

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200710152936.6

[51] Int. Cl.

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 403/06 (2006.01)

C07D 239/96 (2006.01)

C07D 239/90 (2006.01)

C07D 243/14 (2006.01)

C07D 401/06 (2006.01)

[43] 公开日 2008 年 3 月 5 日

[11] 公开号 CN 101134755A

[51] Int. Cl. (续)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/62 (2006.01)

A01N 47/34 (2006.01)

A01N 47/38 (2006.01)

[22] 申请日 2003.1.16

[21] 申请号 200710152936.6

分案原申请号 03802557.4

[30] 优先权

[32] 2002.1.22 [33] US [31] 60/350,632

[71] 申请人 纳幕尔杜邦公司

地址 美国特拉华州威尔明顿

[72] 发明人 D·A·克拉克 G·P·拉姆

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 李连涛

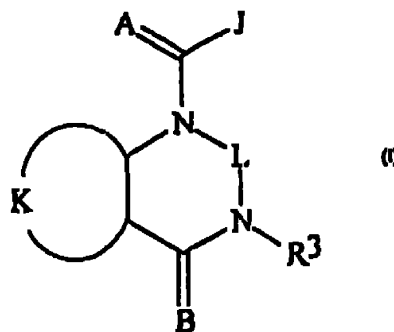
权利要求书 2 页 说明书 82 页

[54] 发明名称

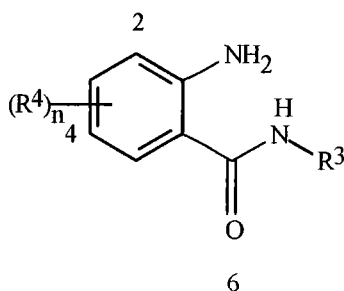
用于防治无脊椎害虫的噻唑啉(二)酮

[57] 摘要

本发明公开了用作无脊椎害虫防治剂的式 I 化合物, 包括其所有的几何异构体和立体异构体, N-氧化物及其农业上适合的盐, 式 I 中的 A, B, J, K, L 和 R³ 如说明书中所述定义。还公开了防治无脊椎害虫的组合物, 包括生物有效量的式 I 化合物, 其 N-氧化物或该化合物的适合的盐以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的其它组分。本发明还公开了防治无脊椎害虫的方法, 包括将生物有效量的式 I 化合物、其 N-氧化物或该化合物的适合的盐(例如使用此处所述的组合物)与无脊椎害虫或其周围环境接触。



1. 式 6 的化合物, 其 *N*-氧化物或盐,



其中

R^3 是 H 或 C_1 - C_4 烷基, 任选被 1-5 个各自独立地选自下列的取代基取代: 卤素、CN、 OCH_3 和 $S(O)_pCH_3$;

R^4 在 2-位连接苯环且所述的 R^4 为 CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 、CN 或卤素;

任选的第二个 R^4 为 F、Cl、Br、I、CN 或 CF_3 ;

p 为 0、1 或 2; 和

n 为 1 或 2;

条件是

(a) 当在 2-位连接苯环的 R^4 和在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 Cl 时, R^3 不是 H、 CH_2CH_3 或 $CH(CH_3)CH_2CH_3$;

(b) 当在 2-位连接苯环的 R^4 是 CH_3 或 Cl, 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 H、Cl、或 Br 时, R^3 不是 CH_3 或 $CH(CH_3)_2$;

(c) 当在 2-位连接苯环的 R^4 是 CH_3 , 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 H 时, R^3 不是 H 或正丙基;

(d) 当在 2-位连接苯环的 R^4 是 Cl, 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 H 时, R^3 不是 H、 CH_2CH_3 或 $CH_2CH_2CH_3$;

(e) 当在 2-位连接苯环的 R^4 和在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 Br 时, R^3 不是 H 或 CH_2CH_3 ;

(f) 当 R^3 是 H, 在 2-位连接苯环的 R^4 是 CF_3 时, 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 不是 F、Cl 或 Br;

(g) 当在 2-位连接苯环的 R^4 是 F 或 I, 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 H 时, R^3 不是 H;

(h) 当 R^3 是 H, 在 2-位连接苯环的 R^4 是 Cl 时, 在 4-位连接苯环的

第二个 R^4 不是 3-Cl、5-Cl 或 4-Br;

(i) 当在 2-位连接苯环的 R^4 是 Br, 在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 Cl 时, R^3 不是 H; 和

(j) 当在 2-位连接苯环的 R^4 和在 4-位连接苯环的第二个 R^4 是 I 时, R^3 不是 H 或 CH_2CH_3 。

2. 权利要求 1 的化合物, 其中在 2-位连接苯环的 R^4 是 CH_3 、Cl、Br 或 I。

3. 权利要求 2 的化合物, 其中任选的第二个 R^4 是在 4-位连接苯环。

4. 权利要求 3 的化合物, 其中 R^3 是 H、甲基、乙基、异丙基或叔丁基。

5. 权利要求 4 的化合物, 其中 R^3 是 H、甲基或异丙基, 在 2-位连接苯环的 R^4 是 CH_3 , 任选的第二个 R^4 是 CN。

用于防治无脊椎害虫的噻唑啉(二)酮

本申请是国际申请日为 2003 年 1 月 16 日(国际申请号为 PCT/US03/01482)、进入国家阶段申请号为 03802557.4、发明名称为“用于防治无脊椎害虫的噻唑啉(二)酮”的发明专利申请的分案申请。

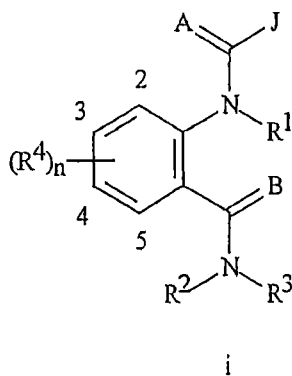
技术领域

本发明涉及某些噻唑啉(二)酮,它们的 *N*-氧化物,农业上适合的盐及其组合物,以及在农业和非农业环境中应用于防治无脊椎害虫的方法。

背景技术

为获得农作物的高产率,防治无脊椎害虫是极为重要的。无脊椎害虫对生长期或储藏农作物的危害都会引起显著的产量损失,从而导致增加消费者的费用。对于在林业,温室作物,观赏植物,苗圃植物,贮藏食品及纤维制品,牲畜,家庭,以及公共和动物卫生领域中防治无脊椎害虫也是重要的。针对上述这些应用,许多产品已投放市场,但是仍然需要开发更有效、低成本、低毒、环境安全的或具有不同作用方式的新化合物。

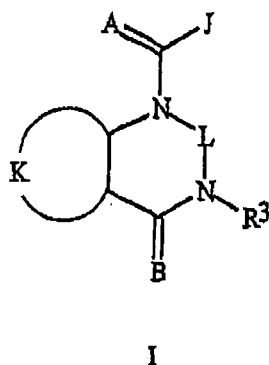
WO01/070671 公开了作为杀节肢动物剂的式 I 的 *N*-酰基邻氨基苯甲酸衍生物



其中,尤其是,A 和 B 各自独立地是 O 或 S;J 是任选取代的苯环,5-或 6-元杂芳环,萘环系或芳族的 8-,9-或 10-元杂双环稠环体系; R^1 和 R^3 各自独立地是 H 或任选取代的 C_1 - C_6 烷基; R^2 是 H 或 C_1 - C_6 烷基;每个 R^4 各自独立地是 H, C_1 - C_6 烷基, C_1 - C_6 卤代烷基,卤素或 CN;以及 n 是 1-4。

发明概述

本发明涉及式 I 化合物,包括其所有的几何异构体和立体异构体,其 *N*-氧化物及其适合的盐,

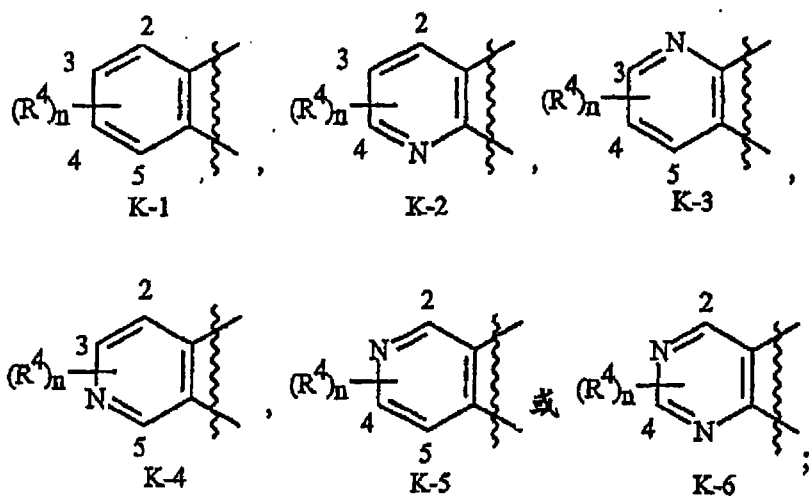


其中

A 和 B 各自独立地是 O 或 S;

J 是苯环,萘环系,5-或 6-元杂芳环或芳族的 8-,9-或 10-元杂双环稠环体系,其中每个环或环系任选被 1-4 个各自独立地选自 R^5 的取代基取代;

K 是与两个相邻连接碳原子一起形成选自下列一组的稠合苯环,稠合吡啶环或稠合嘧啶环:K-1,K-2,K-3,K-4,K-5 和 K-6,每个任选被 1-4 个各自独立地选自 R^4 的取代基取代;



L 是直接连接键;或选自碳,氮,氧和硫的具有 1-3 个单元 (member) 的连接键,任选包括一或两个如 $C(=E)$,SO 或 $S(O)_2$ 的链单元,以及任选被一至三个各自独立地选自 R^{13} 的取代基取代;

E 是 O,S 或 NR^8 ;

R^3 是 H;G; C_1 - C_6 烷基, C_2 - C_6 烯基, C_2 - C_6 炔基, C_3 - C_6 环烷基,各自任选被 1-5 个各自独立地选自下列的取代基取代:G,卤素,CN, NO_2 ,羟基, 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_2 - C_6 烷氧基羰基, C_2 - C_6 烷基羰基, C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基,苯

基,苯氧基和 5-或 6-元杂芳环,每个苯基,苯氧基和 5-或 6-元杂芳环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代;或任选被 1-3 个各自独立地选自 R^6 的取代基取代的苯基;

G 是 5-或 6-元非芳族碳环或杂环,任选包括一个或两个选自 $C(=O)$, SO 和 $S(O)_2$ 基团的环单元以及任选被 1-4 个各自独立地选自 R^{12} 的取代基取代;

每个 R^4 各自独立地是 C_1-C_6 烷基, C_2-C_6 烯基, C_2-C_6 炔基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 卤代烯基, C_2-C_6 卤代炔基, C_3-C_6 卤代环烷基, 卤素, CN , NO_2 , 羟基, 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_1-C_4 烷氧基烷基, C_1-C_4 羟基烷基, $C(O)R^{10}$, CO_2R^{10} , $C(O)NR^{10}R^{11}$, $NR^{10}R^{11}$, $N(R^{11})CO_2R^{10}$ 或 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或

每个 R^4 各自独立地是苯基,苄基,苯氧基或 5-或 6-元杂芳环,每个环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代;

每个 R^5 各自独立地是 C_1-C_6 烷基, C_2-C_6 烯基, C_2-C_6 炔基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 卤代烯基, C_2-C_6 卤代炔基, C_3-C_6 卤代环烷基, 卤素, CN , CO_2H , $CONH_2$, NO_2 , 羟基, 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 烷基磺酰氧基, 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 卤代烷基磺酰氧基, C_1-C_4 烷基氨基, C_2-C_8 二烷基氨基, C_3-C_6 环烷基氨基, C_2-C_6 烷基羰基, C_2-C_6 烷氧基羰基, C_2-C_6 烷基氨基羰基, C_3-C_8 二烷基氨基羰基或 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或

每个 R^5 各自独立地是苯基,苄基,苯甲酰基,苯氧基,5-或 6-元杂芳环或芳族的 8-,9-或 10-元杂双环稠环体系,每个环或环系任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代;或

当与相邻碳原子连接时的两个 R^5 基团一起构成 $-OCF_2O-$, $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$;

每个 R^6 各自独立地是 C_1-C_4 烷基, C_2-C_4 烯基, C_2-C_4 炔基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_2-C_4 卤代烯基, C_2-C_4 卤代炔基, C_3-C_6 卤代环烷基, 卤素, CN , NO_2 , C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷氧基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基亚

磺酰基, C_1 - C_4 烷基磺酰基, C_1 - C_4 卤代烷基磺基, 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_3 - C_6 (烷基)环烷基氨基, C_2 - C_4 烷基羰基, C_2 - C_6 烷氧基羰基, C_2 - C_6 烷基氨基羰基, C_3 - C_8 二烷基氨基羰基或 C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基;

R^8 是 H; C_1 - C_6 烷基, C_2 - C_6 烯基, C_2 - C_6 炔基或 C_3 - C_6 环烷基, 每个基团任选被 1-5 个各自独立地选自下列的取代基取代: 卤素, CN, NO_2 , 羟基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_1 - C_4 烷基磺基, C_1 - C_4 烷基亚磺酰基, C_1 - C_4 烷基磺酰基, C_2 - C_6 烷氧基羰基, C_2 - C_6 烷基羰基, C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基, 苯环以及 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代; CN; NO_2 ; C_2 - C_6 烷氧基羰基; C_1 - C_4 烷基磺酰基; 或任选被 1-3 个各自独立地选自 R^6 的取代基取代的苯基或苯基磺酰基;

每个 R^{10} 各自独立地是 H, C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 卤代烷基;

每个 R^{11} 各自独立地是 H 或 C_1 - C_4 烷基;

每个 R^{12} 各自独立地是 C_1 - C_2 烷基, 卤素, CN, NO_2 或 C_1 - C_2 烷氧基;

每个 R^{13} 各自独立地是 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, 卤素, CN, COOH, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_2 - C_6 烷氧基羰基, C_2 - C_6 烷氧基羰基烷基; 或

每个 R^{13} 是苯环或 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代; 以及

n 是 0, 1, 2, 3 或 4。

本发明还涉及防治无脊椎害虫的方法, 包括将生物有效量的式 I 化合物, 其 N -氧化物或该化合物的适合的盐(例如, 使用此处所述的组合物)与无脊椎害虫或它们的周围环境接触。本发明还涉及下述方法, 其中将生物有效量的式 I 化合物或含有式 I 化合物以及生物有效量的至少一种防治无脊椎害虫的其它化合物或制剂的组合物与无脊椎害虫或它们的周围环境接触。

本发明还涉及防治无脊椎害虫的组合物, 包括生物有效量的式 I 化合物, 其 N -氧化物或该化合物的适合的盐以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的其它组分。本发明还涉及包括生物有效量的式 I 化合物, 其 N -氧化物或该化合物的适合的盐以及有效量的至少一种其它生物活性化合物或制剂的组合物。

发明详述

上文中,术语“烷基”,或单独使用或以复合词如“烷硫基”或“卤代烷基”的形式出现,包括直链或支链烷基,如,甲基,乙基,正丙基,异丙基,或各种丁基,戊基或己基异构体。“烯基”包括直链或支链烯基,如乙烯基,1-丙烯基,2-丙烯基,以及各种丁烯基,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,如乙炔基,1-丙炔基,2-丙炔基和各种丁炔基,戊炔基和己炔基异构体。“炔基”还可包括含多个三键部分的基团,如2,5-己二炔基。

“烷氧基”包括,例如,甲氧基,乙氧基,正丙氧基,异丙氧基和各种丁氧基,戊氧基和己氧基异构体。“烷氧基烷基”表示烷氧基取代的烷基。“烷氧基烷基”的实例包括 CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。“烷硫基”包括支链或直链烷硫基部分,如甲硫基,乙硫基,以及各种丙硫基,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异构体。“烷基亚磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ 以及各种丁亚磺酰基,戊亚磺酰基和己亚磺酰基异构体。“烷基磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ 以及各种丁磺酰基,戊磺酰基和己磺酰基异构体。“烷基磺酰氧基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{O}$ 以及各种丁磺酰氧基,戊磺酰氧基和己磺酰氧基异构体。“烷基氨基”,“二烷基氨基”,“烯硫基”,“烯基亚磺酰基”,“烯基磺酰基”,“炔硫基”,“炔基亚磺酰基”,“炔基磺酰基”等类似于上述实例所述定义。“环烷基”包括,例如,环丙基,环丁基,环戊基和环己基。

“芳族的”表示每个环原子基本上处于同一平面并具有垂直于此环平面的 p-轨道,以及环上的 π 电子数 $(4n+2)$, 其中 n 是 0 或正整数,符合休克尔规则。术语“芳环系”表示全部是未饱和的碳环和杂环,其中多环体系中的至少一个环是芳族的。术语“芳族碳环或环系”包括全部是芳族的碳环以及多环体系中的至少一个环是芳族的碳环(例如苯基和萘基)。术语“芳基”是指任何任选取代的芳环或环系。术语“非芳族碳环或环系”表示全部是饱和碳环以及部分或全部未饱和碳环,环系中任何环均不符合休克尔规则。与环或环系连接的术语“杂”是指其中至少一个环原子不是碳的环或环系以及该环或环系可含有 1-4 个各自独

