3-OCF <sub>3</sub>	X-1	H	F	H	F	*
14	2-F, 4-F	X-1	H	F	H	F	*
15	4-F	X-1	H	F	H	F	*
16	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	OH	*
17	4-F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	OH	355
18	3-CF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Br	516
19	3-Br	X-2	H	H	H	Br	558
20	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Br	550
21	2-F, 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Br	600
22	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	氰基	479
23	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Cl	488
24	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	OCH <sub>3</sub>	H	484
25	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	484

[2057]

Cmpd	$R^A$	$R^B$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^{3c}$	$R^{3d}$	$\overline{AP+}$ (M+1)
26	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	CH <sub>3</sub>	468
27	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	Br	H	532
28	3-CF <sub>3</sub>	X-2	H	H	Br	H	516
29	3-CF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	CH <sub>3</sub>	452
30	2-F	X-2	H	H	H	CH <sub>3</sub>	402
31	2-F	X-2	H	H	Br	H	466
32	2-F	X-2	H	H	OCH <sub>3</sub>	H	418
33	3-Cl, 5-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	H	H	Br	566
34	H	X-2	H	H	CH <sub>3</sub>	H	384
35	H	X-2	H	H	Cl	H	404
54	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>	H	H	H	468
55	2-F	X-2	CH <sub>3</sub>	H	H	H	402
61	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	H	Br	H	CH <sub>3</sub>	546
63	2-F, 3-CF <sub>3</sub>	X-2	H	Br	H	CH <sub>3</sub>	470
430	2-F	X-2	H	I	H	H	514

[2058] \* 关于 <sup>1</sup>HNMR 数据参见索引表。[2059] 索引表 B

[2060]



[2061]

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R<sup>B</sup></u>	<u>R<sup>3d</sup></u>	<u>m.p.</u> <u>(°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
36	3-Cl, 5-OCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>	502	
37	2-F, 6-F	X-2	CH <sub>3</sub>	420	
38	2-F	X-1	CH <sub>3</sub>	396	
39	3-OCF <sub>3</sub>	X-1	CH <sub>3</sub>	462	
40	3-SCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>	484	
41	2-F	X-2	OCH <sub>3</sub>	418	
42	H	X-3	CH <sub>3</sub>	*	
43	3-OCF <sub>3</sub>	X-3	CH <sub>3</sub>	*	
44	2-F	X-3	CH <sub>3</sub>	*	
45	3-CF <sub>3</sub>	X-3	CH <sub>3</sub>	*	
46	2-F, 6-F	X-3	CH <sub>3</sub>	*	
47	H	X-2	CH <sub>3</sub>	383	
48	2-OCH <sub>3</sub> , 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>	443	

[2062]

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R<sup>B</sup></u>	<u>R<sup>3d</sup></u>	<u>m.p.</u> <u>( ° C )</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
49	2-F, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		470
50	4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		402
51	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	OCH <sub>3</sub>		484
52	2-F, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	OCH <sub>3</sub>		486
53	2-OCH <sub>3</sub> , 5-OCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		498
56	2-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		414
57	2-F, 3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		504
58	4-SCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		484
59	2-F, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		420
60	2-F, 3-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		436
62	3-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		414
64	3-SCF <sub>3</sub>	X-4	CH <sub>3</sub>		462
65	3-I	X-2	CH <sub>3</sub>		510
66	2-F, 3-CF <sub>3</sub>	X-2	OCH <sub>3</sub>		486
67	3-I	X-2	CH <sub>3</sub>		476
68	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	pH		530
69	3-OCH <sub>3</sub>	X-2	pH		476
70	3-OCF <sub>3</sub>	X-5	CH <sub>3</sub>		434
71	3-OCF <sub>3</sub>	X-6	CH <sub>3</sub>		448
72	3-OCF <sub>3</sub>	X-4	CH <sub>3</sub>		446
73	3-CF <sub>3</sub>	X-5	CH <sub>3</sub>		418
74	3-CF <sub>3</sub>	X-6	CH <sub>3</sub>		432
75	3-CF <sub>3</sub>	X-4	CH <sub>3</sub>		430
76	2-F	X-5	CH <sub>3</sub>		368
77	2-F	X-6	CH <sub>3</sub>		382
78	2-F	X-4	CH <sub>3</sub>		380
79	3-Br, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		530
80	3-Br, 5-OCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		546
81	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		486
82	3-F, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		470
83	3-I, 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		540
84	3-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		462
101	3-(C≡CH)	X-2	CH <sub>3</sub>		408
102	3-(CH=CH <sub>2</sub> )	X-2	CH <sub>3</sub>		410
103	2-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		486
104	2-F, 3-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		432
105	4-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		418
106	3,4-(-OCH <sub>2</sub> O-)	X-2	CH <sub>3</sub>		428
107	3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		403
108	2-OCH <sub>3</sub> , 3-F, 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		450
109	2-OCH <sub>3</sub> , 3-OCH <sub>3</sub> ,	X-2	CH <sub>3</sub>		444
110	3-F, 4-F, 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		438
111	2-F, 4-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		432
112	3-OCH <sub>3</sub> , 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		432

[2063]



<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R<sup>B</sup></u>	<u>R<sup>3d</sup></u>	<u>m.p.</u> <u>(°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
113	3-Cl, 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		452
114	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		444
115	4-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		414
116	2-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		444
117	3-F, 4-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		432
118	3-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		418
119	3-F, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		420
120	3-CF <sub>3</sub> , 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		470
121	2-OCH <sub>3</sub> , 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		482
122	3-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		398
123	3-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		412
124	2-OCH <sub>3</sub> , 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		432
125	2-F, 3-F	X-2	CH <sub>3</sub>		420
126	2-OCH <sub>3</sub> , 5-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		492
127	2-F, 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		436
128	3-OCF <sub>3</sub> , 4-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		502
129	2-OCH <sub>3</sub> , 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		448
130	2-Cl, 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		452
131	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	OCH <sub>3</sub>		502
132	3-OCH <sub>3</sub> , 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		444
133	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-6	CH <sub>3</sub>		466
134	2-Cl, 3-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		452
135	3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		428
136	3-OCF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		482
152	2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		428
153	H	X-2	CH=CH <sub>2</sub>		396
154	3-CF <sub>3</sub>	X-2	CH=CH <sub>2</sub>		464
155	2-F	X-2	CH=CH <sub>2</sub>		414
156	3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (1-甲基-4-咪唑基)	CH <sub>3</sub>		415
157	2-F, 5-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		480
158	3-F, 4-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		436
159	3-F	X-2	CH <sub>3</sub>		402
160	3,5-二 F	X-2	CH <sub>3</sub>		420
161	2-F, 4-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		436
162	3,4-二 Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		452
163	3-Br, 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		480
164	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		432
165	2,5-二 F	X-2	CH <sub>3</sub>		420
166	2-Cl, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		436
167	3-CH <sub>3</sub> , 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		466
168	3-CH <sub>3</sub> , 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		462
169	2-CH <sub>3</sub> , 4-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		476

[2064]

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R<sup>B</sup></u>	<u>R<sup>3d</sup></u>	<u>m.p.</u> <u>(°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
170	3-Br, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		480
173	3-OCF <sub>3</sub> , 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		486
179	2-F	X-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		416
180	3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , 5-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		440
181	2-CH <sub>3</sub> , 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		432
182	2-OCH <sub>3</sub> , 5-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		428
183	2-F, 5-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		416
185	H	X-2	Cl		404
186	2-F	X-2	Cl		421
187	3-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		440
188	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		500
192	3-(4-氟苯基)	X-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		508
196	2-F, 3-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		416
197	2-OCH <sub>3</sub> , 3-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		428
198	3-Br	X-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		476
202	3-(4-氟苯基)	X-2	OCH <sub>3</sub>		510
203	3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		426
204	2-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		398
205	4-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		398
206	2-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		*
212	2-F	X-2	I		514
213	2-F	X-2	CH <sub>2</sub> F		420
216	H	X-2	CH <sub>2</sub> F		402
217	3-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>2</sub> F		470
218	H	X-2	I		*
223	4-F	X-2	OCH <sub>3</sub>		418
224	2-硝基	X-2	CH <sub>3</sub>		*
225	2-硝基, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		*
226	H	X-2	CH <sub>2</sub> OC(O) CH <sub>3</sub>		*
227	3-CH <sub>3</sub> , 5-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		411
228	3-Cl, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		436
234	3-氟基, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		428
235	3-Br, 5-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		476
236	4-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		409
237	4-硝基	X-2	CH <sub>3</sub>		*
240	3-氟基, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		477
241	3-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		426
243	3-Si(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		498
244	3-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		456
249	3-OSi(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		556
257	3-Br, 5-Cl	X-2	CH <sub>3</sub>		496
265	3-CH <sub>3</sub> , 5-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		470

[2065]

Cmpd	R <sup>A</sup>	R <sup>B</sup>	R <sup>3d</sup>	<u>m.p.</u> (°C)	<u>AP+</u> (M+1)
266	3-OCH <sub>3</sub> , 5-C(O)OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		472
268	3-氟基, 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		539
296	3-Br, 5-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		487
297	3-F, 5-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		427
298	3-Cl, 5-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		443
304	3-氟基, 5-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		423
310	2-I	X-2	CH <sub>3</sub>		510
311	3-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		409
312	2-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		409
324	2-F, 5-氟基	X-2	CH <sub>3</sub>		427
335	3,5-二 Cl, 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		*
339	3-C(O)OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		442
342	2-Cl, 5-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		496
348	H	2-甲基-1-咪唑基	CH <sub>3</sub>		*
349	H	4-甲基-1-咪唑基	CH <sub>3</sub>		*
350	H	2,4-二甲基-1-咪唑基	CH <sub>3</sub>		361
351	3-Cl, 5-C(O)OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		476
353	3-Br, 4-CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		475
354	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	X-2	OCH <sub>3</sub>		578
355	3-(2-氟-4-(三氟甲基)苯基)	X-2	OCH <sub>3</sub>		562
370	H	1-咪唑基			333
373	3-C(O)CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		426
380	3-CF <sub>3</sub> , 5-C(O)OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		510
382	3-环丙基	X-2	CH <sub>3</sub>		424
389	3,5-二 Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		393
390	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	107-109	
392	2-F	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>		109-110	
395	3-Cl, 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		436
396	4-C(O)OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		442
397	4-C(O)CH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		426
403	3-F, 5-CF <sub>3</sub>	X-2	OCH <sub>3</sub>		486
404	3-Cl, 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		448
405	3-CH <sub>3</sub> , 4-F	X-2	CH <sub>3</sub>		416
406	H	3-甲基-5-异噁唑基	CH <sub>3</sub>	109-111	
413	4-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		562
414	4-I	X-2	CH <sub>3</sub>		510
415	4-(2-氯-4-氟苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		512
416	4-(3-氯-5-(三氟甲基)苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		562
417	2-F	CH <sub>2</sub> (3-四氢吡喃基)	CH <sub>3</sub>		354
420	4-(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		564
423	2-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		562
424	3-F, 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		432

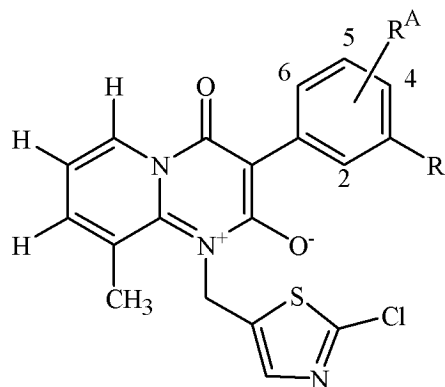
[2066]

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R<sup>B</sup></u>	<u>R<sup>3d</sup></u>	<u>m.p.</u> <u>(°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
425	3-Cl, 5-I	X-2	CH <sub>3</sub>		544
426	3-OCH <sub>3</sub> , 5-CF <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		482
428	2-(2-氯-4-氟苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		512
436	H	CH <sub>2</sub> (3-四氢呋喃基)	CH <sub>3</sub>	208-211	
439	3-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub> )	X-2	CH <sub>3</sub>		455
442	3-Cl, 5-F	X-2	OCH <sub>3</sub>		452
445	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	144-146	
446	3,5-二 Cl	CH <sub>2</sub> (3-四氢呋喃基)	CH <sub>3</sub>	>300	
452	2-OCH <sub>3</sub> , 5-CN	X-2	CH <sub>3</sub>		439
453	3-(C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )	X-2	CH <sub>3</sub>		469
458	3-噻吩基	X-2	CH <sub>3</sub>		466
459	3-OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (3-四氢呋喃基)	CH <sub>3</sub>		420
460	3-OCF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		408
463	3-(2,4-二甲基苯基)	X-2	CH <sub>3</sub>		504
469	2-F	CH <sub>2</sub> (3-甲基-5-异噁唑基)	CH <sub>3</sub>	162-164	
470	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	CH <sub>2</sub> (3-甲基-5-异噁唑基)	CH <sub>3</sub>	181-182	
471	3,5-二 Cl	CH <sub>2</sub> (3-甲基-5-异噁唑基)	CH <sub>3</sub>	184-186	
472	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	138-140	
473	2-F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	188-190	
475	H	CH <sub>2</sub> (5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>	174-176	
476	3,5-二 Cl	CH <sub>2</sub> (5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>	200-201	
477	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	CH <sub>2</sub> (5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>	107-109	
478	H	CH <sub>2</sub> (2-甲基-5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>	164-166	
479	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)	CH <sub>2</sub> (2-甲基-5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>	199-200	
480	3-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基), 4-F	X-2	OCH <sub>3</sub>		596
481	3-Cl, 5-(4-氯-2-氟苯基)	X-2	OCH <sub>3</sub>		562
486	3-Cl, 4-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		498
487	3-CF <sub>3</sub> , 4-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		531
488	2-F, 3-Cl, 4-Br	X-2	CH <sub>3</sub>		*
494	H	CH <sub>2</sub> (2-氯-4-(三氟甲基)-5-噻唑基)	CH <sub>3</sub>		452
495	3-CH <sub>3</sub> , 5-OCH <sub>3</sub>	X-2	CH <sub>3</sub>		429
496	3-F, 5-I	X-2	CH <sub>3</sub>		528
497	3-CH <sub>3</sub> , 5-I	X-2	CH <sub>3</sub>		524
498	3-CH <sub>3</sub> , 5-F	X-2	CH <sub>3</sub>		416