立地选自氮,氧和硫的杂原子,条件是每个环含有不多于4个氮原子,不多于2个氧原子和不多于2个硫原子。术语“杂芳环或环系”包括全部是芳族杂环和多环体系中至少一个环是芳族的杂环(其中芳族的表示符合休克尔规则)。术语“非芳族的杂环或环系”表示全部是饱和的杂环以及部分或全部未饱和杂环,其中环系中任何环均不符合休克尔规则。杂环或环系可通过任何可利用的碳或氮以置换所述碳或氮上的氢的方式连接。

单独或以复合词如“卤代烷基”出现的术语“卤素”,包括氟,氯,溴或碘。而且,当在复合词如“卤代烷基”中使用时,所述烷基可以是被相同或不同卤素原子部分或全部取代的烷基。“卤代烷基”的实例包括 F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。术语“卤代烯基”,“卤代炔基”,“卤代烷氧基”,“卤代烷硫基”等的定义类似于术语“卤代烷基”。

“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 CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。“卤代烷硫基”的实例包括 CCl_3S , CF_3S , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。“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 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ 。“卤代烷基磺酰氧基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ 。

“烷基羰基”的实例包括 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 和 $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。“烷氧基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 以及各种丁氧基-或戊氧基羰基异构体。“烷氧基羰基烷基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 以及 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})\text{CH}_2$ 。“烷基氨基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ 以及各种丁氨基-或戊氨基羰基的异构体。“二烷基氨基羰基”的实例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$ 。

取代基中碳原子总数是以“ $\text{C}_i\text{-C}_j$ ”前缀表示,其中 i 和 j 是 1-6 的数。例如, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基磺酰基表示甲磺酰基至丙磺酰基; C_2 烷氧基烷基表示

CH_3OCH_2 ; C_3 烷氧基烷基表示,例如, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; 以及 C_4 烷氧基烷基表示被含总数为四个碳原子的烷氧基取代的烷基的各种异构体,实例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

在上述说明中,当式 I 化合物包括一个或多个杂环时,所有的取代基都通过任何可得的碳或氮以置换所述碳或氮上的氢的方式与这些杂环相连。

当化合物被取代基取代,其带有表示所述取代基数目可大于 1 的下角标时,所述的取代基(当它们大于 1 时)各自独立地选自所定义的取代基组中。另外,当下角标表示一个范围,例如 $(\text{R})_{1-j}$ 时,取代基的数目可选择包括 i 和 j 在内的 i 至 j 的整数。

术语“任选一至三个取代基取代的”等措辞表示在基团上有一至三个可得位置能被取代。当基团含有可以是氢的取代基时,例如 R^3 或 R^8 , 那么当这个取代基是氢时,可以认为所说的基团是无取代的。

本发明的化合物可能存在一种或多种立体异构体。各种立体异构体包括对映体,非对映异构体,阻转异构体和几何异构体。本领域技术人员懂得,当一种立体异构体相对于其它立体异构体含量更多或当从其它立体异构体分离出来的时候,这个立体异构体可以显示更高的活性和/或呈现有益的效果。另外,熟练的技术人员也知道如何去分离、富集,和/或选择性地制备所说的立体异构体。因此,本发明包括选自式 I 的化合物、N-氧化物及其农业上适合的盐。本发明的化合物可以以立体异构体的混合物,单个立体异构体,或以光学活性形式存在。

本领域技术人员懂得,不是所有含氮杂环都可以形成 N-氧化物,因为为了氧化成氧化物,氮需要有可得的孤对电子;本领域技术人员也知道,那些含氮杂环可以形成 N-氧化物。本领域技术人员还知道,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,包括用过氧酸如过乙酸和间氯过苯甲酸(MCPBA),过氧化氢,烷基氢过氧化物如叔丁基氢过氧化物,过硼酸钠和二环氧乙烷如二甲基二环氧乙烷氧化杂环和叔胺。这些制备 N-氧化物的方法已在文献中广泛介绍或综述,例如参见下述文献:T.L.Gilchrist 在 *Comprehensive Organic Synthesis*(综合有机合成),第 7 卷,第 748-750 页,S.V.Ley 编辑,Pergamon 出版社;M.Tisler 和 B.Stanovnik 在 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*(综合杂环化学),第 3 卷,第 18-20

页, A.J. Boulton 和 A. McKillop 编辑, Pergamon 出版社; M.R. Grimmett 和 B.R.T. Keene 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry* (杂环化学进展), 第 43 卷, 第 149-161 页, A.R. Katritzky 编辑, Academic 出版社; M. Tisler 和 B. Stanovnik 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 9 卷, 第 285-291 页, A.R. Katritzky 和 A.J. Boulton 编辑, Academic 出版社; 以及 G.W.H. Cheeseman 和 E.S.G. Werstiuk 在 *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 22 卷, 第 390-392 页, A.R. Katritzky 和 A.J. Boulton 编辑, Academic 出版社。

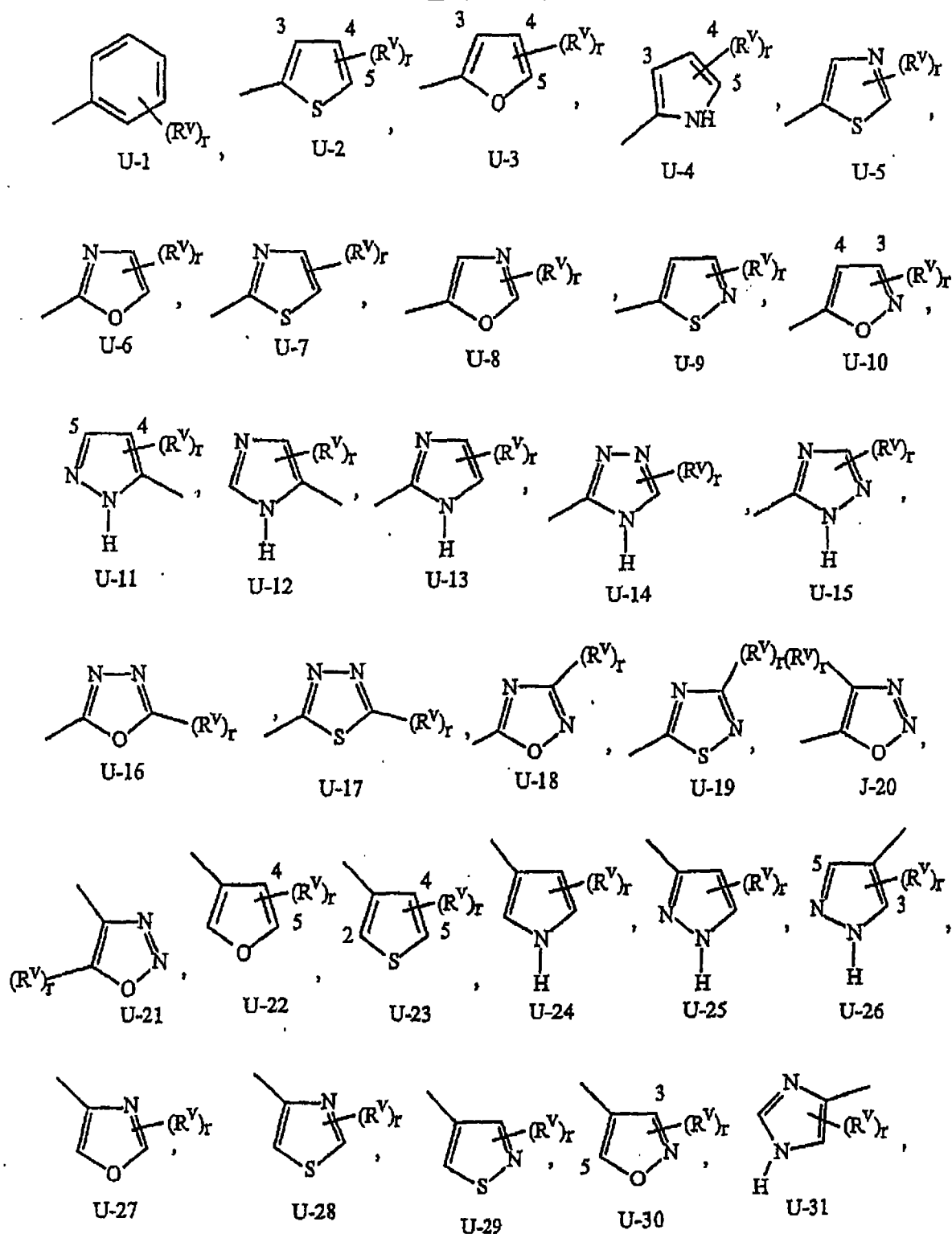
本发明化合物的盐包括与无机或有机酸的酸加成盐, 酸如氢溴酸, 盐酸, 硝酸, 磷酸, 硫酸, 醋酸, 丁酸, 富马酸, 乳酸, 马来酸, 丙二酸, 草酸, 丙酸, 水杨酸, 酒石酸, 4-甲苯磺酸和戊酸。当本发明化合物含有酸性基团如羧酸基或酚基时, 本发明化合物的盐还包括与有机碱(例如吡啶, 氨或三乙胺)或无机碱(例如氢氧化物, 氢氧化物或钠、钾、锂、钙、镁或钡的碳酸盐)形成的盐。

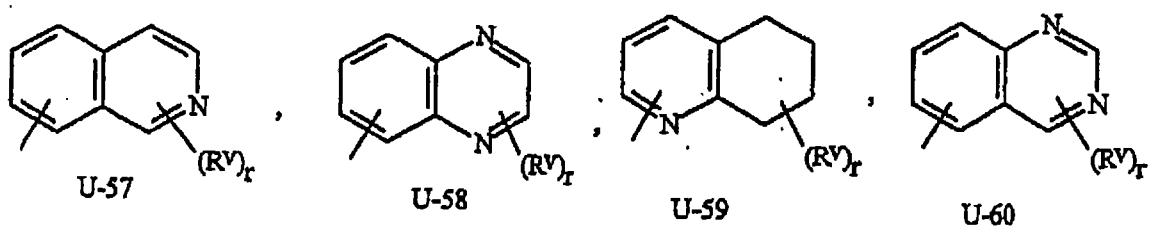
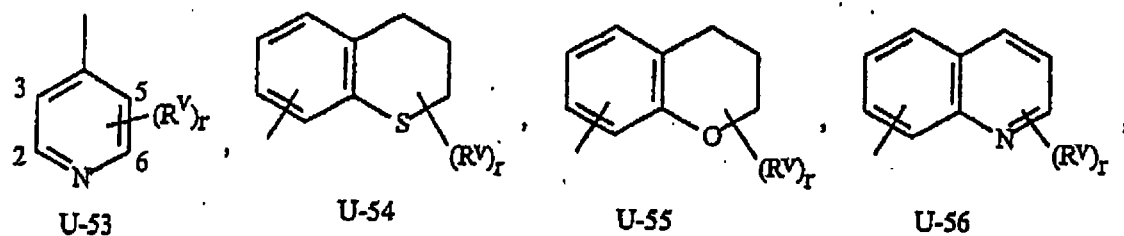
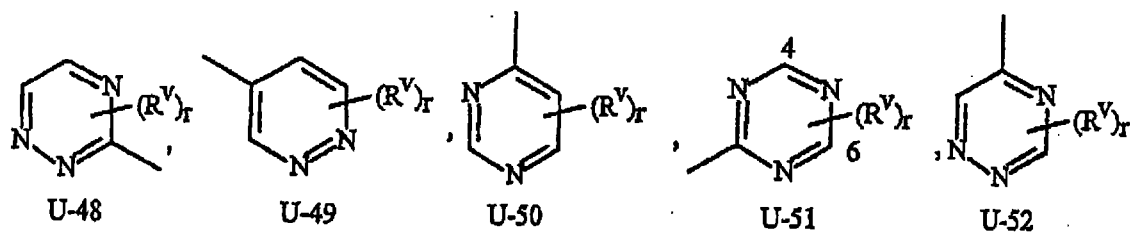
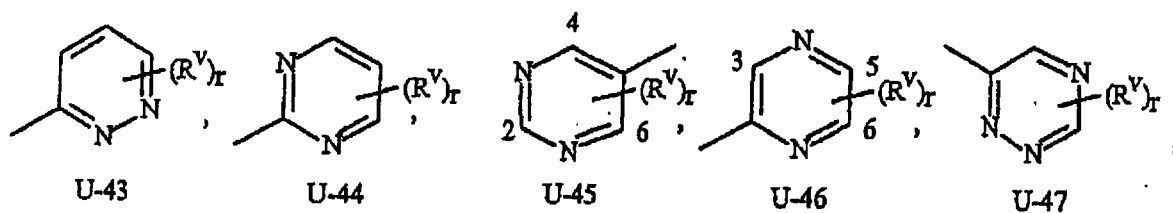
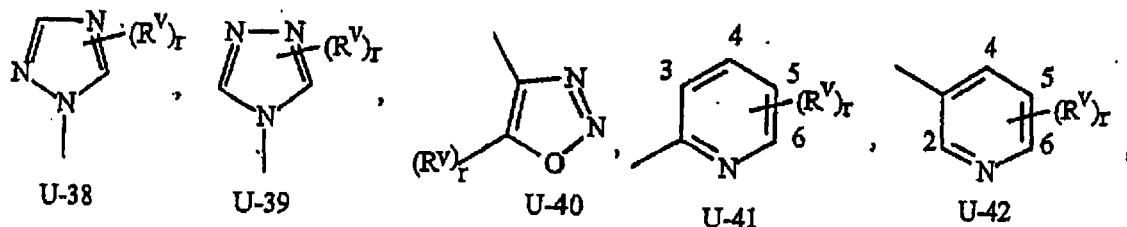
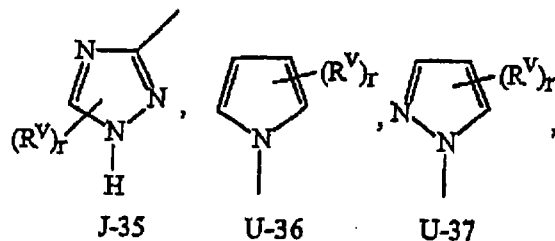
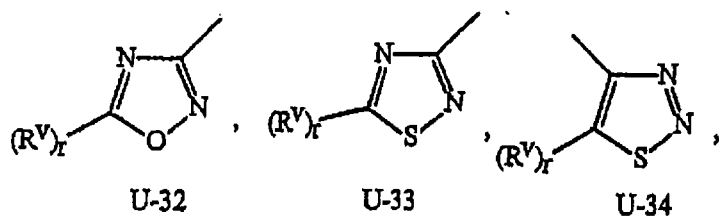
如上所述, J 是苯环, 萘环系, 5-或 6-元杂芳环或芳族的 8-, 9-或 10-元杂双环稠环体系, 其中每个环或环系任选被 1-4 个各自独立地选自 R^5 的取代基取代。与这些 J 基团相连接的术语“任选取代”是指这些基团是未取代的或带有至少一个非氢取代基, 该取代基并不消灭未取代的类似物所具有的生物活性。任选 1-4 个 R^5 取代的苯基的实例是在基团组 1 中 U-1 所示的环, 其中 R^v 是 R^5 以及 r 是 0-4 的整数。任选 1-4 个 R^5 取代的萘基的实例是在基团组 1 中 U-85 所示的环, 其中 R^v 是 R^5 以及 r 是 0-4 的整数。任选 1-4 个 R^5 取代的 5-或 6-元杂芳环的实例包括在基团组 1 中 U-2 至 U-53 所示的环, 其中 R^v 是 R^5 以及 r 是 0-4 的整数。注意下述 J-1 至 J-13 也表示 5-或 6-元杂芳环。注意 U-2 至 U-20 是 J-1 的实例, U-21 至 U-35 和 U-40 是 J-2 的实例, U-36 至 U-39 是 J-3 的实例, U-41 至 U-48 是 J-4 的实例以及 U-49 至 U-53 是 J-5 的实例。注意 U-11 等同于 J-6, U-26 等同于 J-7 或 J-10, U-42 等同于 J-8, U-45 等同于 J-9, U-4 等同于 J-11 以及 U-24 等同于 J-12 或 J-13。还需要注意的是在 J-6 至 J-13 中 R^7 和 R^9 是式 I 中的 R^5 的子集(subset)。任选 1-4 个各自独立地选自 R^5 的取代基取代的芳族的 8-, 9-或 10-元杂双环稠环体系包括在基团组 1 中 U-54 至 U-84 所示的环, 其中 R^v 是式 I 中的 R^5 以及 r 是 0-4 的整数。

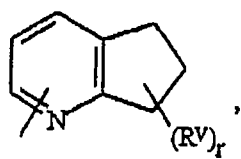
R^v 是采用置换所述碳或氮上的氢的方式通过任何可供使用的碳或氮与这些环连接。注意一些 U 基团仅能用少于 4 个的 R^v 基团取代(例

如 U-16 至 U-21 以及 U-32 至 U-34 只能用一个 R^V 进行取代), 应当注意的是当 $(R^V)_r$ 和 U 基团之间的连接点被表示为不固定(floating)时, $(R^V)_r$ 可与 U 基团上任何可供使用的碳或氮连接。应注意的是, 当 U 基团上的连接点表示为不固定时, U 基团可采用置换氢原子的方式与式 I 其余部分通过 U 基团上任何可供使用的碳或氮连接。