[2067] \* 关于 <sup>1</sup>HNMR 数据参见索引表。

[2068] 索引表 C

[2069]



Cmpd	R <sup>A</sup>	R	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
85	H	3-(三氟甲氧基)苯基		544
86	H	2,5-二氟苯基		496
87	5-OCF <sub>3</sub>	6-氯-3-吡啶基		579
88	H	2,3-二氯苯基		528
89	H	2,4-二氯苯基		528
90	H	5-氟基-2-乙氧苯基		515
137	H	4-(三氟甲基)苯基		528
138	H	5-氯-2-氟苯基		512
139	H	2,5-二氯苯基		528
140	H	4-氯苯基		494
150	H	3-氯-4-(三氟甲基)苯基		562
151	H	2-氯-5-氟苯基		512
[2070] 174	5-OCH <sub>3</sub>	4-氯苯基		524
175	H	-O-(4-氟苯基)		494
176	H	-O-(2-氟苯基)		494
177	H	-O-(3-氟苯基)		494
178	5-F	4-氯苯基		512
184	H	-O-(苯基)		476
189	H	2-氯-4-氟苯基		510
190	H	4-氯-2-氟苯基		512
191	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		562
193	H	4-溴苯基		538
194	H	4-甲基苯基		474
195	H	4-氟苯基		478
199	H	2-甲基-4-氯苯基		508
200	H	3-氯苯基		494
201	H	3-氯-4-氟苯基		512
207	H	4-氯-3-氟苯基		512

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+ (M+1)</u>
208	4-F	4-氯苯基		512
209	4-F	4-氯-2-氟苯基		530
210	6-OCH <sub>3</sub>	4-氯苯基		523
211	6-OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基		542
214	6-F	4-氯-2-氟苯基		530
215	6-F	4-氯苯基		512
219	H	-O-(2,5-二氯苯基)		544
220	H	-O-(4-氯苯基)		510
221	H	-O-(4-甲氧苯基)		506
222	H	-O-(4-氰基苯基)		501
229	H	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		546
230	H	4-溴-2-氟苯基		558
231	H	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基		562
232	H	4-氯-2-甲氧苯基		524
233	H	5-氰基-2-氟苯基		504
238	4-OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基		542
239	4-OCH <sub>3</sub>	4-氯苯基		524
246	5-CH <sub>3</sub>	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		543
247	H	3-氰基-4-氟苯基		503
[2071] 248	H	2,4-二氟苯基		496
250	6-OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-氟苯基		542
251	4-F	2-氯-4-氟苯基		530
252	H	-O-(4-溴苯基)		554
253	H	-O-(2-氯-4-氟苯基)		528
255	H	2-甲基苯基		474
256	5-Cl	4-氯苯基		528
258	H	-C(O)(4-氯苯基)		523
259	H	-CH <sub>2</sub> (4-氯苯基)		509
262	5-Cl	2,4-二氯苯基		562
263	5-F	4-(三氟甲基)苯基		546
264	5-Cl	4-(三氟甲基)苯基		562
269	H	苯基		460
270	6-F	4-氟苯基		496
271	H	3,5-二氟苯基		496
272	H	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		542
273	5-Cl	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		563
276	5-CF <sub>3</sub>	4-氯-2-甲基苯基		576
277	H	3-氯-5-(三氟甲基)苯基		564
278	4-CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		576
279	5-CF <sub>3</sub>	6-氯-3-吡啶基		563
285	H	4-氯-2-(三氟甲基)苯基		567

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
286	5-CF <sub>3</sub>	4-氯苯基		567
287	H	-S-(4-(三氟甲基)苯基)		561
289	4-F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		580
290	4-F	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		547
291	4-F	2,4-二氯苯基		546
299	6-F	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		547
300	6-F	4-(三氟甲基)苯基		546
301	6-Cl	4-(三氟甲基)苯基		562
302	6-Cl	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		563
305	4-Cl	4-(三氟甲基)苯基		562
306	4-Cl	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		563
307	H	2,6-二氯-3-吡啶基		529
308	5-Cl	2,6-二氯-3-吡啶基		563
315	H	4,6-二氯苯基-3-吡啶基		531
316	4-CH <sub>3</sub>	4-(三氟甲基)苯基		542
317	4-CH <sub>3</sub>	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		543
318	6-CH <sub>3</sub>	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		543
319	6-CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		576
320	6-CH <sub>3</sub>	4-(三氟甲基)苯基		542
[2072] 321	4-OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		592
322	6-OCH <sub>3</sub>	4-(三氟甲基)苯基		558
323	6-OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		592
325	H	4-氰基苯基		485
326	H	4-氯-2-氟基苯基		519
327	H	4-甲氧羰基-2-氯苯基		535
328	6-Cl	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		576
329	4-OCH <sub>3</sub>	4-(三氟甲基)苯基		558
330	4-F	3-氯-5-(三氟甲基)苯基		580
336	4-OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		576
337	H	3-溴-5-氟苯基		556
338	4-CN	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		587
343	6-F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		580
344	4-Cl	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		596
345	4-OCH <sub>3</sub>	6-(三氟甲基)-3-吡啶基		559
346	4-CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基		526
347	H	3-氯-5-氟苯基		512
352	5-CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		576
362	H	4-(甲硫基)苯基		506
363	4-F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		564
364	4-F	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		560
365	4-F	4-氯-2-甲基苯基		526