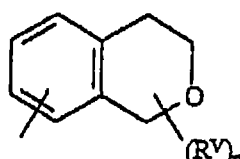
基团组 1



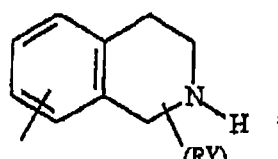




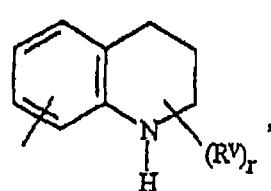
U-61



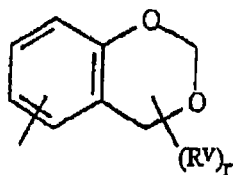
U-62



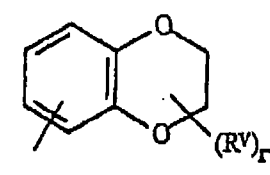
U-63



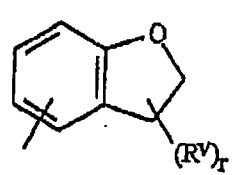
U-64



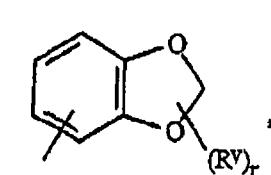
U-65



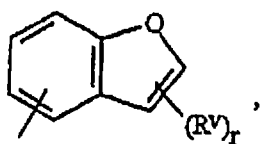
U-66



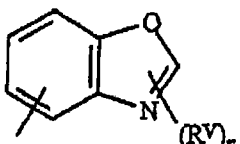
U-67



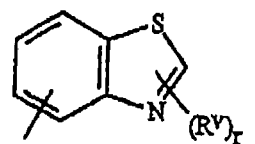
U-68



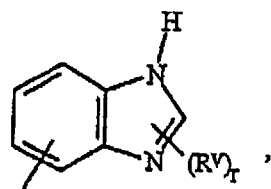
U-69



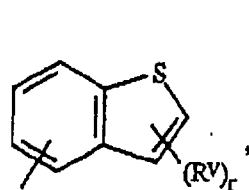
U-70



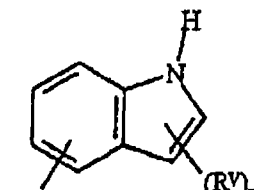
U-71



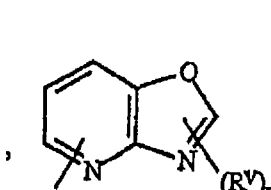
U-72



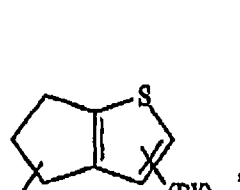
U-73



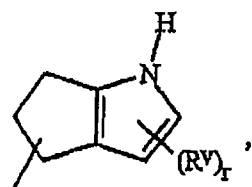
U-74



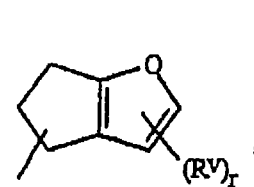
U-75



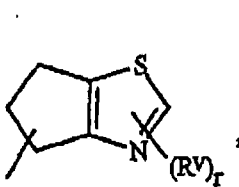
U-76



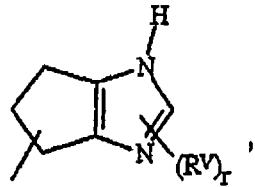
U-77



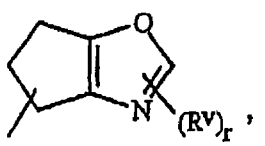
U-78



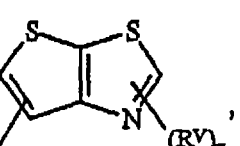
U-79



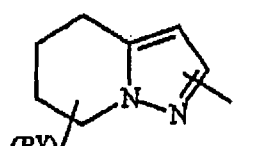
U-80



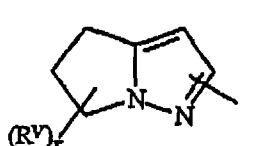
U-81



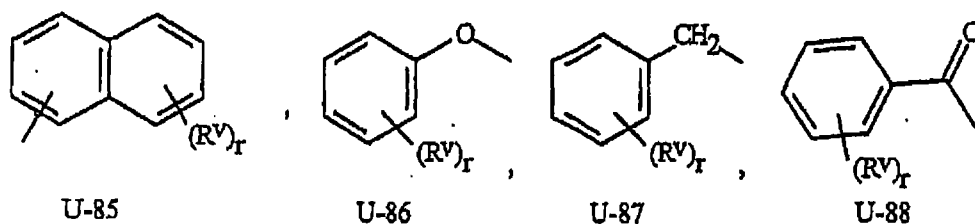
U-82



U-83

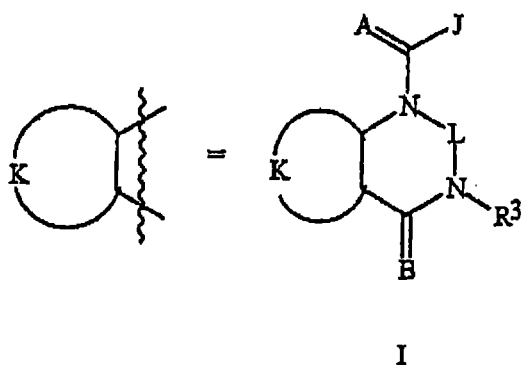


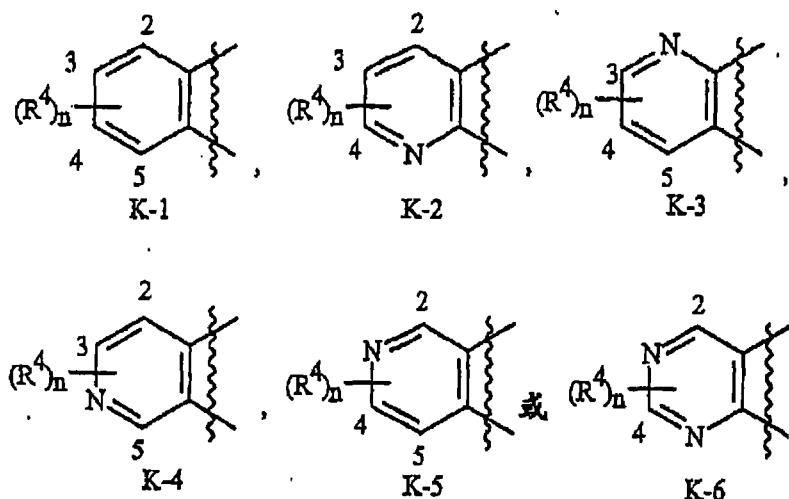
U-84



如上所述, K 是与两个相邻连接碳原子一起形成的稠合苯环, 稠合吡啶环或稠合嘧啶环, 每个环任选被 1-4 个各自独立地选自 R^4 的取代基取代。与这些 K 基团相关的术语“任选取代的”是指这些基团是未取代的或带有至少一个非氢取代基, 该取代基并不会使未取代类似物所具有的生物活性消失。这些 K 基团的实例包括如基团组 2 中的 K-1 至 K-6 所示的环。应注意的是 K-2 至 K-5 可任选被一至三个各自独立地选自 R^4 的取代基取代。还应当注意的是 K-6 可任选被一至二个各自独立地选自 R^4 的取代基取代。在例举的 K 基团中, 右上部键通过可供利用的连接碳原子与式 I 的 $N(L)-C(=A)J$ 这部分基团的氮原子连接, 而右下部键通过可供利用的连接碳原子与式 I 的 $C(=B)N(L)R^3$ 这部分基团的碳原子连接。如下所示, 波纹线表示 K-环与式 I 的其余部分连接。

基团组 2



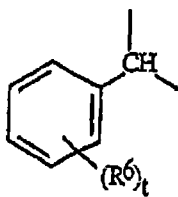


优选 K-环是 K-1, K-2, K-5 和 K-6。最优选是 K-1。

如上所述, L 是直接连接键;或选自碳,氮,氧和硫的具有 1-3 个单元的连接键,任选包括一或两个如 $C(=E)$, SO 或 $S(O)_2$ 的键单元,以及任选被一至三个各自独立地选自 R^{13} 的取代基取代。与这些 L 基团相关的术语“任选取代的”是指这些基团是未取代的或带有至少一个非氢取代基,该取代基并不会使未取代类似物所具有的生物活性消失。L 基团的实例包括如基团组 3 中所示的基团 L-1 至 L-17。在 L-17 中, t 是 1-3 的整数。尽管在结构式 L-17 中示出 R^6 基团,但是应当注意的是由于它们是任选取代基,因此并不必定存在。优选的 L 基团是 L-1, L-6, L-7, L-9 和 L-10。

基团组 3

$-C(=O)-$ L-1	$-C(=S)-$ L-2	$-C(=NR^8)-$ L-3	$-S(O)-$ L-4
$-SO_2-$ L-5	$-CH_2-$ L-6	$-CH_2CH_2-$ L-7	$-CH_2CH_2CH_2-$ L-8
$-CH(CH_3)-$ L-9	$-C(CH_3)_2-$ L-10	$-CH(OCH_3)-$ L-11	$-C(OCH_3)_2-$ L-12
$-CF_2-$ L-13	$-CF_2CF_2-$ L-14	$-CH(CF_3)-$ L-15	$-CH(CCl_3)-$ L-16

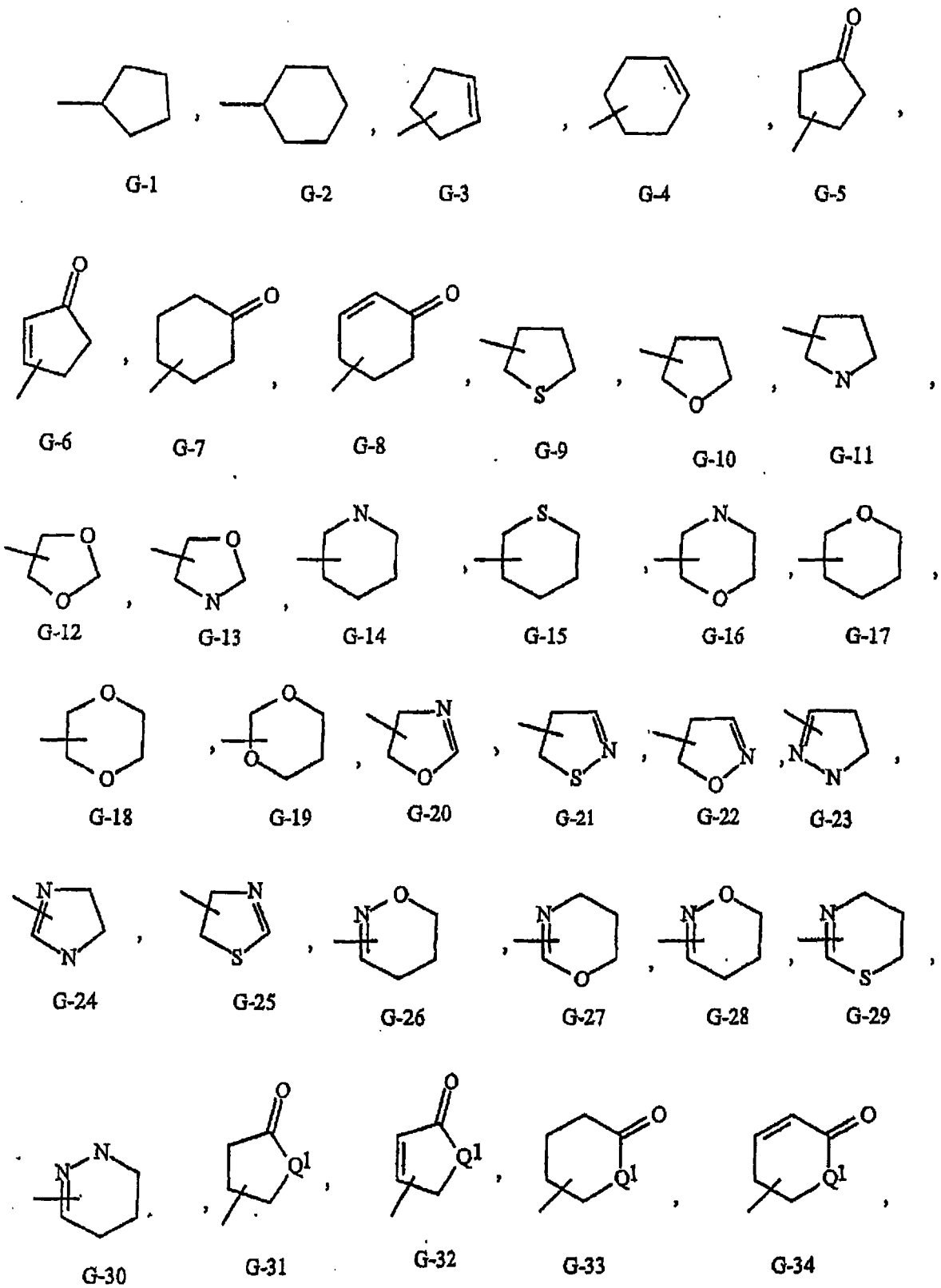


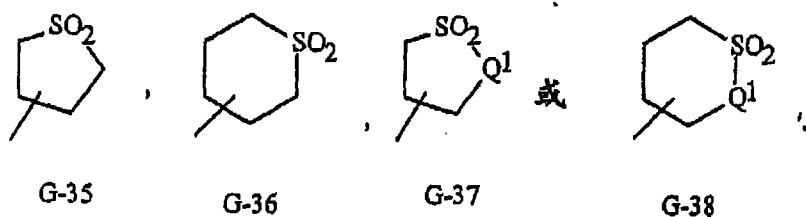
L-17

如上所述, R^3 可以(其中包括(among others))是 C_1 - C_6 烷基, C_2 - C_6 烯基, C_2 - C_6 炔基, C_3 - C_6 环烷基, 各自任选被一至五个各自独立地选自下列的取代基取代: 苯环和 5-或 6-元杂芳环, 每一个环任选被各自独立地选自 R^6 的一至三个取代基取代。引入所述 R^3 基团中的这些环的实例包括在基团组 1 中如 U-1 至 U-53 以及 U-86 所示的环, 只是这些环任选被各自独立地选自 R^6 而非 $(R^v)_r$ 的 1-3 个取代基取代的并与选自上面刚列出的 R^3 基团连接。

如上所述, R^3 可以(其中包括)是 G; 或 C_1 - C_6 烷基, C_2 - C_6 烯基, C_2 - C_6 炔基, C_3 - C_6 环烷基, 各自任选被 G 取代; 其中 G 是 5-或 6-元非芳族碳环或杂环, 任选包括一个或两个选自由 $C(=O)$, SO 和 $S(O)_2$ 组成的组的环单元以及任选被 1-4 个各自独立地选自 R^{12} 的取代基取代。与这些 G 基团相关联的术语“任选取代的”是指这些基团是未取代的或带有至少一个非氢取代基, 该取代基并不会使未取代类似物所具有的生物活性消失。任选的取代基通过取代氢原子与任何可得碳原子连接。作为 G 的 5-或 6-元非芳族碳环的实例包括在基团组 3 中如 G-1 至 G-8 所示的环。作为 G 的 5-或 6-元非芳族杂环的实例包括在基团组 4 中如 G-9 至 G-38 所示的环。应当注意的是, 当 G 包括选自 G-31 至 G-34, G-37 和 G-38 的环时, Q^1 选自 O, S 或 N。应注意的是, 当 G 是 G-11, G-13, G-14, G-16, G-23, G-24, G-30 至 G-34, G-37 和 G-38 以及 Q^1 是 N 时, 氮原子可通过用 H 或 C_1 - C_2 烷基取代补齐其化合价。应注意的是, 当 G 基团上的连接点表示为不固定时, G 基团可采用置换氢原子的方式与式 I 其余部分通过 G 基团上任何可供使用的碳连接。

基团组 4





如上所述,每个 R^4 可以各自独立地(其中包括)是苯基,苄基,苯氧基或 5-或 6-元杂芳环,每个环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代。这些 R^4 基团的实例包括在基团组 1 中如 U-1 至 U-53, U-86 和 U-87 所示的那些环或环系,只是这些环任选被各自独立地选自 R^6 而非 $(R^v)_r$ 的 1-3 个取代基取代。

如上所述,每个 R^5 可以各自独立地(其中包括)是苯基,苄基,苯甲酰基,苯氧基,5-或 6-元杂芳环或芳族的 8-,9-或 10-元杂双环稠环体系,其中每个环任选被一至三个各自独立地选自 R^6 的取代基取代。这些 R^5 基团的实例包括在基团组 1 中如 U-1 至 U-88 所示的那些环或环系,只是这些环任选被各自独立地选自 R^6 而非 $(R^v)_r$ 的 1-3 个取代基取代。

为了获得更高活性和/或使合成更易于进行的缘故,优选的化合物是:

优选 1. 上述式 I 化合物,它们的 *N*-氧化物及其农业上适合的盐,其中 A 和 B 都是 O 以及 J 是任选被 1-4 个 R^5 取代的苯基。

优选 2. 优选 1 的化合物,其中

一个 R^4 基团在 2-位或 5-位与 K 环连接,以及所述 R^4 是 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基,卤素, CN, NO_2 , C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_1 - C_4 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 卤代烷基亚磺酰基或 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基;以及

每个 R^5 各自独立地是卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷基, CN, NO_2 , 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 卤代烷基磺酰基或 C_2 - C_4 烷氧基羰基;或

每个 R^5 各自独立地是苯基或 5-或 6-元杂芳环,每个环任选被各自独立地选自 R^6 的一至三个取代基取代;或

当与相邻碳原子连接时的两个 R^5 基团一起形成 $-OCF_2O-$, $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$ 。

优选3. 优选2的化合物,其中

R^3 是任选被各自独立地选自卤素, CN, OCH_3 和 $S(O)_pCH_3$ 的 1-5 个取代基取代的 C_1 - C_4 烷基;

一个 R^4 基团在 2-位与 K 环连接以及所述的 R^4 是 CH_3 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, CN 或卤素;

任选第二个 R^4 是 F, Cl, Br, I, CN 或 CF_3 ;

每个 R^5 各自独立地是卤素, 甲基, CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, OCH_2CF_3 , OCF_2CHF_2 , $S(O)_pCH_2CF_3$ 或 $S(O)_pCF_2CHF_2$; 或苯基, 吡唑, 咪唑, 三唑, 吡啶或嘧啶环, 每个环任选被各自独立地选自 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, 卤素和 CN 的一至三个取代基取代; 以及

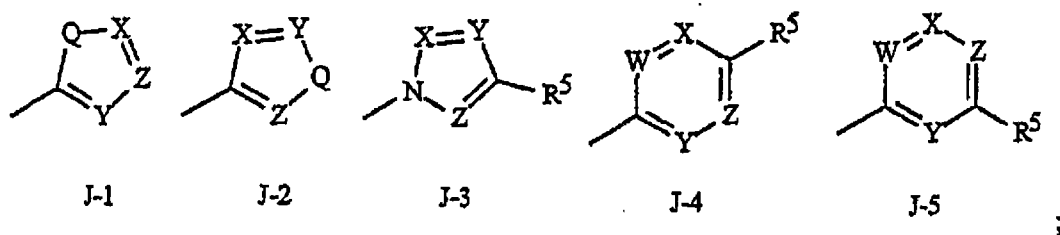
p 是 0, 1 或 2.