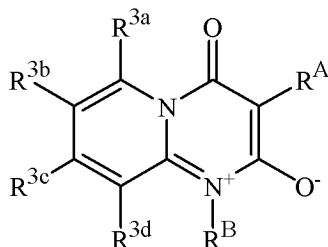
<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+ (M+1)</u>
366	H	2,4-二甲基苯基		488
367	H	2-氯-5-(三氟甲基)苯基		562
368	4-F	4-氯-2-(三氟甲基)苯基		580
369	4-Cl	4-氯-2-氟苯基		546
374	4-F	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基		580
375	H	2,4-双(三氟甲基)苯基		596
376	4-OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-(三氟甲基)苯基		592
377	4-OCH <sub>3</sub>	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		572
378	4-OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-甲基苯基		538
381	5-CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基		526
384	H	6-氯-2-氟-3-吡啶基		513
385	4-CH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		560
386	4-OCH <sub>3</sub>	4-氯-3-氟苯基		542
387	4-F	4-氯-3-氟苯基		530
388	4-F	3-氯-4-(三氟甲基)苯基		580
398	4-OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基		592
399	4-F	2,6-二氯-3-吡啶基		547
400	H	3-氯-4-(三氟甲基)苯基		562
401	5-Cl	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		596
[2073] 402	5-Cl	4-氯-2-氟苯基		546
407	5-Cl	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		576
408	5-Cl	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基		596
409	4-CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基		576
410	5-Cl	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		580
411	4-CH <sub>3</sub>	4-氯-2-(三氟甲基)苯基		576
412	5-CF <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		630
421	6-F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		564
422	6-OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		576
427	4-F	2-氯-5-(三氟甲基)苯基		580
429	4-CH <sub>3</sub>	2-氯-5-(三氟甲基)苯基		576
431	4-OCH <sub>3</sub>	2-氯-5-(三氟甲基)苯基		592
432	6-F	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		560
433	5-F	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		580
434	5-F	2-氯-5-(三氟甲基)苯基		580
435	5-F	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		560
437	H	4-氯-3-氰基苯基		519
438	H	4-氰基-2-氟苯基		503
440	4-CH <sub>3</sub>	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		556
441	5-F	4-氯-2-氟苯基		530
443	4-F	2,4-双(三氟甲基)苯基		614
448	4-OCH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		576



	<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>R</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
	449	H	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		546
	450	4-F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		564
	451	5-OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		592
	457	H	4-氟-2-(三氟甲基)苯基		546
	462	5-CN	2-氯-4-(三氟甲基)苯基		587
	464	H	2-乙氧基-6-(三氟甲基)-3-吡啶基		572
	467	H	2-氯-6-(三氟甲基)-3-吡啶基		563
	468	5-Cl	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		566
	474	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	154-155	
[2074]	482	4-Cl	2-甲基-4-(三氟甲基)苯基		576
	483	4-CH <sub>3</sub>	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		560
	484	4-CH <sub>3</sub>	2,4-双(三氟甲基)苯基		610
	485	5-F	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		564
	489	4-OCH <sub>3</sub>	2,4-双(三氟甲基)苯基		676
	490	5-OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-(三氟甲基)苯基		576
	491	5-OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基		542
	493	5-CN	4-氯-2-氟苯基		537
	499	5-Cl	4,6-二氯-3-吡啶基		563
	500	5-F	2-氟-5-(三氟甲基)苯基		564
	501	4-F	4-氟-2-(三氟甲基)苯基		564

[2075] 索引表 D

[2076]

[2077] R<sup>B</sup> 为 X-2 ; R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup> 和 R<sup>3c</sup> 为 H ; R<sup>3d</sup> 为 CH<sub>3</sub>

	<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
	242	SCF <sub>3</sub>		*
[2078]	245	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		364
	254	2-(4-(三氟甲基)苯基)-4-吡啶基		529
	260	2-(4-氯苯氧基)-4-嘧啶基		*
	261	2-溴-4-吡啶基		463

<u>Cmpd</u>	<u>R<sup>A</sup></u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
267	2-(4-(三氟甲基)苯基)-4-嘧啶基		530
274	2-氯-6-(三氟甲基)-4-吡啶基		486
275	CH <sub>3</sub>		*
280	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		*
281	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>		*
282	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		*
283	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		378
284	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>		364
288	2,6-二氯-4-吡啶基		455
292	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		*
293	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		*
294	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		*
295	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>		*
303	CH <sub>2</sub> CH=CHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>		424
309	1-萘基	162-165	
313	8-甲基-1-萘基	252-253	
314	2-萘基	211-214	
331	5-溴-3-吡啶基		*
341	CH=CHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		362
[2079] 358	CH <sub>2</sub> C≡CH		*
359	6-氯-3-吡啶基		*
360	2-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)-4-吡啶基		563
361	CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>		*
371	H		308
379	6-甲基-3-吡啶基		399
383	顺式-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>		*
393	5-甲基-3-吡啶基		399
394	5-乙基-3-吡啶基		413
418	6-氟-3-吡啶基		403
419	2-氯-3-吡啶基		419
444	3-氰基-2-吡啶基		410
447	6-(4-(三氟甲基)苯基)-3-吡啶基		529
454	2-噻吩基		390
455	3-噻吩基		390
456	1-(2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基)-4-吡啶基		586
461	2-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)-3-吡啶基		563
465	4-溴-2-噻吩基		468
492	4-(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)-2-噻吩基		568

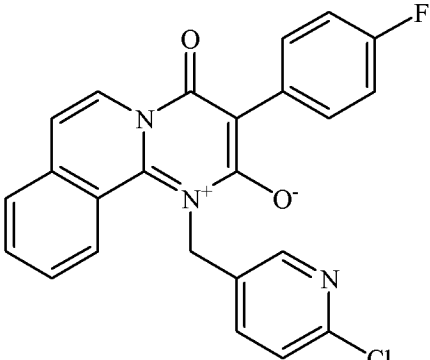
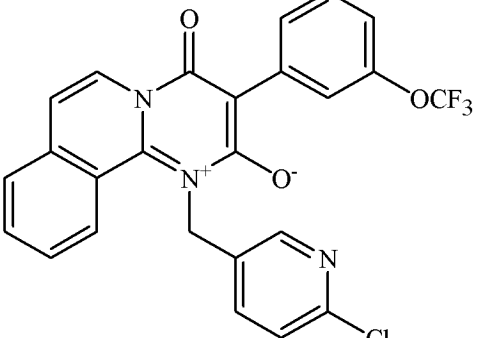
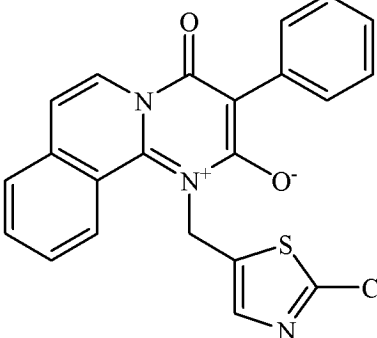
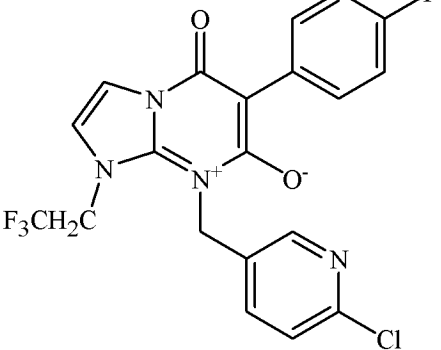
\* 关于 <sup>1</sup>H NMR 数据参见索引表。