优选4. 优选3的化合物, 其中 R^3 是 C_1 - C_4 烷基.

优选5. 上述式 I 化合物, 它们的 N-氧化物及其农业上适合的盐, 其中

A 和 B 都是 O;

J 是选自 J-1, J-2, J-3, J-4 和 J-5 的 5-或 6-元杂芳环, 每一个 J 任选被 1-3 个各自独立地选自 R^5 的取代基取代



Q 是 O, S, NH 或 NR^5 ; 以及

W, X, Y 和 Z 各自独立地是 N, CH 或 CR^5 , 条件是 J-4 和 J-5 中至少一个 W, X, Y 或 Z 是 N.

优选6. 优选5的化合物, 其中

一个 R^4 基团在 2-位或 5-位与 K 环连接, 以及所述 R^4 是 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, 卤素, CN, NO_2 , C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_1 - C_4 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, 或 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基; 以及

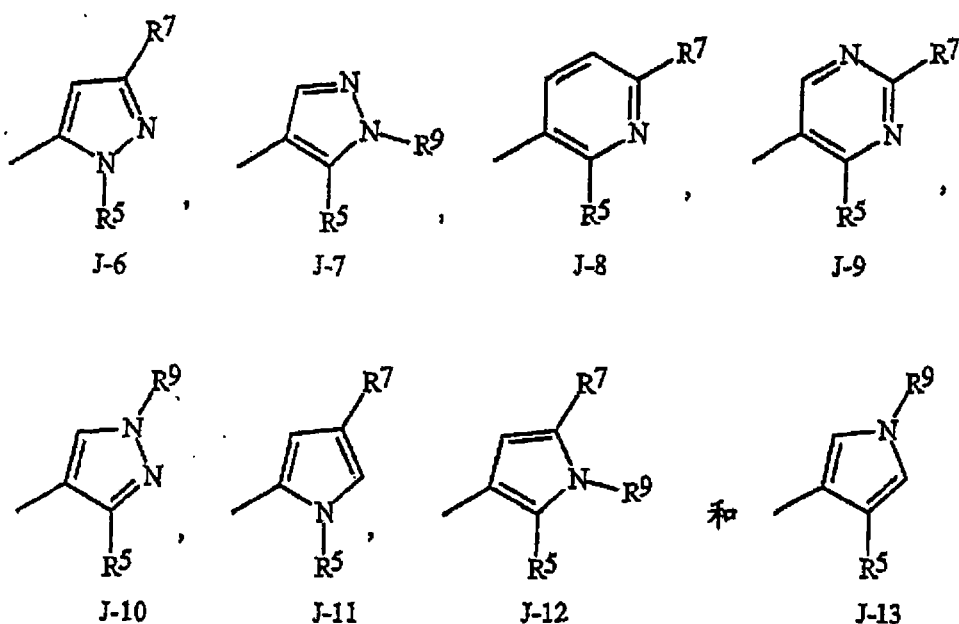
每个 R^5 各自独立地是 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, 卤

素, CN, NO₂, C₁-C₄ 卤代烷氧基, C₁-C₄ 烷硫基, C₁-C₄ 烷基亚磺酰基, C₁-C₄ 烷基磺酰基, C₁-C₄ 卤代烷硫基, C₁-C₄ 卤代烷基亚磺酰基, C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基或 C₂-C₄ 烷氧基羰基; 或

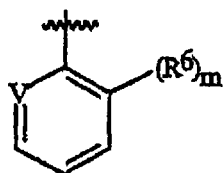
每个 R⁵ 各自独立地是苯基或 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选被各自独立地选自 R⁶ 的一至三个取代基取代。

优选 7. 优选 6 的化合物, 其中

J 选自下列基团:



R⁵ 是 C₁-C₄ 烷基, C₁-C₄ 卤代烷基, 或



V 是 N, CH, CF, CCl, CBr 或 Cl;

R⁶ 是 C₁-C₆ 烷基, C₃-C₆ 环烷基, C₁-C₄ 卤代烷基, 卤素, CN, C₁-C₄ 烷氧基, C₁-C₄ 卤代烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷硫基;

R⁷ 是 H, C₁-C₆ 烷基, C₃-C₆ 环烷基, C₁-C₄ 卤代烷基, 卤素, CN, C₁-C₄ 烷氧基, C₁-C₄ 卤代烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷硫基;

R⁹ 是 H, C₁-C₆ 烷基, C₁-C₆ 卤代烷基, C₃-C₆ 烯基, C₃-C₆ 卤代烯基, C₃-

C₆ 炔基或 C₃-C₆ 卤代炔基;条件是 R⁷ 和 R⁹ 不同时为 H;以及 m 是 0 或 1.

优选 8. 优选 7 的化合物,其中 V 是 N.

优选 9. 优选 7 的化合物,其中 V 是 CH,CF,CCl 或 CBr.

优选 10. 优选 8 或优选 9 的化合物,其中

R³ 是 H;或任选被各自独立地选自卤素,CN,OCH₃ 和 S(O)_pCH₃ 的 1-5 个取代基取代的 C₁-C₄ 烷基;

一个 R⁴ 基团在 2-位与 K 环连接以及所述的 R⁴ 是 CH₃,CF₃,OCF₃,OCHF₂,S(O)_pCF₃,S(O)_pCHF₂,CN 或卤素;

任选第二个 R⁴ 是 F,Cl,Br,I,CN 或 CF₃;

R⁶ 是 C₁-C₄ 烷基,C₁-C₄ 卤代烷基,卤素或 CN;

R⁷ 是 H,CH₃,CF₃,OCHF₂,OCH₂CF₃ 或卤素;以及

p 是 0,1 或 2.

优选 11. 优选 10 的化合物,其中 R³ 是 H 或 C₁-C₄ 烷基;以及一个 R⁴ 基团连接在 2-位以及所述 R⁴ 是 CH₃,Cl,Br 或 I.

优选 12. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-6;R⁶ 是卤素;以及 R⁷ 是卤素或 CF₃.

优选 13. 优选 12 的化合物,其中 V 是 N;R³ 是 H 或甲基,乙基,异丙基或叔丁基;以及 R⁷ 是 Br,Cl 或 CF₃.

优选 14. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-7;R⁶ 是卤素;以及 R⁹ 是 CF₃,CHF₂,CH₂CF₃ 或 CF₂CHF₂.

优选 15. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-8;R⁶ 是卤素;以及 R⁷ 是卤素或 CF₃.

优选 16. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-9;R⁶ 是卤素;以及 R⁷ 是 CF₃.

优选 17. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-10;R⁶ 是卤素;以及 R⁹ 是 CF₃,CHF₂,CH₂CF₃ 或 CF₂CHF₂.

优选 18. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-11;R⁶ 是卤素;以及 R⁷ 是卤素或 CF₃.

优选 19. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-12;R⁶ 是卤素;R⁷ 是 H,卤素或 CF₃,以及 R⁹ 是 H,CF₃,CHF₂,CH₂CF₃ 或 CF₂CHF₂.

优选 20. 优选 11 的化合物,其中 J 是 J-13;R⁶ 是卤素;R⁷ 是 H,卤素或 CF₃,以及 R⁹ 是 H,CF₃,CHF₂,CH₂CF₃ 或 CF₂CHF₂.

最优选的是选自下列的优选 13 的化合物:

6-溴-1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-2,4(1*H*,3*H*)-噻唑啉二酮,

6-溴-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-3,8-二甲基-2,4(1*H*,3*H*)-噻唑啉二酮,

6-溴-1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-3,8-二甲基-2,4(1*H*,3*H*)-噻唑啉二酮,

1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6,8-二氯-1-[[3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-6,8-二氯-2,3-二氢-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6,8-二氯-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-3-甲基-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6-氯-1-[[3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-6-氯-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6,8-二氯-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6,8-二氯-1-[[3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-3-甲基-4(1*H*)-噻唑啉酮,

1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-6,8-二氯-2,3-二氢-3-甲基-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6-氯-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6-氯-1-[[3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-3,8-二甲基-4(1*H*)-噻唑啉酮,

1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-6-氯-2,3-二氢-3,8-二甲基-4(1*H*)-噻唑啉酮,

6-氯-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-

二氢-3,8-二甲基-4(1*H*)-喹唑啉酮,

6,8-二氯-1-[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-4(1*H*)-喹唑啉酮以及

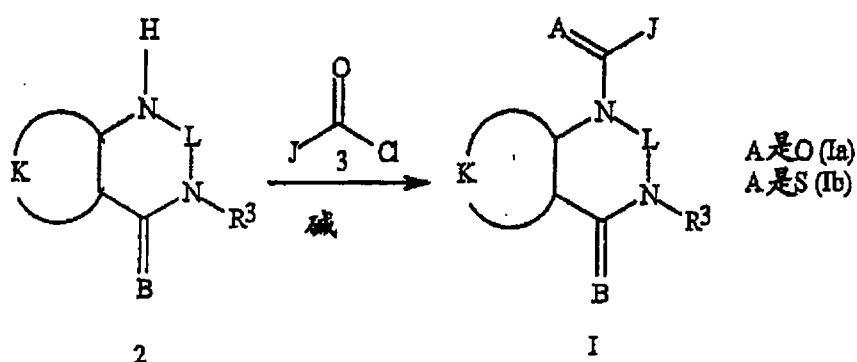
6,8-二氯-1-[[3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-4(1*H*)-喹唑啉酮。

本发明还涉及用于防治无脊椎害虫的组合物,包含生物有效量的式 I 化合物、它们的 *N*-氧化物或其适合的盐以及选自表面活性剂,固体稀释剂和液体稀释剂中的至少一种其它组分。本发明还涉及一种组合物,包含生物有效量的式 I 化合物以及有效量的至少一种其它生物活性化合物或制剂。本发明优选的组合物是包含上述优选化合物的那些组合物。

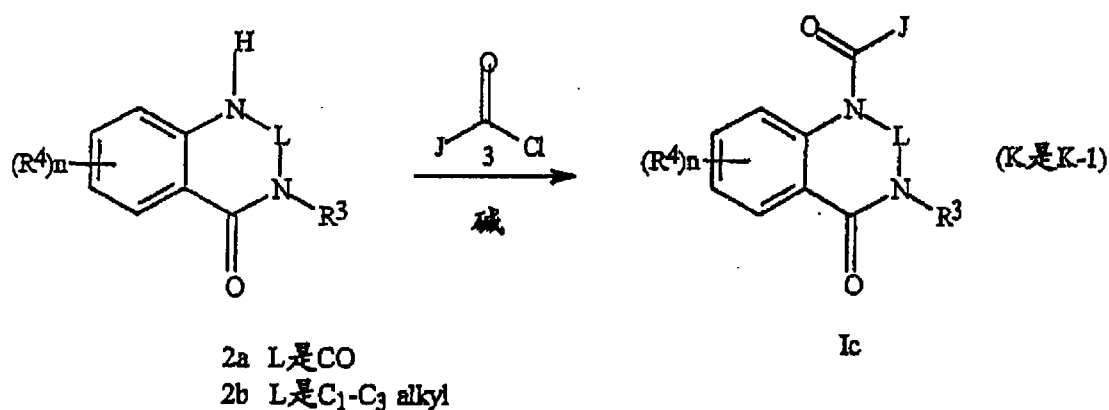
本发明还涉及防治无脊椎害虫的方法,包括将生物有效量的式 I 化合物(例如使用此处描述的组合物)与无脊椎害虫或它们的周围环境接触。本发明还涉及下述方法,其中将生物有效量的式 I 化合物或含有式 I 化合物以及生物有效量的至少一种防治无脊椎害虫的其它化合物或制剂的组合物与无脊椎害虫或它们的周围环境接触。优选应用的方法是包括上述优选化合物的那些方法。

式 I 化合物可采用如反应方案 1-11 中所述的下述一种或多种方法或变更方法进行制备。在式 I 和式 2-23 化合物中 A,B,J,K,L,R³,R⁴,R⁵ 和 n 的定义如同在发明概述部分中的定义。式 I a-I c, I f,2a-c,9a-i 和 10a-c 化合物分别是式 I,2,9 和 10 化合物的不同子集,以及式 I a-I f 中的所有取代基如上式 I 中所述定义。

如反应方案 1 所示,式 I 化合物可通过下述方法制备:存在碱的条件下将式 2 的芳基或杂芳基胺与式 3 的酰基氯反应获得式 I a 化合物。反应可以纯反应物或在各种适合的溶剂包括四氢呋喃,甲苯,二氯甲烷和氯仿中以室温至溶剂回流温度的最适温度范围内进行。反应中使用的典型的碱包括胺,如三乙胺和吡啶,碳酸盐,如碳酸钾和碳酸钠以及氢氧化物,如氢氧化钾和氢氧化钠。下一步,采用各种标准的硫转移剂,包括五硫化二磷和(2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,3-二硫杂-2,4-二磷杂丁烷(diphosphetane)-2,4-二硫化物)将式 I a 化合物转化为式 I b 化合物。

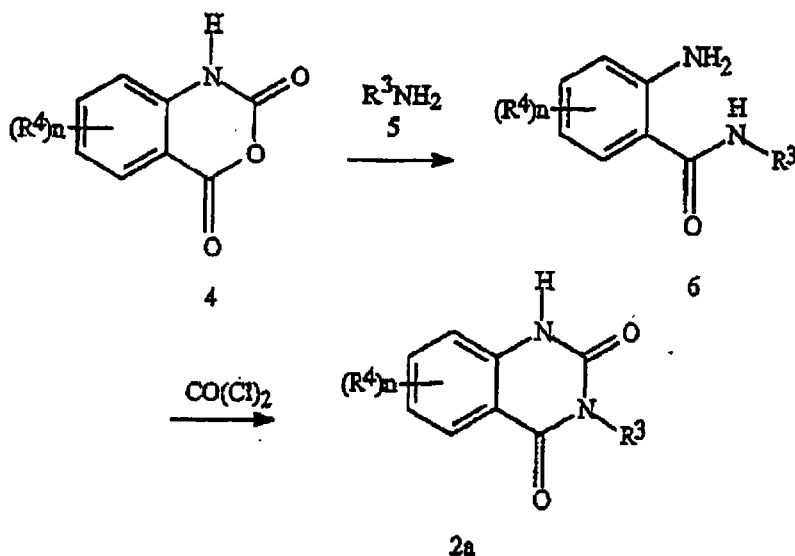
反应方案 1

式 I c 化合物(即式 I 化合物,其中 K 是 K-1)的制备方法图示于反应方案 2。式 2a 的喹唑啉二酮(其中 L 是 CO)或式 2b 的衍生物(其中 L 是任选被一至三个各自独立地选自 R^{13} 的取代基取代的 C_1 - C_3 烷基)与式 3 的酰基氯反应获得式 I c 化合物。上述方法还可用于制备其中 K 是选自 K-2 至 K-6 的式 I 化合物。

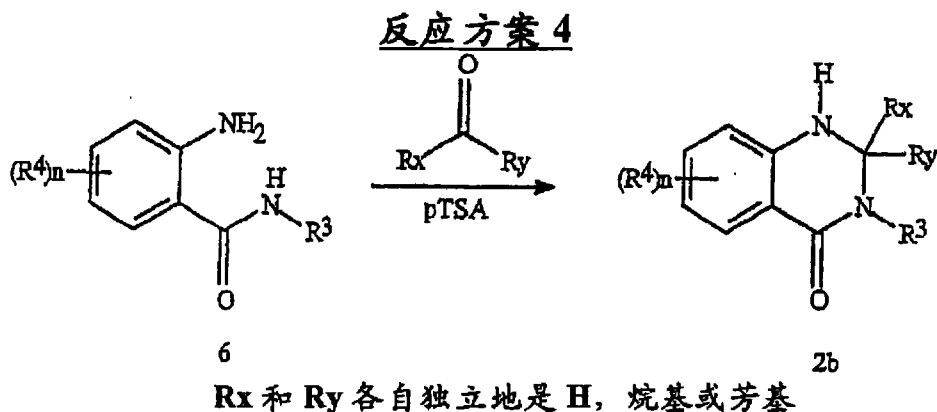
反应方案 2

如反应方案 3 所示,由已知的靛红酸酐经两步制备式 2a 化合物。第一步,以纯反应物或在适合的溶剂中将式 4 的靛红酸酐直接与式 5 的胺反应获得式 6 的酰胺。用光气或光气等效物处理式 6 的酰胺获得式 2a 的喹唑啉二酮。

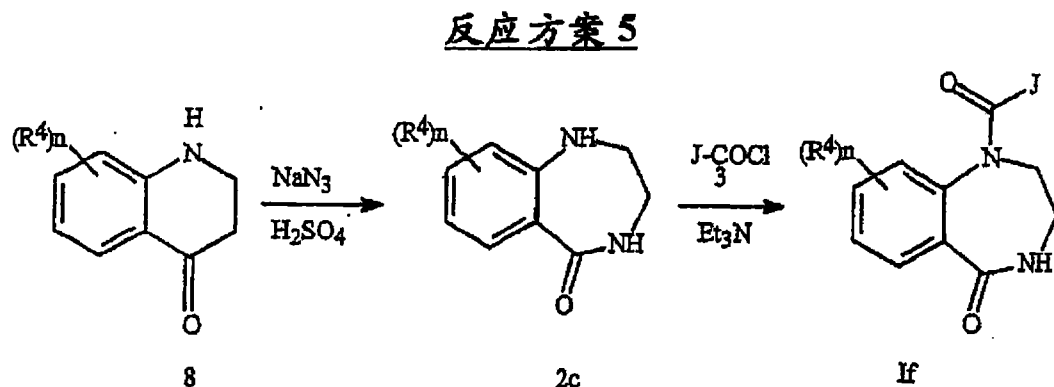
反应方案 3



如反应方案 4 所示,式 2b 化合物,其中 R_x 和 R_y 各自独立地是 H 以及 R^{13} 的子集,该化合物通常是存在酸催化剂如对甲苯磺酸(pTSA)的条件下,通过式 6 化合物与醛或酮反应而制备。通过共沸除去反应生成的水或其它干燥方法可以有利地促进反应完成。

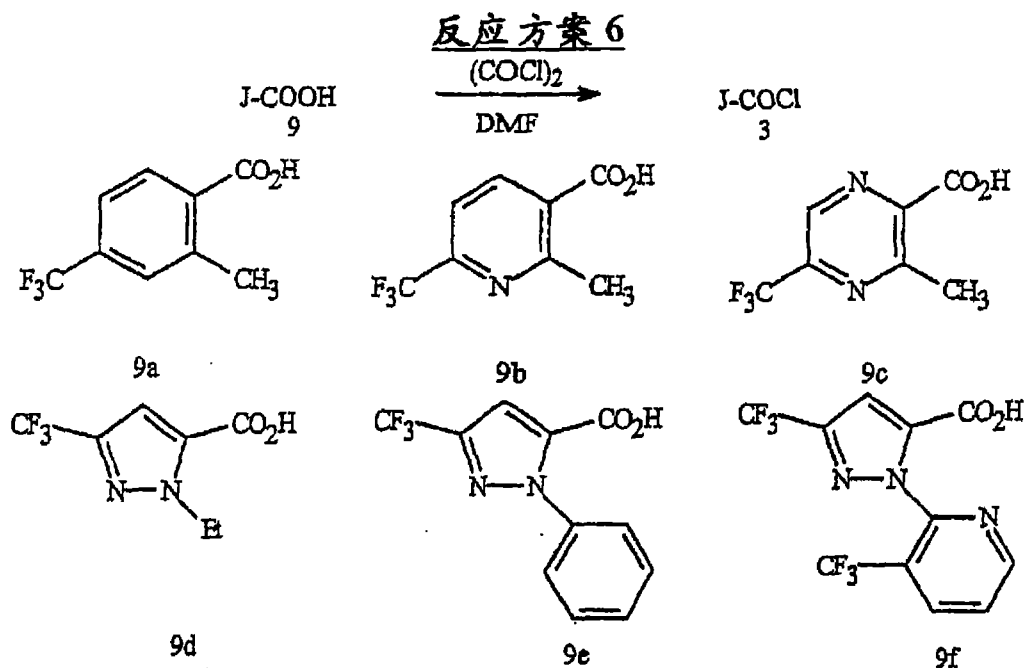


如反应方案 5 所示,式 2c 化合物可通过式 8 的四氢喹啉酮和叠氮化钠的 Schmidt 反应而制备(*J.Het.Chem.*1971,8,231-236)。存在碱,如三乙胺的条件下,将式 2c 化合物与酰基氯 3 反应获得式 If 产物。

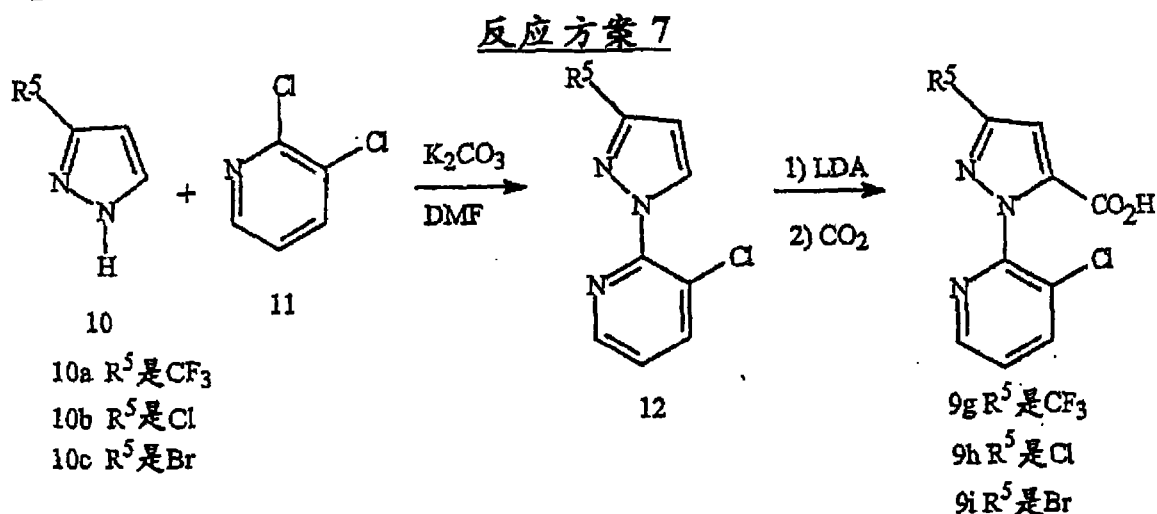


在化学文献中,式 3 的酰基氯已有许多文献证明以及通常可由对应

的式 9 的已知芳基和杂芳基羧酸获得。许多式 9 的羧酸已公开于文献中。式 9a-9f 的特别优选的酸的制备方法以及它们的衍生酰氯公开在 WO01/70671 中。

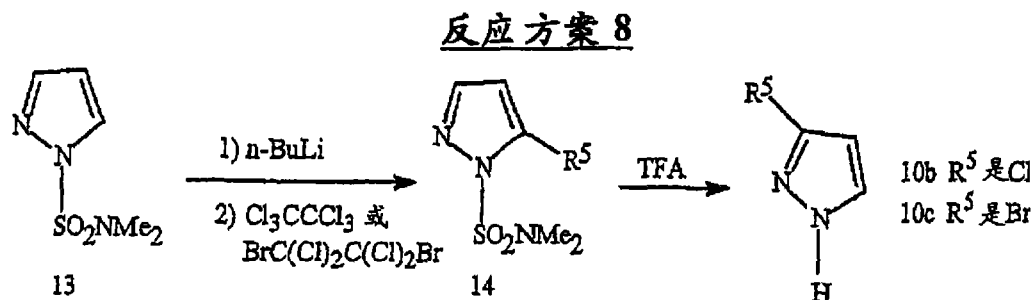


式 9g-9i 的吡啶基吡唑羧酸是式 9 的酸中特别优选的一组(反应方案 7)。式 10 的吡唑与式 11 的 2,3-二氯吡啶反应可获得高收率的具有对所需区域化学高专一性的式 12 的 1-吡啶基吡唑。将式 12 化合物用二异丙基氨基化锂(LDA)金属化,然后用二氧化碳使锂盐淬灭(quench)获得式 9g-9i 的吡唑酸。有关式 9i 的合成方法的另外详述参见实施例 1。

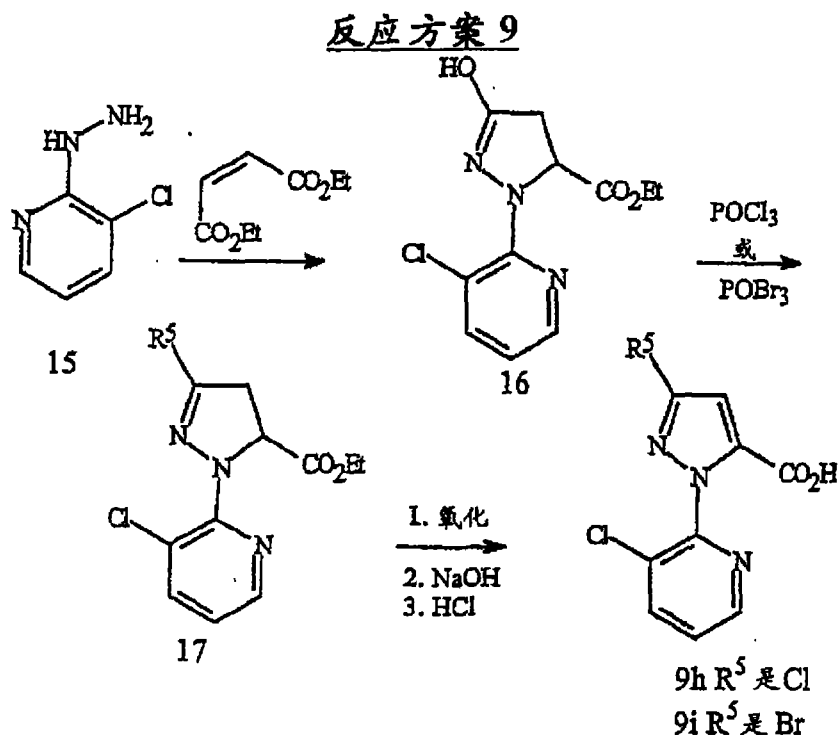


作为起始物的式 10 的吡唑是已知化合物或可根据已知方法制备。吡唑 10a 可通过文献中公开的方法(*J. Fluorine Chem.* 1991, 53(1), 61-70)制备。式 10b 和 10c 的吡唑也可以根据文献中公开的方法

(Chem.Ber.1966,99(10),3350-7)制备。10b 和 10c 的另一种有用的制备方法描述于反应方案 8 中。用正丁基锂(n-BuLi)将式 13 的氨基磺酰吡唑金属化,随后用六氯乙烷或 1,2-二溴四氯乙烷进行直接阴离子卤化获得式 14 的卤代衍生物。室温条件下用三氟乙酸(TFA)除去氨基磺酰基,然后干净地和以高收率分别获得吡唑 10b 和 10c。上述试验步骤的进一步详述记载于实施例 1 中。

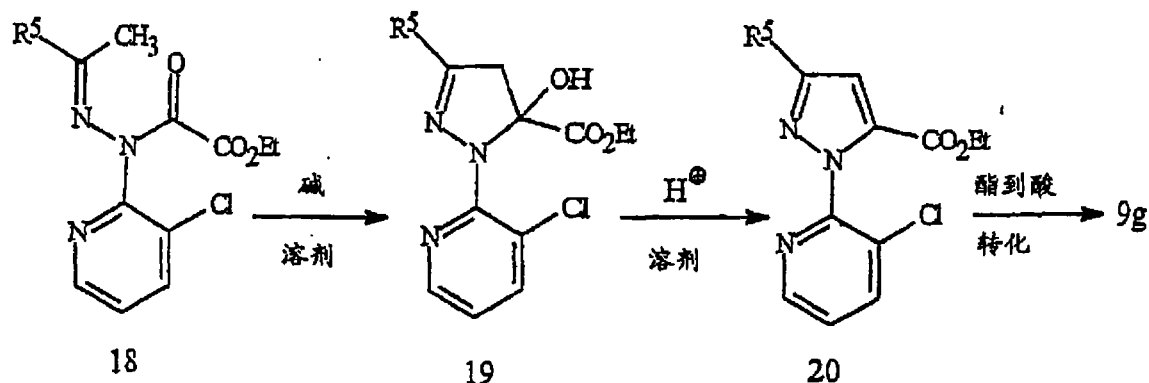


作为反应方案 7 所示方法的另一种变化,式 9h 和 9i 的吡唑羧酸可通过反应方案 9 图示的方法制备。将胍基吡啶 15 与马来酸二乙酯反应获得吡唑啉酮 16。用三氯氧化磷或三溴氧化磷氯化或溴化获得式 17 的卤代衍生物。任选存在酸的条件下将式 17 化合物氧化获得吡唑酯,然后将酯官能团转变为羧酸从而获得式 9h 或 9i 化合物。氧化剂可以是过氧化氢,有机过氧化物,过硫酸钾,过硫酸钠,过硫酸铵,单过硫酸钾(例如,Oxone®)或高锰酸钾。



作为反应方案 7 所示方法的另一种变化,其中 R^5 是 CF_3 的式 9g 的吡唑羧酸还可以通过反应方案 10 中图示的方法制备。

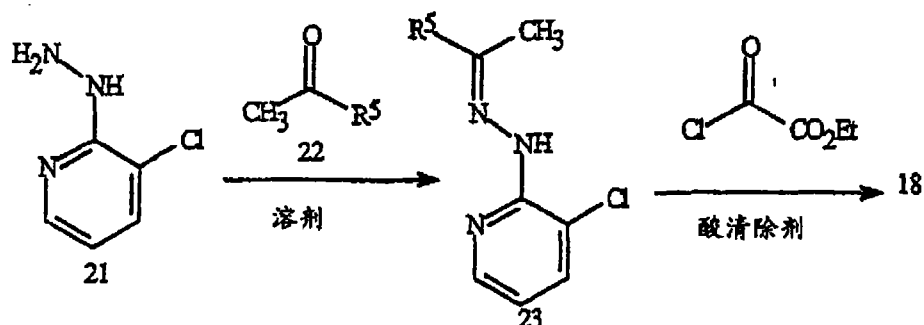
反应方案 10



在适合的有机溶剂中,将式 18 化合物与适合的碱反应,然后用酸如乙酸中和获得式 19 的环化产物。适合的碱可以是,例如氢氧化钠,叔丁醇钾,甲基亚磺酰负碳离子钠(dimethyl sulfoxide sodium)($CH_3S(O)CH_2Na^+$),碱金属(如锂,钠或钾)的碳酸盐或氢氧化物,氟化或氢氧化四烷基(如甲基,乙基或丁基)铵,或 2-叔丁基亚氨基-2-二乙氨基-1,3-二甲基-全氢化-1,3,2-diazaphosphonine。适合的有机溶剂可以是,例如丙酮,乙腈,四氢呋喃,二氯甲烷,二甲基亚砷,或 *N,N*-二甲基甲酰胺。式 19 化合物脱水获得式 20 化合物,随后将羧酸酯官能团转化为羧酸,获得式 9g 的酸。脱水是通过用催化量的适合的酸如硫酸处理而实现的。

式 18 化合物可通过反应方案 11 图示的方法制备。

反应方案 11



其中 R^5 是 CF_3 。

将式 21 的胍化合物在溶剂如水,甲醇或乙酸中用式 22 的酮处理获得式 23 的胍。在适合的有机溶剂如二氯甲烷或四氢呋喃中存在酸清除剂如三乙胺的条件下将式 23 的胍与乙基草酰氯反应获得式 18 化合物。式 21 的胍化合物可通过标准方法制备,例如将式 11 的相应的卤代

化合物与胍接触而制备。

应认识到的是,上述用于制备式 I 化合物的一些试剂和反应条件可能与中间体中存在的某些官能基团并不相容。在这些情况下,在合成过程中引入保护/脱保护程序或官能基团相互转换将有助于获得所需产物。保护基团的使用和选择对于化学合成的技术人员而言是显而易见的(参见,例如, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. 的 *Protective Groups in Organic Synthesis*(有机合成中的保护基团)第二版; Wiley: New York, 1991)。本领域技术人员将知道,在某些情况下,如在任何单独的反应方案中所描述的在引入特定试剂之后,可能需要进行另外的未加以详细描述의常规合成步骤,以完成式 I 化合物的合成。本领域技术人员还应认识到,需要时可以将上述反应方案所述步骤以介绍的特定顺序以外的顺序进行组合来制备式 I 化合物。本领域技术人员还应认识到,在此所述的式 I 化合物及中间体可以进行各种亲电,亲核,自由基,金属有机,氧化和还原反应,以加上取代基或对现有取代基进行改性。