[2080] 索引表 E

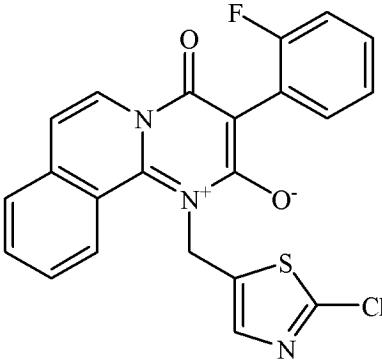
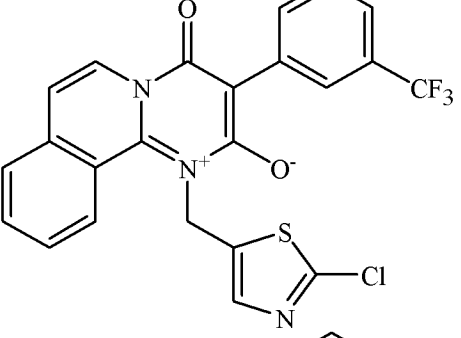
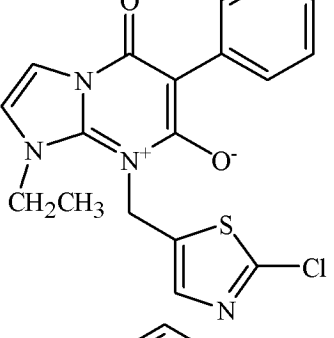
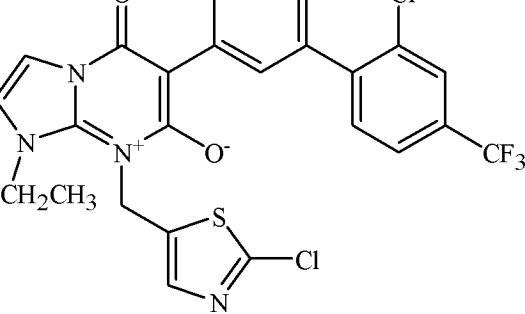
[2081]

Cmpd	结构	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
91			337
92			321
93			331
94			365
95			402
96			*

[2082]

<u>Cmpd</u>	<u>结构</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
97			432
98			*
99			420
100			452

[2083]

<u>Cmpd</u>	<u>结构</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
171			438
172			487
333			387
334			565

[2084]

<u>Cmpd</u>	<u>结构</u>	<u>m.p. (°C)</u>	<u>AP+</u> <u>(M+1)</u>
340			455
356		224-226	
357		235-236	
391			510

[2085] \* 关于  $^1\text{H NMR}$  数据参见索引表。

[2086] 索引表 F

[2087]

Cmpd No.  $^1\text{H NMR}$  数据 <sup>a, b</sup>

[2088]

- 13  $\delta$  9.47 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.80-7.85 (m, 2H), 7.74 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.75 (br s, 2H)。
- 14  $\delta$  9.43 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.76-7.85 (m, 2H), 7.74 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.75 (br s, 2H)。
- 15  $\delta$  9.47 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.73-7.83 (m, 3H), 7.64 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.11 (t, 2H), 5.75 (br s, 2H)。
- 16  $\delta$  (CD<sub>3</sub>OD) 9.85 (D, 1H), 7.56 (d, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.32-7.38 (m, 3H), 7.22 (t, 1H), 6.2 (br s, 2H)。
- 42  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.46 (d, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.81 (s, 2H), 8.23 (d, 1H), 7.86 (d, 2H), 7.53 (t, 1H), 7.26 (t, 2H), 7.11 (t, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.68 (s, 3H)。
- 43  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.47 (d, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.83 (s, 2H), 8.27 (d, 1H), 8.02-8.04 (m, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.06 (d, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.69 (s, 3H)。
- 44  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.41 (d, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.79 (s, 2H), 8.24 (d, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.04-7.12 (m, 2H), 5.65 (s, 2H), 2.68 (s, 3H)。
- 45  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.46 (d, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.83 (s, 2H), 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.43-7.51 (m, 2H), 5.67 (s, 2H), 2.69 (s, 3H)。
- 46  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.39 (d, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.79 (s, 2H), 8.28 (d, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.34 (t, 1H), 6.96 (t, 2H), 5.67 (s, 2H), 2.72 (s, 3H)。
- 96  $\delta$  9.42 (d, 1H), 8.3 (d, 1H), 7.73-7.9 (m, 4H), 7.68 (t, 1H), 7.39-7.48 (m, 3H), 7.26 (m, 1H)。
- 98  $\delta$  9.31 (d, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.97 (dd, 2H), 7.80-7.85 (m, 2H), 7.72 (dd, 1H), 7.61 (2s, 2H), 7.38 (dd, 2H), 7.07 (d, 1H), 5.72 (br s, 2H)。
- 206  $\delta$  (DMSO-d<sub>6</sub>) 9.27 (d, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.31-7.36 (m, 2H), 5.46 (s, 2H) 2.73 (s, 3H)。
- 218  $\delta$  9.59 (d, 1H), 9.04 (d, 1H), 7.84 (d, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.30 (dd, 2H), 7.15 (dd, 1H), 6.07 (s, 2H)。
- 224  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 8.96 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.69-8.00 (m, 4H), 7.26 (t, 1H), 6.91 (t, 1H), 5.61 (s, 2H), 2.55 (s, 3H)。
- 225  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.41 (d, 1H), 8.39 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.65 (t, 1H), 5.65 (s, 2H) 2.93 (s, 3H)。
- 226  $\delta$  9.65 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 7.77 (d, 2H), 7.58 (s, 1H), 7.40 (dd, 3H), 7.25 (dd, 1H), 5.62 (s, 2H), 5.39 (s, 2H), 2.24 (s, 3H)。
- 237  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.44 (d, 1H), 8.34-8.37 (m, 2H), 8.14-8.21 (m, 3H), 7.74 (s, 1H), 7.62 (t, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.91 (s, 3H)。
- 242  $\delta$  (丙酮-d<sub>6</sub>) 9.31 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.61 t, 1H), 5.58 (s, 2H), 2.81 (s, 3H)。