无需进一步详述,相信利用上述描述,本领域技术人员能够在最大程度范围内应用本发明。因此,以下的实施例只应视为示例性的,并不以任何方式对发明内容进行限制。除色谱溶剂混合物或另有说明外,百分数表示重量百分数。除非另有说明,色谱溶剂混合物的份数和百分数是以体积计。¹H NMR 光谱以 ppm 表示由四甲基硅烷的低场记录得到;s 为单峰,d 为双峰,t 为三重峰,q 为四重峰,m 为多重峰,dd 为双重的双峰,dt 为双重的三重峰,br s 为宽单峰。

具体实施方式

实施例 1

6-溴-1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-基]羰基]-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-2,4(1H,3H)-喹唑啉二酮

步骤 A: 制备 3-溴-N,N-二甲基-1H-吡唑-1-磺酰胺

在-78℃,向 N-二甲基氨磺酰吡唑(44.0g,0.251mol)的无水四氢呋喃(500mL)溶液中逐滴加入正丁基锂(2.5M 己烷溶液,105.5mL,0.264mol)溶液,同时保持温度低于-60℃。在加入过程中形成粘稠固体。一旦加入完成,继续保持反应混合物另外 15 分钟,15 分钟后逐滴加入 1,2-二溴-四氯乙烷(90g,0.276mol)的四氢呋喃(150mL)溶液,同时保持温度低于-70℃。反应混合物转变为透明橙色;继续搅拌再一个 15 分钟。移走-78℃浴器,用水(600mL)使反应淬灭。将反应混合物用二氯甲烷萃取(4x),用硫

酸镁干燥有机提取物并浓缩。将粗产物通过硅胶色谱进一步纯化,使用二氯甲烷/己烷(50:50)作为洗脱剂,获得目标产物,为透明无色油状物(57.04g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.07 (d,6H), 6.44 (m,1H), 7.62 (m,1H)。

步骤 B: 制备 3-溴吡唑

向三氟乙酸(70mL)中缓慢加入步骤 A 得到溴吡唑产物(57.04g)。将反应混合物在室温条件下搅拌 30 分钟,然后减压浓缩。将剩余物溶解于己烷中,滤出不溶固体,蒸发掉己烷获得油状粗产物。通过硅胶色谱将粗产物进一步纯化,使用乙酸乙酯/二氯甲烷(10:90)作为洗脱剂获得油状物。将所得油状物溶解于二氯甲烷中,用碳酸氢钠水溶液中和,二氯甲烷(3x)萃取,硫酸镁干燥并浓缩获得目标产物,白色固体(25.9g),熔点为 61-64℃。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 6.37 (d,1H), 7.59 (d,1H), 12.4 (br.s,1H)。

步骤 C: 制备 2-(3-溴-1H-吡唑-1-基)-3-氯吡啶

向含 2,3-二氯吡啶(27.4g,185mmol)和 3-溴吡唑(25.4g,176mmol)混合物的无水 *N,N*-二甲基甲酰胺(88mL)中加入碳酸钾(48.6g,352mmol),将反应混合物加热至 125℃ 并保持 18 小时。将反应混合物冷却至室温,然后倾入冰水(800mL)中。生成沉淀。将沉淀的固体搅拌 1.5 小时,过滤,用水洗涤(2x100mL)。将固体滤饼溶解在二氯甲烷中,依次用水,1N 盐酸,饱和碳酸氢钠水溶液和盐水洗涤。然后将有机提取物用硫酸镁干燥并浓缩获得 39.9g 粉红色固体。将粗固体产物悬浮于己烷中,剧烈搅拌 1 小时。将固体过滤,用己烷洗涤并干燥获得目标产物,灰白色粉末(30.4g),通过 NMR 测定纯度为>94%。该产物可直接用于步骤 D,而无需进一步纯化。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 6.52 (s,1H), 7.30 (dd,1H), 7.92 (d,1H), 8.05 (s,1H), 8.43 (d,1H)。

步骤 D: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧酸

在-76℃,向步骤 C 获得的吡唑产物(30.4g,118mmol)的无水四氢呋喃(250mL)溶液中逐滴加入二异丙基氨基化锂(118mmol)四氢呋喃溶液,控制滴加的速度以保持温度低于-71℃。在-76℃,将反应混合物搅拌 15 分钟,然后向其中鼓入二氧化碳 10 分钟,使之升温至-57℃。使反应混合物升温至-20℃并用水淬灭反应。浓缩反应混合物,然后溶解在水(1L)和醚

(500mL)中,然后加入氢氧化钠水溶液(1N,20mL)。将水相提取物用乙醚洗涤并用盐酸酸化。滤出沉淀的固体,用水洗涤并干燥获得目标产物,棕黄色固体(27.7g)(由类似方法的另一试验获得的产物的熔点为 200-201 °C)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6) δ 7.25 (s,1H), 7.68 (dd,1H), 8.24 (d,1H), 8.56 (d,1H).

步骤 E: 制备 6-溴-8-甲基-2H-3,1-苯并噁嗪-2,4(1H)-二酮

向 8-甲基-2H-3,1-苯并噁嗪-2,4(1H)-二酮(10.0g,56.5mmol)和碘化钾(0.36g,1.8mmol)的氯磺酸(12mL)溶液中加入溴(4.6g,28.7mmol),然后室温条件下将反应搅拌过夜。然后将反应物缓慢倾入冰水,加入碳酸氢钠粉末中和至 pH 为 7。滤出固体,用水洗涤,获得所需的中间体,白色固体(11.4g)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO) δ 2.34 (s,3H), 7.76 (m,3H), 7.85 (m,1H), 11.21 (s,1H).

步骤 F: 制备 2-氨基-5-溴-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺

向步骤 E 获得的苯并噁嗪二酮(4.0g,15.56mmol)的吡啶(20mL)悬浮液中加入异丙胺(1.2g,20.23mmol),将反应加热至回流温度并保持 2 小时。然后将反应冷却,在旋转蒸发器上由甲苯浓缩,然后真空干燥获得固体(5.01g)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO) δ 1.29 (d,6H), 2.15 (s,3H), 4.25 (m,1H), 5.75 (m,1H), 7.24 (m,1H), 7.27 (m,1H).

步骤 G: 制备 6-溴-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-2,4(1H,3H)-噻唑啉二酮

向由步骤 F 获得的邻氨基苯甲酰胺(1.11g,4.1mmol)的二噁烷(20mL)溶液中加入 2.0M 光气甲苯(2.3mL,4.6mmol)溶液。室温条件下将反应搅拌 1 小时,然后加热至回流并保持 4 小时,然后冷却至室温。滤出白色固体并干燥获得目标化合物(0.89g)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO) δ 1.43 (d,6H), 2.34 (s,3H), 5.12 (m,1H), 7.67 (s,1H), 7.85 (s,1H).

步骤 H: 制备 6-溴-1-[[3-溴-1-(3-氨基-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-基]羰基]-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-2,4(1H,3H)-噻唑啉二酮

向步骤 G 获得的噻唑啉二酮(245mg,0.825mmol)的二甲基甲酰胺(5mL)溶液中加入氯化钠(60%油分散体,36mg,0.90mmol),然后将反应在室温条件下进行搅拌。在分开的另一个含有步骤 D 的吡唑酸(500mg,1.65mmol)二氯甲烷(10mL)溶液的反应烧瓶中加入草酰氯(0.17mL,1.95mmol)和一滴 DMF。将上述混合物搅拌 2 小时,然后在真空

条件下浓缩并放置。将酰氯分成两等份。将两份中的一份溶解在 5mL DMF 中,并将其加入喹唑啉二酮/NaH 反应混合物中,将所得混合物室温下搅拌 3 小时。将反应物在乙酸乙酯和水之间分配,用水洗涤两次,再用盐水洗涤,硫酸钠干燥。将粗产物通过硅胶色谱纯化,使用 99:1 氯仿/丙酮作为洗脱剂,获得目标化合物,即本发明化合物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.47 (d,6H), 2.17 (s,3H), 5.08 (m,1H), 7.12 (s,1H), 7.39 (dd,1H), 7.54 (d,1H), 7.91 (dd,1H), 8.17 (d,1H), 8.34 (dd,1H).

实施例 2

制备 1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1H)-喹唑啉酮

步骤 A: 制备 2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1H)-喹唑啉酮

向 2-氨基-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺(0.5g,2.6mmol)乙醇(10mL)溶液中加入低聚甲醛(78mg,2.6mmol)和对甲苯磺酸(18mg,95 μmol),将混合物在回流条件下加热直至变为澄清(约 4 小时)。减压除去溶剂获得目标化合物(纯度 95%),无需进一步纯化将其用于下一步。

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.9-7.8 (d,1H), 7.2-7.1 (d,1H), 6.83 (t,1H), 4.97 (m,1H), 4.57 (s,2H), 2.17 (s,3H), 1.22 (d,6H).

步骤 B: 制备 1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1H)-喹唑啉酮

向 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧酸(787mg,2.45mmol)(即实施例 1 步骤 D 的产物)的二氯甲烷(10mL)溶液中加入二甲基甲酰胺(20 μL)和草酰氯(235 μL)。将混合物搅拌 1 小时,此时溶液已变为澄清。减压除去挥发性物质后,将剩余物溶解在二氯甲烷(5mL)中,将溶液的一半加入含步骤 A 产物(0.25g,1.2mmol)与吡啶(148 μL ,1.8mmol)混合物的二氯甲烷(10mL)中。室温搅拌过夜后,加入载于有 2% DVB(1g)的交联聚苯乙烯(Fluka Chemie AG catalog number 90603)的 1,5,7-三氮杂二环[4.4.0]癸-5-烯,将混合物搅拌另一个 15 分钟。然后将混合物过滤并减压浓缩。所得剩余物通过硅胶色谱纯化获得目标化合物,即本发明化合物,白色固体(0.18g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.3 (m,1H), 7.9-7.8 (m,2H), 7.4-7.3 (m,3H), 6.0-5.9 (s,1H), 5.9 (d,1H), 5.0-4.8 (m,1H), 4.4-4.3 (d,1H), 2.10 (s,3H), 1.3-1.1 (m,6H).

下述实施例 3 举例说明了 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-羧酸的另一种制备方法,该化合物可通过实施例 1 和 2 中所述步骤用于制备,例如 6-溴-1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-2,4(1*H*,3*H*)-喹唑啉二酮和 1-[[3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-基]羰基]-2,3-二氢-8-甲基-3-(1-甲基乙基)-4(1*H*)-喹唑啉酮。

实施例 3

制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-羧酸

步骤 A: 制备 2-(3-氯-2-吡啶基)-5-氧代-3-吡唑烷羧酸乙酯

向配有机械搅拌器,温度计,加料漏斗,回流冷凝器和氮气入口的 2-L 四颈口烧瓶中加入无水乙醇(250mL)和乙醇钠的乙醇溶液(21%,190mL,0.504mol)。将混合物加热至约 83℃的回流温度。然后用 3-氯-2(1*H*)-吡啶酮脒(68.0g,0.474mol)处理。将混合物经 5 分钟时间再次加热至回流。然后将黄色浆液用马来酸二乙酯(88.0mL,0.544mol)经 5 分钟时间逐滴处理。滴加过程中回流速率显著增加。滴加结束后,起始物全部溶解。将所得橙红色溶液在回流条件下保持 10 分钟。冷却至 65℃后,将反应混合物用冰醋酸(50.0mL,0.873mol)处理。生成沉淀。将混合物用水(650mL)稀释,使沉淀溶解。将橙色溶液在冰浴中冷却。产物在 28℃时开始沉淀。将浆液在约 2℃保持 2 小时。通过过滤分离产物,用乙醇水溶液(40%,3x50mL)洗涤,然后在过滤器中风干约 1 小时。获得高度结晶的浅橙色粉末的目标产物化合物(70.3g,55%的收率)。¹H NMR 检测没有明显的杂质。

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 1.22 (t, 3H), 2.35 (d, 1H), 2.91 (dd, 1H), 4.20 (q, 2H), 4.84 (d, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.92 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 10.18 (s, 1H)。

步骤 B: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-4,5-二氢-1*H*-吡唑-5-羧酸乙酯

向配有机械搅拌器,温度计,回流冷凝器和氮气入口的 1-L 四颈口烧瓶中加入乙腈(400mL),2-(3-氯-2-吡啶基)-5-氧代-3-吡唑烷羧酸乙酯(即步骤 A 的产物)(50.0g,0.185mol)和三溴氧化磷(34.0g,0.119mol)。将橙色浆液经 20 分钟时间加热至 83℃回流。将所得混浊的,橙色溶液保持回流 75 分钟,此后生成浓的,褐色,结晶状沉淀。然后用蒸馏头取代回流冷凝器,收集混浊的无色馏出液(300mL)。向第二个配有机械搅拌器的 1-L 四颈口烧瓶中加入碳酸氢钠(45g,0.54mol)和水(200mL)。将浓缩的反应混合物经 5 分钟时间加入碳酸氢钠浆料中。将所得两相混合物剧烈搅

拌 5 分钟,此时已停止气体放出。用二氯甲烷(200mL)稀释混合物,然后搅拌 75 分钟。将混合物用 5g Celite®545 硅藻土助滤剂处理,然后过滤除去褐色,焦油状物质。将滤液转移至分液漏斗。分离褐色有机层(400mL),然后用硫酸镁(15g)和 Darco®G60 活性炭(2.0g)处理。将所得浆液磁力搅拌 15 分钟,然后过滤除去硫酸镁和活性炭。将绿色滤液用硅胶(3g)处理并搅拌几分钟。通过过滤除去深蓝绿色硅胶,将滤液通过旋转蒸发器浓缩。产物是浅琥珀色油(58.6g,95%收率),静置结晶。通过 ^1H NMR 仅有的可观测的杂质是 0.3% 乙腈。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 1.15 (t, 3H), 3.29 (dd, 1H), 3.60 (dd, 1H), 4.11 (q, 2H), 5.20 (dd, 1H), 6.99 (dd, 1H), 7.84 (d, 1H), 8.12 (d, 1H)。

步骤 C: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧酸乙酯

向配有机械搅拌器,温度计,回流冷凝器和氮气入口的 1-L 四颈口烧瓶中加入 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-4,5-二氢-1H-吡唑-5-羧酸乙酯(即步骤 B 的产物)(40.2g,0.121mol), 乙腈 (300mL) 和 硫酸 (98%,13.0mL,0.245mol)。加入硫酸后混合物由 22℃ 自加热至 36℃。搅拌几分钟后,将混合物用过硫酸钾(48.0g,0.178mol)处理。将浆液加热至回流,在 84℃ 保持 2 小时。当所得橙色浆液还温热(50-65℃)时过滤除去白色沉淀。将滤饼用乙腈(2 x 50mL)洗涤。通过旋转蒸发器将滤液浓缩至约 200mL。向第二个配有机械搅拌器的 1-L 四颈口烧瓶中加入水(400mL)。将浓缩的反应物料在约 5 分钟时间内加入水中。通过过滤分离产物,依次用乙腈水溶液(20%,100mL)和水(75mL)洗涤,然后过滤器上风干 1 小时。产物是结晶的,橙色粉末(36.6g,90%收率)。通过 ^1H NMR 仅有的可观测的杂质是约 1% 的未知物质和 0.5% 的乙腈。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 1.09 (t, 3H), 4.16 (q, 2H), 7.35 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 8.39 (d, 1H), 8.59 (d, 1H)。

步骤 D: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧酸

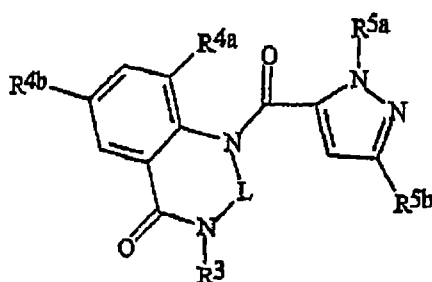
向配有机械搅拌器,温度计和氮气入口的 300-mL 四颈烧瓶中加入 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧酸乙酯(即步骤 C 的产物)(纯度 98.5%,25.0g,0.0756mol), 甲醇 (75mL), 水 (50mL) 和 氢氧化钠片 (3.30g,0.0825mol)。加入氢氧化钠后混合物由 29℃ 自加热至 34℃ 并且起始物开始溶解。室温条件下搅拌 90 分钟后,起始物则全部溶解。通过旋转蒸发器将所得深橙色溶液浓缩至约 90mL。然后将浓缩的反应混合物

用水(160mL)稀释。用乙醚(100mL)萃取水溶液。然后将水层转移至装有磁力搅拌器的 500-mL 锥形瓶中。在约 10 分钟内用浓盐酸(8.50g,0.0839mol)逐滴处理溶液。通过过滤分离产物,用水(2 x 40mL)重新浆化,用水(25mL)覆盖洗涤一次(cover washed once),然后过滤器中风干 2 小时。产物是结晶状,褐色粉末(20.9g,91%收率)。通过 ^1H NMR 仅有的可观测的杂质是约 0.8%的未知物质和 0.7%的乙醚。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 7.25 (s, 1H), 13.95 (br s, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.25 (d, 1H), 7.68 (dd, 1H).