- 260  $\delta$  (DMSO- $d_6$ ) 9.24 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.40 (t, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.57 (t, 2H), 7.46 (d, 2H), 7.37 (d, 2H), 5.59 (s, 2H)。
- 275  $\delta$  9.48 (d,1H), 7.94 (d, 1H), 7.42 (s,1H), 7.33 (dd,1H), 5.60 (s, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.14 (s, 3H)。
- 280  $\delta$  9.45 (d, 1H), 7.90 (d,1H), 7.41 (s, 1H), 7.30 (dd,1H), 5.56 (s, 2H), 3.42 (m, 1H), 2.78 (s, 3H), 1.34 (d, 6H)。
- 281  $\delta$  9.45 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.24 (dd, 1H), 7.22 (dd, 2H), 7.14 (dd, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.96 (s, 2H), 2.76 (s, 3H)。
- 282  $\delta$  9.48 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.29 (dd, 1H), 5.59 (s, 2H), 2.8 (s, 3H), 2.67 (q, 2H), 1.18 (t, 3H)。
- 292  $\delta$  9.46 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.31 (dd, 1H), 5.60 (s,2H), 2.80 (s, 3H),2.50 (d,2H), 2.04 (m,1H) 0.96 (d, 6H)。
- 293  $\delta$  9.48 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.34 (dd, 1H), 5.58 (s, 2H), 2.80 (s, 2H), 2.64 (d, 2H), 1.60 (m, 2H), 1.39 (m, 2H), 0.90 (t, 3H)。
- 294  $\delta$  9.48 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.42 (s, 1H) 7.31 (dd, 1H), 5.58 (s, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.62 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 1.00 (t, 3H)。
- 295  $\delta$  9.48(d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.32 (dd, 1H), 6.02 (m,1H), 5.60 (s, 2H), 5.21 (d 1H), 5.03 (d, 1H), 3.40 (d, 2H), 2.80 (s, 3H)。
- [2089]
- 331  $\delta$  (丙酮- $d_6$ ) 9.47 (d, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.38 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.60 (t, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.91 (s, 3H)。
- 335  $\delta$  (丙酮- $d_6$ ) 9.46 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.23 (s, 2H), 5.56 (s, 2H) 2.73 (s, 3H)。
- 348  $\delta$  (DMSO- $d_6$ ) 9.33 (d, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.63 (d, 2H), 7.54 (s, 1H), 7.28 (t, 2H), 7.14 (t, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.24 (s, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.26 (s, 3H)。
- 349  $\delta$  (DMSO- $d_6$ ) 9.32 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.71-7.65 (m, 2H), 7.60 (t, 2H), 7.30 (t, 2H), 7.16 (t, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.28 (s, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)。
- 358  $\delta$  9.48 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.36 (dd, 1H), 5.60 (s, 2H), 3.57 (s, 2H), 2.80 (s, 3H), 1.97 (s, 1H)。
- 359  $\delta$  (DMSO- $d_6$ ) 9.37 (d, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.32-8.27 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 7.59 (t, 1H), 7.49 (d, 1H), 5.44 (s, 2H), 2.70 (s, 3H)。
- 361  $\delta$  9.47 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.35 (dd, 1H), 5.59 (s, 2H), 3.50 (q, 2H), 2.80 (s, 3H), 1.77 (t, 3H)。
- 383  $\delta$  9.46 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.31 (dd, 1H), 5.60 (m, 4H), 3.40 (d, 2H), 2.80 (s, 3H), 1.83 (d, 3H)。
- 488  $\delta$  (甲醇- $d_4$ ) 9.37 (d, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.57- 7.56 (m, 2H), 7.54- 7.50 (m, 1H), 5.60 (s, 2H), 2.81 (s, 3H)。

[2090]  $a^1H$  NMR 数据以距四甲基硅烷的低场 ppm 数为单位。除非另外指明,为  $CDCl_3$  溶液;“丙酮- $d_6$ ”为  $CD_3C(=O)CD_3$ 。偶合由 (s)-单峰, (d)-双峰, (t)-三重峰, (m)-多重峰,



(dd)- 双重双重峰, (br s)- 宽的单峰来标明。

[2091] b 其中 R<sup>2</sup> 为 CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 的化合物的 <sup>1</sup>H NMR 光谱通常不显示出与 CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 质子相对应的峰。

[2092] 下列测试展示本发明的化合物对特定害虫的防治效果。“防治效果”表示对无脊椎害虫发育（包括死亡率）的抑制，所述抑制造成摄食显著减少。然而，由所述化合物提供的害虫控制保护不限于这些物种。化合物编号与索引表 A-E 中的化合物相关。

[2093] 本发明的生物学实施例

[2094] 测试 A

[2095] 为评价对小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 的控制，试验单元由内有 12-14 天龄萝卜植物的小开口容器构成。使用带有螺旋输送器的接种器，用经由玉米棒屑分布在试验单元中的约 50 条新生幼虫将其预先侵害。在分布到试验单元中后，所述幼虫在试验植物上移动。

[2096] 使用包含 10% 丙酮, 90% 水和 300ppm X-77<sup>®</sup> Spreader Lo-FoamFormula 非离子表面活性剂的溶液来配制受试化合物，所述非离子表面活性剂包含烷基芳基聚环氧乙烷、游离脂肪酸、乙二醇和异丙醇 (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA)。配制的化合物通过具有 1/8JJ 定制主体的 SUJ2 喷雾器喷嘴 (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) 在每个试验单元顶部上方定位 1.27cm (0.5 英寸) 处被施用在 1mL 的液体中。将受试化合物以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾，并且将试验重复三次。在将配制好的受试化合物喷雾后，使每个试验单元干燥 1h，然后将黑色网盖放置在顶部。使试验单元在 25°C 和 70% 相对湿度的生长室中保持 6 天。然后基于所摄食的叶子视觉评定植物摄食损害。

[2097] 在所测的 50ppm 式 1 的化合物中，下列这些提供了极好至优异的防治效果 (40% 或更小的摄食损害，和 / 或 100% 的死亡率) : 1、18、19、20、21、23、26、28、29、30、33、36、37、39、40、41、43、47、48、49、50、51、52、53、54、56、57、58、59、60、62、63、65、66、67、70、71、72、73、74、75、77、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、99、101、102、103、104、105、106、107、108、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、186、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、214、215、217、218、219、220、221、222、223、225、227、228、229、230、231、232、235、236、237、238、239、240、241、242、244、245、246、248、250、251、252、253、254、255、256、257、258、259、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、279、280、281、282、283、285、286、287、288、289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、299、300、301、302、304、305、306、307、308、309、310、311、312、314、315、316、317、318、319 和 334。

[2098] 在所测的 10ppm 式 1 的化合物中，下列这些提供了极好至优异的防治效果 (40% 或更小的摄食损害，和 / 或 100% 的死亡率) : 1、18、20、21、23、26、29、30、33、36、37、39、40、41、47、48、49、50、51、52、53、54、56、57、58、59、60、62、63、65、66、70、71、72、73、74、79、80、81、82、83、84、85、86、89、90、99、101、102、103、104、105、106、110、111、112、113、114、115、117、

118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、150、151、152、154、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、173、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、189、190、191、193、194、195、196、198、199、200、201、203、205、206、207、208、209、210、211、212、214、215、216、217、218、219、220、221、223、225、227、228、229、230、231、235、236、237、238、239、240、241、242、244、245、246、248、250、251、252、253、254、255、256、257、259、261、262、263、265、266、267、269、270、271、272、273、274、276、277、278、280、281、285、286、287、288、289、290、291、292、294、295、296、297、298、299、300、301、302、304、305、306、307、308、309、310、311、312、314、315、316、317、318、319、321、322、323、324、325、326、327、328、329、330、331、332、334、335、336、337、338、339、340、341、342、343、344、345、346、347、351、352、353、354、355、356、357、359、360、363、364、365、366、367、368、369、373、374、375、376、377、378、379、380、381、382、383、384、385、386、387、388、395、397、398、399、400、401、402、403、404、405、407、408、409、411、412、414、415、416、419、421、422、423、424、425、426、427、429、431、432、433、434、435、437、438、439、440、441、442、443、445、448、449、450、451、452、453、454、455、457、459、462、464、465、466、467、468、469、470、474、475、476、477、478、479、481、482、483、484、485、486、487、488、489、490、491、492、493、495、496、497、498、499、500 和 501。

#### [2099] 测试 B

[2100] 为评价对秋粘虫 (*Spodoptera frugiperda*) 的控制, 试验单元由内有 4-5 天龄玉米 (玉蜀黍) 植物的小开口容器构成。用一片昆虫食物上的 10-15 条 1 天龄幼虫对其进行预先侵害 (使用芯取样器)。

[2101] 如测试 A 所述配制受试化合物, 并且以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾。将施用重复三次。喷雾后, 使试验单元保留在 25℃ 和 70% 相对湿度的生长室中, 然后如测试 A 所述进行视觉评定。

[2102] 在所测的 50ppm 式 1 的化合物中, 下列这些提供了极好至优异的防治效果 (40% 或更小的摄食损害, 和 / 或 100% 的死亡率): 1、18、19、20、21、23、26、29、30、33、36、37、40、47、49、50、51、52、53、54、56、57、58、59、60、62、63、65、66、71、74、79、80、81、82、83、84、85、86、87、89、90、101、102、103、104、105、106、110、111、112、113、115、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、150、151、152、154、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、198、199、200、201、202、203、205、207、208、209、210、211、214、215、219、220、221、223、227、228、229、230、231、232、235、236、238、239、240、241、244、245、246、248、250、251、252、253、254、255、256、257、259、261、262、263、264、265、266、267、269、270、271、272、273、274、276、277、278、279、281、285、286、288、289、290、291、292、294、296、297、299、300、301、304、305、306、307、308、309、310、311、313、314、315、316、317、318、319 和 334。

[2103] 在所测的 10ppm 式 1 的化合物中, 下列这些提供了极好至优异的防治效果 (40% 或更小的摄食损害, 和 / 或 100% 的死亡率): 1、18、20、23、26、29、30、33、36、40、47、49、50、51、52、53、57、58、59、60、62、63、65、66、71、79、80、81、82、83、84、85、86、89、90、101、102、103、

105、113、115、118、120、121、122、123、125、126、127、128、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、150、151、152、154、157、158、159、160、161、162、163、165、167、168、170、173、174、175、176、177、178、180、183、184、187、189、190、191、193、194、195、196、198、199、200、202、203、207、208、209、210、211、214、215、219、220、227、228、229、230、231、232、235、238、239、240、241、244、245、246、248、250、251、252、253、254、255、256、257、261、262、263、264、265、266、269、270、271、272、276、277、278、285、286、288、289、290、291、296、297、299、300、301、305、307、308、309、313、314、315、316、317、321、322、323、325、326、327、329、330、332、334、335、336、337、338、341、343、344、345、346、347、351、352、353、354、355、359、363、364、365、366、367、368、369、374、375、376、377、378、380、381、382、384、385、386、387、388、391、395、398、399、401、402、403、404、405、407、408、409、410、411、412、413、414、415、421、422、424、425、426、427、429、431、432、433、434、435、437、438、439、440、441、442、443、448、449、450、451、453、454、455、457、458、462、464、465、466、467、468、479、480、481、482、483、484、485、486、487、489、490、491、492、493、495、496、497、498、499、500 和 501。

#### [2104] 测试 C

[2105] 为评价通过接触和 / 或内吸方式进行的对桃蚜 (*Myzus persicae*) 的防治效果, 试验单元由内有 12-15 天龄萝卜植物的小开口容器构成。通过在试验植物的一片叶片上, 放置 30-40 条位于一片从栽培植物上切下的叶片上的蚜虫 (切叶方法), 将所述植物预先侵害。随着叶片脱水, 蚜虫在试验植物上移动。预先侵染后, 用一层砂覆盖试验单元的土壤。

[2106] 如测试 A 所述配制受试化合物, 并且以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾。将施用重复三次。在将配制好的受试化合物喷雾后, 使每个试验单元干燥 1h, 然后将黑色网盖放置在顶部。使试验单元在 19°C -21°C 和 50% -70% 相对湿度的生长室中保持 6 天。然后视觉评价每个试验单元的昆虫死亡率。

[2107] 在 50ppm 下所测的式 1 的化合物中, 下列这些获得至少 80% 的死亡率: 29、30、32、36、40、45、47、48、50、53、56、59、60、62、71、73、74、79、80、81、82、83、85、89、102、103、104、105、111、112、113、114、115、117、118、119、120、121、122、123、125、131、132、133、135、156、159、160、167、168、173、180、182、183、191、196、199、203、205、209、211、227、228、238、239、240、241、245、257、261、265、266、270、272、275、278、280、282、285、288、289、291、294、295、296、299、304、308、311、312、324、330、331、333、337、340、343、357、358、359、360、361、364、367、368、369、372、373、374、376、378、382、383、393、395、399、403、404、405、409、411、412、414、419、421、424、425、432、435、438、439、441、443、453、457、478、495、498 和 499。

[2108] 在 10ppm 下所测的式 1 的化合物中, 下列这些获得至少 80% 的死亡率: 29、30、36、47、50、53、59、62、74、79、80、81、83、113、115、118、120、121、122、123、125、132、133、135、159、160、168、180、182、183、227、240、241、257、266、285、288、289、294、295、296、299、304、311、331、333、359、374、382、395、405、424、438、439、453、495 和 498。