通过在此叙述的方法与本技术领域已知的方法可制备表 1-10 的下述化合物。在表中采用的缩写如下:t 为叔,s 为仲,n 为正,i 为异,c 为环,Me 为甲基,Et 为乙基,Pr 为丙基,i-Pr 为异丙基,Bu 为丁基和 t-Bu 为叔丁基。

表1



L是C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L是C=O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

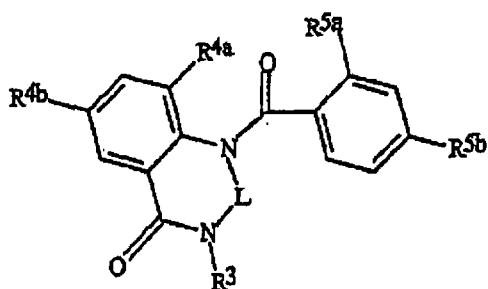
L是CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

表 2



					L是C=O									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

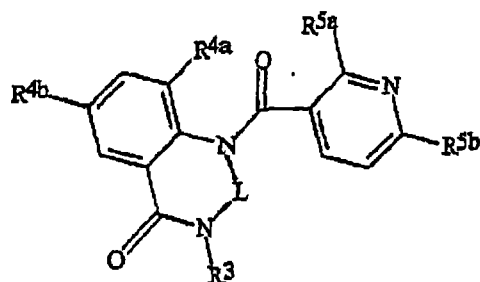
L是C=O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L是CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

表 3



					L是C=O									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂

L是O—O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

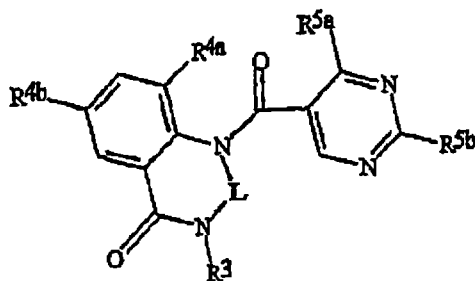
L是CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂

					L 是 CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

表 4



					L 是 C=O									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂

L是C=O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

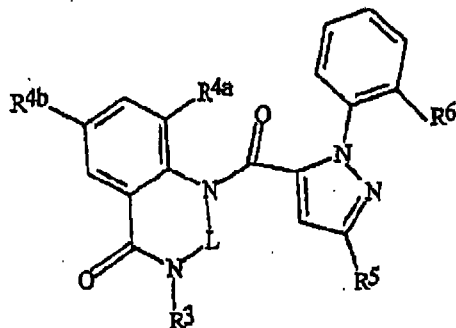
L是CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

					L是CH ₂ CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂

L是CH ₂ CH ₂					L是CH ₂ CH ₂					L是CH ₂ CH ₂				
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

表 5



L是C=O					L是C=O					L是C=O				
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl

L是C=O														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

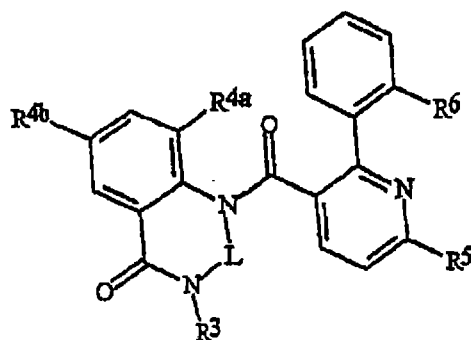
L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl

L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

表 6



L是C=O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl

L是C=O														
R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

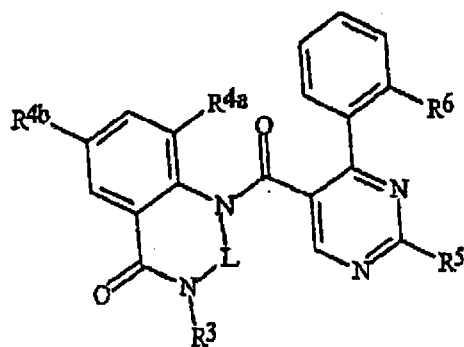
L是CH ₂														
R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl

L是CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

表 7



L是C=O														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl

L是C=O

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH₂

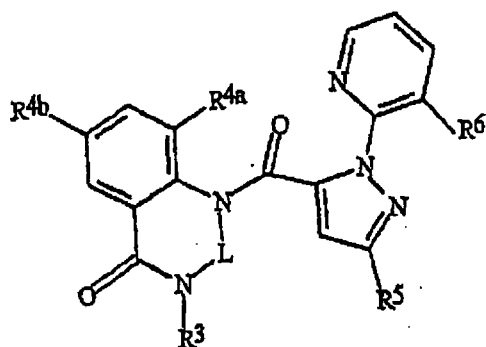
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl

L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

表 8



L是O=O														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl

L是O-O														
R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

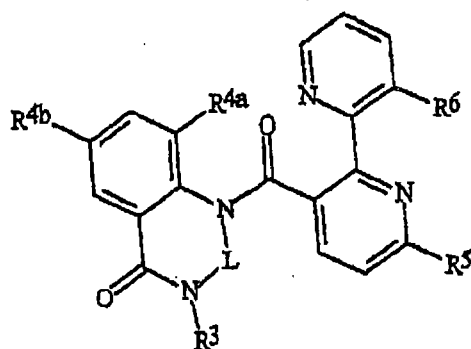
L是CH ₂														
R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl

L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl
H	Me	CN	CF ₃	Cl	H	Me	CN	Cl	Cl	H	Me	CN	Br	Cl
Me	Me	CN	CF ₃	Cl	Me	Me	CN	Cl	Cl	Me	Me	CN	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	CN	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Br	Cl
H	Me	CN	CF ₃	F	H	Me	CN	Cl	F	H	Me	CN	Br	F
Me	Me	CN	CF ₃	F	Me	Me	CN	Cl	F	Me	Me	CN	Br	F
<i>i</i> -Pr	Me	CN	CF ₃	F	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Cl	F	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Br	F
H	Br	F	CF ₃	Cl	H	Br	F	Cl	Cl	H	Br	F	Br	Cl
Me	Br	F	CF ₃	Cl	Me	Br	F	Cl	Cl	Me	Br	F	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Br	F	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	F	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	F	Br	Cl
H	Br	F	CF ₃	F	H	Br	F	Cl	F	H	Br	F	Br	F
Me	Br	F	CF ₃	F	Me	Br	F	Cl	F	Me	Br	F	Br	F
<i>i</i> -Pr	Br	F	CF ₃	F	<i>i</i> -Pr	Br	F	Cl	F	<i>i</i> -Pr	Br	F	Br	F

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl

					L是CH ₂ CH ₂									
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

表 9



L是C=O

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl

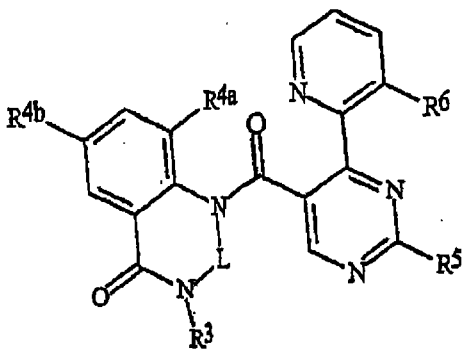
L是C=O														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl

L是CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH ₂ CH ₂														
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

表 10



L是C=O

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl

L是C=O

R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L是CH₂

R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^5	R^6
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl

					L 是 CH ₂									
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

					L 是 CH ₂ CH ₂									
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁶</u>
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

剂型/应用

本发明化合物一般与农业上适宜的载体一起制成剂型或组合物来应用,适宜的载体包括至少一种液体稀释剂,固体稀释剂或表面活性剂。剂型或组合物成分的选择应与有效成分的物理性质,应用方式和环境因素例如土壤类型,湿度和温度相一致。有效的剂型包括液体制剂,如溶液(包括乳油),悬浮剂,乳剂(包括微乳剂和/或悬浮乳剂)等,这些剂型可任选增稠为凝胶。有效的制剂还包括固体剂型如粉剂,细粉剂,颗粒剂,丸剂,片剂,薄雾剂(film)等,这些剂型可以是水分散性的(“可润湿的”)或水溶性的。活性成分可被(微)胶囊化,再制成悬浮剂或固体剂型;另外包括活性成分的全部制剂成分可加工成胶囊(或“包衣”)。制成胶囊后可控制或延缓释放活性成分。可喷雾剂型可通过适合的介质增溶并以每公顷大约一百至几百升的喷雾体积量使用。高浓度组合物主要用于进一步加工制剂的中间制剂。

各剂型通常含有下述大致范围内的有效量的活性成分,稀释剂和表面活性剂,加至 100%重量。

	<u>重量百分数</u>		
	<u>活性成分</u>	<u>稀释剂</u>	<u>表面活性剂</u>
水分散性和水溶性	5-90	0-94	1-15
颗粒剂,片剂和细粉剂			
悬浮剂,乳剂,溶液	5-50	40-95	0-15
(包括乳油)			
粉剂	1-25	70-99	0-5
颗粒剂和丸剂	0.01-99	5-99,99	0-15
高浓度组合物	90-99	0-10	0-2

通用的固体稀释剂公开在下列文献中:Watkins 等,*Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 第 2 版, Dorland Books, Caldwell, New Jersey。通用的液体稀释剂公开在下列文献中: Marsden, *Solvents Guide*, 第 2 版, Interscience, New York, 1950。McCutcheon's *Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, 以及 Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, 两篇文献中列出了表面活性剂及其推荐应用。所有剂型都可含有少量的添加

剂以减少泡沫,结块,腐蚀,微生物生长等,或加入增稠剂以提高粘度。

表面活性剂包括,例如,聚乙氧基化醇,聚乙氧基化烷基酚,聚乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯,磺化丁二酸二烷基酯,硫酸烷基酯,烷基苯磺酸盐,有机硅氧烷,*N,N*-二烷基牛磺酸酯,木质素磺酸盐,萘磺酸盐甲醛缩合物,聚羧酸酯以及聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物。固体稀释剂包括,例如,粘土如膨润土,蒙脱石,硅镁土和高岭土,淀粉,糖,二氧化硅,滑石,硅藻土,尿素,碳酸钙,碳酸钠和碳酸氢钠,以及硫酸钠。液体稀释剂包括,例如,水,*N,N*-二甲基甲酰胺,二甲基亚砷,*N*-烷基吡咯烷酮,乙二醇,聚丙二醇,石蜡,烷基苯,烷基萘,橄榄油,蓖麻油,亚麻籽油,桐油,芝麻油,玉米油,花生油,棉籽油,大豆油,菜籽油和椰子油,脂肪酸酯,酮,如环己酮,2-庚酮,异佛尔酮和 4-羟基-4-甲基-2-戊酮,以及醇如甲醇,环己醇,癸醇和四氢糠醇。

溶液剂型,包括乳油,可通过简单地混和各组分来制备。粉剂和细粉剂可通过混和并通常在锤磨机或气流粉碎机中研磨而制备。悬浮剂通常通过湿磨来制备;参见,例如,U.S.3,060,084。颗粒剂和丸剂可通过将活性成分喷雾至预制的颗粒载体上或通过造粒技术而制备。参见 Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 1967 年 12 月 4 日, 第 147-48 页, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 页及以下以及 PCT 申请, 公开号 WO91/13546。丸剂可通过如 U.S.4,172,714 中所述方法制备。水分散性和水溶性颗粒剂可通过 U.S.4,144,050, U.S.3,920,442 和 DE3,246,493 中教导的方法制备。片剂可通过 U.S.5,180,587, U.S.5,232,701 和 U.S.5,208,030 中所述方法制备。薄雾剂可通过 GB2,095,558 和 U.S.3,299,566 中教导的方法制备。

有关剂型加工工艺的更多信息,参见 T.S.Woods, "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T.Brooks and T.R.Roberts, Eds., *Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry*, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp.120-133. 还可参见 U.S.3,235,361, 第 6 栏, 第 16 行至第 7 栏第 19 行以及实施例 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行以及实施例1-4;Klingman,*Weed Control as a Science*,John Wiley and Sons,Inc.,New York,1961,pp81-96;以及 Hance 等,*Weed Control Handbook*,第8版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1989.

在以下实施例中,所有百分数均以重量计,所有剂型都是通过常规方法制备的。化合物序号参见索引表A中的化合物。

实施例 A

可湿性粉剂

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

实施例 B

颗粒剂

化合物 1	10.0%
硅镁土颗粒(低挥发物, 0.71/0.30mm;U.S.S.No.25-50 筛)	90.0%

实施例 C

挤出丸剂

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

实施例 D

乳油

化合物 1	20.0%
油溶性磺酸盐和 聚氧乙烯醚的混合物	10.0%
异佛尔酮	70.0%

实施例 E

颗粒剂

化合物 1	0.5%
纤维素	2.5%
乳糖	4.0%
玉米粉	93.0%

本发明的化合物具有良好的代谢性和/或土壤残留模式,并对农业和非农业无脊椎害虫表现出杀虫活性。(本说明书上下文中“无脊椎害虫防治”指抑制无脊椎害虫的生长发育(包括死亡),由此显著降低害虫所引起的取食或其它的伤害或损害;相关的表述具有类似的定义。)关于本说明书中,术语“无脊椎害虫”包括重要的经济害虫节肢动物、腹足类动物和线虫。术语“节肢动物”包括昆虫、螨、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足虫、鼠妇和综合纲害虫。术语“腹足类动物”包括蜗牛、蛞蝓和其它的有柱腹足目动物。术语“线虫”包括所有的蠕虫如蛔虫、犬恶丝虫和食植物线虫(线虫纲)、吸虫(Tematoda)、棘头虫纲和绦虫(真绦虫亚纲)。本领域技术人员可以理解不是所有的化合物对所有的害虫都是等效的。本发明化合物对经济上重要的农业和非农业害虫均表现出杀虫活性。术语“农业”是指农作物如食物和纤维的生产,包括下列作物的生长:禾谷类作物(例如,小麦,燕麦,大麦,黑麦,水稻,玉米),大豆,蔬菜作物(例如,莴苣,甘蓝,番茄,菜豆),马铃薯,甘薯,葡萄,棉花和木本果树(例如仁果类水果,核果类水果和柑橘类水果)。术语“非农业”是指其它园艺领域(例如,非生长于田间的森林,温室,苗圃或观赏植物),公共(人)和动物保健,家用和商用住宅,家庭以及贮存产品应用或仓储害虫。考虑到无脊椎害虫的防治谱以及经济重要性,本发明的优选实施方案是通过防治无脊椎害虫以保护下述农业作物:棉花,玉米,大豆,水稻,蔬菜作物,马铃薯,甘薯,葡萄和木本果树(免受无脊椎害虫的损伤或伤害)。农业或非农业害虫包括鳞翅目幼虫,如属于夜蛾科(例如草地粘虫(*Spodoptera fugiperda* J.E.Smith)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner)、小地老虎(*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner)、烟夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius))的粘虫,地老虎,尺蠖和 heliothines 类型的幼虫;螟蛾科(例如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis* Hübner)、脐橙虫(*Amyelois transitella* Walker)、玉米根网螟(*Crambus caliginosellus*

Clemens)、草坪网螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker))的钻心虫、鞘蛾幼虫、结网毛虫、锥虫(coneworm)、甘蓝叶害虫和雕叶虫类型的幼虫;卷叶蛾科(例如苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)、葡萄小卷蛾(*Endopiza viteana* Clemens)、梨小食心虫(*Grapholita molesta* Busck))中的卷叶蛾、芽虫、取食种子和取食果实的幼虫;以及许多其他经济上重要的鳞翅目害虫(如小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders)、卷叶蛾(*Lymantria dispar* Linnaeus));蜚蠊目的若虫和成虫,包括小蠊科和蜚蠊科中的蟑螂(例如东方蜚蠊(*Blatta orientalis* Linnaeus)、亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai* Mizukubo)、德国小蠊(*Blattella germanica* Linnaeus)、长须蜚蠊(*Supella longipalpa* Fabricius)、美洲大蠊(*Periplaneta americana* Linnaeus)、褐色大蠊(*Periplaneta brunnea* Burmeister)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae* Fabricius));鞘翅目的食叶幼虫和成虫,包括长角象虫科、豆象科和象甲科的象鼻虫(例如棉象甲(*Anthonomus grandis* Boheman)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、谷象(*Sitophilus granarius* Linnaeus)、稻二点象甲(*Sitophilus oryzae* Linnaeus));叶甲科(例如马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata* Say)、玉米幼芽根叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte))中的喜跳甲、黄守瓜、食根虫、金花虫、马铃薯甲虫和潜叶虫;金龟子科的金龟子和其他甲虫(例如日本弧丽金龟(*Popillia japonica* Newman)和欧洲金龟(*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky));皮蠹科的红缘皮蠹;叩头虫科的切根虫;棘胫小蠹科的小蠹虫和拟步行虫科的面粉甲虫。此外,它还包括:革翅目的幼虫和成虫,包括球蝮科的蝮蝮(例如欧洲球蝮(*Forficula auricularia* Linnaeus)、黑球蝮(*Chelisoches morio* Fabricius));半翅目和同翅目的若虫和成虫,例如盲蝽科的盲蝽象,蝉科的蝉,大叶蝉科的叶蝉(如微叶蝉属),蜡蝉科和飞虱科的飞虱,角蝉科的角蝉,木虱科的木虱,粉虱科的粉虱,蚜科的蚜虫,根瘤蚜科的根瘤蚜,粉蚧科的粉蚧,蚧科、盾蚧科、绵蚧科的介壳虫,网蝽科的网蝽,椿科的椿象,长椿科的长椿(例如 *Blissus* spp.)和其他实椿,沫蝉科的沫蝉,缘椿科的缘椿和红椿科的红椿和棉红椿。还包括蜉蝣目的幼虫和成虫,例如叶螨科(例如苹果全爪螨(*Panonychus ulmi* Koch)、二点叶螨(*Tetranychus urticae* Koch)、麦克旦尼氏螨(*Tetranychus mcdanieli* McGregor))的叶螨和茶红叶螨,细须螨科的扁平螨(例如柑桔短须螨