#### [2109] 测试 D

[2110] 为评价通过接触和 / 或全身方式进行的对棉蚜 (*Aphis gossypii*) 的防治效果, 试验单元由内有 6-7 天龄棉属植物的小开口容器构成。根据测试 C 中所述的切叶方法将 30-40 条昆虫放置在一片叶片上来将所述植物预先侵害, 并且用一层砂覆盖试验单元的土壤。

[2111] 如测试 C 所述配制并以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾受试化合物。将施用重复

三次。喷雾后,使试验单元保留在生长室中,然后如测试 C 所述进行视觉评定。

[2112] 在 50ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些获得至少 80% 的死亡率:30、36、40、48、50、53、60、62、73、74、79、80、81、82、83、102、111、115、118、121、122、123、124、125、126、129、131、133、135、159、168、180、182、183、196、199、227、235、240、257、266、275、296、304、331、333、339、340、351、373、395、405、424、425、439、441、478、495 和 498。

[2113] 在 10ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些获得至少 80% 的死亡率:53、60、62、79、83、121、122、123、168、180、182、227、240、266、296、340、373、424、495 和 498。

#### [2114] 测试 E

[2115] 为评价通过接触和 / 或全身方式进行的对玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis*) 的防治效果,试验单元由内有 3-4 天龄玉米植物 (刺突) 的小开口容器构成。在施用之前将白砂加到土壤上方。如测试 A 所述配制受试化合物,并且以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾,并重复三次。喷雾后,使试验单元干燥 1 小时,之后用约 15-20 只蛹 (18 至 21 天龄),通过用盐瓶将它们撒在砂上,将所述植物后侵害。将黑色网盖放置在每个试验单元的顶部,并使试验单元在 22°C -24°C 和 50% -70% 相对湿度的生长室中保持 6 天。然后视觉评价每个试验单元的昆虫死亡率。

[2116] 在 50ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果 (80% 或更大的死亡率):1、21、26、29、30、36、40、44、47、48、49、50、51、52、53、56、57、59、60、62、63、65、70、71、73、74、77、79、80、81、82、83、84、85、101、102、103、105、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、152、157、158、159、160、165、167、168、170、173、180、181、182、183、189、191、196、199、203、205、206、209、212、227、228、231、235、240、242、246、254、257、261、262、272、275、277、282、288、289、291、294、295、296、297、298、299、300、304、309、311、312、322、324、330、331、333、337、339、340、342、343、344、347、349、352、355、358、359、360、361、363、364、365、368、369、372、373、374、377、378、379、382、384、387、393、394、395、397、399、404、405、409、414、419、421、422、424、425、432、435、439、443、450、452、453、454、455、462、464、467、475、478、482、495、496、497、498、499 和 501。

[2117] 在 10ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果 (80% 或更大的死亡率):26、29、30、36、37、47、48、49、50、53、56、57、59、60、62、63、74、79、80、81、82、84、102、103、105、112、113、114、115、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、132、133、135、152、157、158、159、160、165、167、168、170、173、180、182、183、189、196、227、235、240、246、257、275、282、288、289、295、296、299、300、304、309、311、324、331、333、339、340、342、358、359、364、373、374、382、393、395、397、405、419、424、452、453、455、467、478、495、496、498 和 499。

#### [2118] 测试 F

[2119] 为评价通过接触和 / 或内吸方式进行的对马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae*) 的防治效果,试验单元由内有 5-6 天龄大豆植物 (显出初生叶) 的小开口容器构成。将白砂加到土壤上方,并且在施用前切除一片初生叶。

[2120] 如测试 A 所述配制受试化合物,并且以 50ppm 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾,并且将测试重复三次。喷雾后,使试验单元干燥 1h,之后用 5 条马铃薯小绿叶蝉 (18-21 天龄成虫)

对进行它们后侵害。将黑色网盖放置在每个试验单元的顶部,并使试验单元在 24℃和 70% 相对湿度的生长室中保持 6 天。然后视觉评价每个试验单元的昆虫死亡率。

[2121] 在 50ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果(80% 或更大的死亡率):1、20、21、23、26、29、30、36、37、40、41、42、43、44、45、47、48、49、50、51、52、53、56、57、58、59、60、62、63、65、66、71、74、75、77、79、80、81、82、83、84、85、89、104、105、106、107、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、134、135、136、139、140、150、152、153、155、156、157、158、159、160、161、164、165、166、167、168、169、170、173、179、180、181、182、183、186、188、189、191、193、196、199、204、205、206、207、209、210、211、212、214、215、218、225、226、227、228、230、231、235、236、238、239、240、242、245、246、250、251、256、257、261、262、272、275、276、277、278、280、282、285、286、288、289、291、292、294、295、296、299、300、301、302、304、305、306、308、309、310、311、312、318、321、322、323、324、325、327、328、330、333、336、337、338、340、342、343、344、352、354、355、356、357、358、359、360、361、363、364、367、368、369、372、373、374、375、376、377、378、382、384、385、387、388、403、404、405、407、412、414、419、421、424、425、427、432、435、438、439、440、441、443、450、457、464、467、478、482、495、498 和 499。

[2122] 在 10ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果(80% 或更大的死亡率):26、29、30、36、37、40、47、48、49、50、51、52、53、56、57、59、60、62、63、65、66、71、75、79、80、81、82、83、84、88、89、102、104、105、106、111、113、114、115、116、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、129、130、131、132、135、152、157、158、159、160、161、164、165、166、168、169、170、173、180、182、183、189、191、196、205、206、210、211、212、214、218、227、228、231、236、239、240、245、246、256、257、262、272、277、282、285、286、289、291、295、299、300、302、309、310、312、322、323、324、330、333、342、343、344、352、354、357、359、360、364、367、368、374、375、382、405、424、434、438、440、443、478、498 和 499。

#### [2123] 测试 G

[2124] 为评价通过接触和 / 或内吸方式进行的对西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*) 的防治效果,试验单元由内有 5-7 天龄大豆植物的小开口容器构成。

[2125] 如测试 A 所述配制受试化合物,并且以 250、50 和 / 或 10ppm 的浓度喷雾,并且将测试重复三次。喷雾后,使试验单元干燥 1 小时,然后将 22-27 条花蓟马成虫加入到所述单元中。将黑色网盖放置在每个试验单元的顶部,并使试验单元在 25℃和 45-55% 相对湿度中保持 7 天。

[2126] 在 250ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果(30%或更小植物损害和 / 或 100%死亡率):50、56、89、121、139、343、344 和 346。

[2127] 在 50ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果(30% 或更小植物损害和 / 或 100%死亡率):191、199、230、272、285、28、300、321、322、343、344、346、352、360、364、365、368、369、377、378、407、409、411、421、432、435、438、440 和 443。

[2128] 在 10ppm 下所测的式 1 的化合物中,下列这些提供了极好至优异的防治效果(30% 或更小植物损害和 / 或 100%死亡率):272、289、343、344、346、364 和 369。