(*Brevipalpus lewisi* McGregor)), 瘿螨科的尘螨和芽螨和其他食叶螨及危害人类和动物健康的重要的螨类, 即麦皮螨科的尘螨, 脂螨科的腺囊螨, 食甜螨科的谷螨 (grain mites), 硬蜱科的羊虱 (例如鹿硬蜱 (*Ixodes scapularis* Say)、金环硬蜱 (*Ixodes holocyclus* Neumann)、美洲大蜱 (*Dermacentor variabilis* Say)、美洲花蜱 (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) 和痒螨科、蒲螨科和疥螨科的疥螨和痒螨; 直翅目的成虫和幼虫, 包括蝗虫、飞蝗和蟋蟀 (例如迁徙蚱蜢 (例如迁徙蚱蜢 *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, 长额负蝗 *M. differentialis* Thomas)、美洲蚱蜢 (例如 *Schistocerca americana* Drury)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria* Forskal)、飞蝗 (*Locusta migratoria* Linnaeus)、家蟋蟀 (*Acheta domesticus* Linnaeus)、螻蛄 (螻蛄属)); 双翅目的成虫和幼虫, 包括潜叶蝇、摇蚊、实蝇 (实蝇科)、麦杆蝇 (例如瑞典麦杆蝇 (*Oscinella frit* Linnaeus)、土蛆、家蝇 (例如 *Musca domestica* Linnaeus)、黄腹厩蝇 (例如黄腹厩蝇 *Fannia canicularis* Linnaeus、*F. femoralis* Stein)、厩蝇 (例如厩螫蝇 *Stomoxys calcitrans* Linnaeus)、秋家蝇、角蝇、飞蝇 (例如金蝇属、黑丽蝇属), 和其他蝇类害虫, 虻 (例如虻属)、狂蝇 (例如胃蝇属、狂蝇属)、皮蝇 (例如皮蝇属)、斑虻 (例如斑虻属)、羊虱蝇 (例如绵羊虱蝇 *Melophagus ovinus* Linnaeus) 和其他短角亚目害虫, 蚊虫 (例如伊蚊属、按蚊属、库蚊属)、黑蚊 (例如原蚋属、蚋属), 蠓、蚋、尖眼蕈蚊和其他长角亚目的害虫; 缨翅目的成虫和幼虫, 包括棉蓟马 (*Thrips tabaci* Lindeman) 和其他食叶蓟马; 膜翅目的害虫, 包括蚂蚁 (例如锈色大墨蚁 (*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、黑木工蚁 (*Camponotus pennsylvanicus* DeGeer)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis* Linnaeus)、小火蚁 (*Wasmannia auropunctata* Roger)、火蚁 (*Solenopsis geminata* Fabricius)、外引红火蚁 (*Solenopsis invicta* Buren)、阿根廷蚁 (*Iridomyrmex humilis* Mayr)、家褐蚁 (*Paratrechina longicornis* Latreille)、草地蚁 (*Tetramorium caespitum* Linnaeus)、玉米田蚁 (*Lasius alienus* Förster)、臭家蚁 (*Tapinoma sessile* Say)、蜂类 (包括木蜂)、大胡蜂、胡蜂和蜚蜂; 等翅目的害虫, 包括黄胸散白蚁 (*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西犀白蚁 (*Reticulitermes hesperus* Banks)、家白蚁 (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西印度干木白蚁 (*Incisitermes immigrans* Snyder) 和其他重要的经济白蚁; 弹尾目害虫例如西洋衣鱼 (*Lepisma saccharina* Linnaeus) 和家衣鱼 (*Thermobia*

domestica Packard);食毛目的害虫,包括头虱(*Pediculus humanus capitis* De Geer)、体虱(*Pediculus humanus humanus* Linnaeus)、雏鸡羽虱(*Menacanthus stramineus* Nitschz)、狗羽虱(*Trichodectes canis* De Geer)、鸡姬虱(*Goniocotes gallinae* De Geer)、羊羽虱(*Bovicola ovis* Schrank)、牛盲虱(*Haematopinus eurysternus* Nitschz)、牛颞虱(*Linognathus vituli* Linnaeus)和其他危害人和动物的刺吸和咀嚼式寄生虱类;Siphonoptera 目的害虫,包括东方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis* Rothschild)、猫栉头蚤(*Ctenocephalides felis* Bouche)、狗栉头蚤(*Ctenocephalides canis* Curtis)、禽蚤(*Ceratophyllus gallinae* Schrank)、禽冠蚤(*Echidnophaga gallinacea* Westwood)、人蚤(*Pulex irritans* Linnaeus)和其他侵害哺乳动物和鸟类的跳蚤。另外的节肢动物害虫包括:蜘蛛目的蜘蛛例如褐皮花蛛(*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik)和黑寡妇球腹蛛(*Latrodectus mactans* Fabricius),和蜘蛛形目的蜈蚣,例如家蜈蚣(*Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。对下列害虫也具有活性包括线虫纲、多节绦虫亚纲、吸虫纲和棘头虫纲包括圆线虫亚目、蛔虫目、尖尾亚目、小杆目、旋尾目和嘴刺目中的经济重要的成员,例如不局限于经济上重要的农业害虫(即根结线虫属的根结线虫、草地垫刃线虫属的草地垫刃线虫、鬃根线虫属的鬃根线虫等)以及危害动物和人类健康的害虫(即所有经济重要的吸虫、绦虫和线虫,如寄生于马的普通圆线虫、寄生于狗的犬弓首线虫、寄生于绵羊的捻转血矛线虫、寄生于狗的犬恶丝虫、寄生于马的裸头绦虫、寄生于反刍动物的肝片吸虫等)。

本发明化合物对下述害虫表现出特别高的杀虫活性:鳞翅目(例如 *Alabama argillacea* Hübner(棉叶波纹夜蛾)、*Archips argyrospila* Walker(美云杉黄卷蛾)、*A. rosana* Linnaeus(玫瑰黄卷蛾)和其他黄卷蛾种、*Chilo suppressalis* Walker(二化螟)、*Cnaphalocrosis medinalis* Guenee(稻纵卷叶蛾)、*Crambus caliginosellus* Clemens(玉米根草螟)、*Crambus teterrellus* Zincken(早熟禾草螟)、*Cydia pomonella* Linnaeus(苹蠹蛾)、*Earias insulana* Boisduval(棉斑实蛾)、*Earias vittella* Fabricius(鼎点金刚钻)、*Helicoverpa armigera* Hübner(美洲棉铃虫)、*Helicoverpa zea* Boddie(棉铃虫)、*Heliothis virescens* Fabricius(烟夜蛾)、*Herpetogramma licarsisalis* Walker(瘤蛾)、*Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller(葡萄小卷蛾)、*Pectinophora gossypiella* Saunders(棉红铃虫)、*Phyllocnistis*

citrella Stainton(桔叶潜叶蛾)、*Pieris brassicae* Linnaeus(大菜粉蝶)、*Pieris rapae* Linnaeus(菜粉蝶)、*Plutella xylostella* Linnaeus(小菜蛾)、*Spodoptera exigua* Hübner(甜菜夜蛾)、*Spodoptera litura* Fabricius(斜纹夜蛾,群)、*Spodoptera frugiperda* J.E.Smith(草地粘虫)、*Trichoplusia ni* Hübner(粉纹夜蛾)和 *Tuta absoluta* Meyrick(tomato leafminer)). 发明化合物还对同翅目下述害虫具有很高活性, 包括 *Acyrtosiphon pisum* Harris(豌豆蚜)、*Aphis craccivora* Koch(豆蚜)、*Aphis fabae* Scopoli(甜菜蚜)、*Aphis gossypii* Glover(棉蚜,瓜蚜)、*Aphis pomi* De Geer(苹果蚜)、*Aphis spiraeola* Patch(绣线菊蚜)、*Aulacorthum solani* Kaltenbach(茄沟无网蚜)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell(草莓中瘤钉毛蚜)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko(俄罗斯麦蚜)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini(苜蓿粉红劣蚜)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann(苹果绵蚜)、*Hyalopterus pruni* Geoffroy(桃粉大尾蚜)、*Lipaphis erysimi* Kaltebach(菜缢管蚜)、*Metopolophium dirrhodum* Walker(薔薇麦蚜)、*Macrosiphum euphorbiae* Thomas(马铃薯长管蚜)、*Myzus persicae* Sulzer(桃蚜)、*Nasonovia ribisnigri* Mosley(莴苣蚜)、瘿绵蚜属(根蚜和瘤蚜)、*Rhopalosiphum maidis* Fitch(玉米蚜)、*Rhopalosiphum padi* Linnaeus(粟缢管蚜)、*Schizaphis graminum* Rondani(草间梨蚜茧蜂)、*Sitobion avenae* Faricius(英国谷蚜)、*Therioaphis maculata* Buckton(苜蓿斑蚜)、*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe(茶二叉蚜)和 *Toxoptera citricida* Kirkaldy(桔二叉蚜);球蚜属;*Phylloxera devastatrix* Pergande(美核桃根瘤蚜);*Bemisia tabaci* Gennadius(棉粉虱,烟草粉虱)、*Bemisia argentifolii* Bellows & Perring(银叶粉虱)、*Dialeurodes citri* Ashmead(柑桔粉虱)和 *Trialeurodes vaporariorum* Westwood(温室白粉虱);*Empoasca fabae* Harris(蚕豆微叶蝉)、*Laodelphax striatellus* Fallen(稻灰飞虱)、*Macrolestes quadrilineatus* Forbes(六点叶蝉)、*Nephotettix cincticeps* Uhler(黑尾叶蝉)、*Nephotettix nigropictus* Stål(稻叶蝉)、*Nilaparvata lugens* Stål(稻褐飞虱)、*Peregrinus maidis* Ashmead(玉米蜡蝉)、*Sogatella furcifera* Horvath(白背稻虱)、*Sogatodes orizicola* Muir(稻飞虱)、*Typhlocyba pomaria* McAtee(草白小叶蝉)、斑叶蝉属(红斑叶蝉);*Magidada septendecim* Linnaeus(十七年蝉);*Icerya purchasi* Maskell(吹绵蚧)、*Quadraspidotus perniciosus* Comstock(梨笠圆盾

蚧); *Planococcus citri* Risso(柑桔粉蚧); 粉蚧属(其它的粉蚧类群); *Cacopsylla pyricola* Foerster(梨叶虱)、*Trioza diospyri* Ashmead(柿木虱)。这些化合物还对下述的半翅目害虫具有杀虫活性, 包括: *Acrosternum hilare* Say(喜绿蝽)、*Anasa tristis* De Geer(南瓜绿蝽)、*Blissus leucopterus leucopterus* Say(玉米长蝽)、*Corythuca gossypii* Fabricius(棉网蝽)、*Cyrtopeltis modesta* Distant(番茄盲蝽)、*Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer(棉黑翅红蝽)、*Euchistus servus* Say(褐臭蝽)、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois(一点臭蝽)、*Graptosthetus* spp.(实蝽)、*Leptoglossus corculus* Say(松子喙缘蝽)、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois(牧草盲蝽)、*Nezara viridula* Linnaeus(稻绿蝽)、*Oebalus pugnax* Fabricius(稻臭蝽)、*Oncopeltus fasciatus* Dallas(大马里筋长蝽)、*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter(棉跳盲蝽)。发明化合物可防治的其他目的害虫包括缨翅目(例如 *Frankliniella occidentalis* Pergande(苜蓿蓟马)、*Scirtothrips citri* Moulton(桔实蓟马)、*Sericothrips variabilis* Beach(黄豆蓟马)和 *Thrips tabaci* Lindeman(棉蓟马)); 和鞘翅目(例如 *Leptinotarsa decemlineata* Say(马铃薯甲虫)、*Epilachna varivestis* Mulsant(墨西哥豆瓢虫)和叩甲属、*Athous* 或金针虫属的切根虫)。

本发明化合物还可与一种或多种其它生物活性化合物或包括下列活性物质的制剂混合形成多组分农药以获得更广谱的农业保护作用: 杀虫剂, 杀真菌剂, 杀线虫剂, 杀细菌剂, 杀螨剂, 生长调节剂例如生根促进剂, 化学不孕剂, 昆虫信息素, 驱避剂, 引诱剂, 外激素, 促食剂, 其它生物活性化合物或昆虫致病性细菌、病毒或真菌。因此, 本发明组合物还可包括生物有效量的至少一种其它生物活性化合物或制剂。可与本发明化合物一起加工混合的上述生物活性化合物或制剂的实例是: 杀虫剂如阿维菌素, 乙酰甲胺磷, 啉虫脒, 齐墩螨素, 印楝素, 保棉磷, 联苯菊酯, bifenazate, 噻嗪酮, 克百威, 氟唑虫清, 氟啶脲, 毒死蜱, 甲基毒死蜱, chromafenozide, 噻虫胺(clothianidin), 氟氯氟菊酯, 高效氟氯氟菊酯, 氯氟氯菊酯, 高效氯氟氯菊酯, 氯氟菊酯, 灭蝇胺, 溴氟菊酯, 丁醚脲, 二嗪磷, 除虫脲, 乐果, 苯虫醚, emamectin, 硫丹, s-氟戊菊酯, ethiprole, 苯硫威, 苯氧威, 甲氟菊酯, 唑螨酯, 氟戊菊酯, 氟虫腈, flonicamid, 氟氯戊菊酯, 氟胺氟菊酯, 氟虫脲, 地虫硫磷, 特丁苯酰肼, 氟铃脲, 吡虫啉, 噁二唑虫, 异柳磷, 虱

螨脲,马拉硫磷,四聚乙醛,甲胺磷,杀扑磷,灭多威,烯虫酯,甲氧滴滴涕,久效磷,甲氧苯酰肼,硝虫噻嗪,双苯氟脲,杀线威,对硫磷,甲基对硫磷,氯菊酯,甲拌磷,伏杀硫磷,亚胺硫磷,磷胺,抗蚜威,丙溴磷,吡蚜酮,pyridalyl,吡丙醚,鱼藤酮,艾克敌 105(spinosad),硫丙磷,虫酰肼,氟苯脲,七氟菊酯,特丁硫磷,杀虫畏,噻虫啉(thiacloprid),thiamethoxam,硫双威,杀虫双,四溴菊酯,敌百虫和杀铃脲;杀真菌剂如噻二唑素,腈嘧菌酯,苯菌灵,灭瘟素,波尔多液(碱式硫酸铜),糠菌唑,氯环丙酰胺,敌菌丹,克菌丹,多菌灵,地茂散,百菌清,王铜,铜盐,cyflufenamid,霜脲氰,环丙唑醇,嘧菌环胺,(S)-3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧代丙基)-4-苯甲酰胺(RH 7281),diclocymet(S-2900),啞菌酮,氯硝胺,苯醚甲环唑,(S)-3,5-二氢-5-甲基-2-(甲硫基)-5-苯基-3-(苯基氨基)-4H-咪唑-4-酮(RP 407213),烯酰吗啉,dimoxystrobin,烯唑醇,烯唑醇-M,多果定,敌瘟磷,氧唑菌(epoxiconazole),噁唑酮菌(famoxadone),fenamidone,氯苯嘧啶醇,腈苯唑,fencaramid(SZX0722),拌种咯,苯锈啶,丁苯吗啉,醋酸三苯锡,羟基三苯锡,氟啶胺,咯菌腈,flumetover(RPA 403397),氟啶唑,氟硅唑,氟酰胺,粉唑醇,灭菌丹,三乙腈酸铝,呋霜灵,furametapyr(S-82658),己唑醇,种菌唑,异稻瘟净,异菌脲,稻瘟灵,春雷霉素,亚胺菌(kresoxim-methyl),代森锰锌,代森锰,mefenoxam,灭锈胺,甲霜灵,叶菌唑,叉氨苯酰胺(metominostrobin)/叉氨苯酰胺(SSF-126),腈菌唑,甲腈铁铵(甲基腈酸铁),恶霜灵,戊菌唑,戊菌隆,烯丙苯噻唑,咪鲜胺,霜霉威,丙环唑,啞斑肟,pyraclostrobin,嘧霉胺,咯嗪酮,嗪氧灵,螺噁茂胺,硫磺,戊唑醇,四氟醚唑,噻菌灵,溴氟唑菌,甲基硫菌灵,福美双,tiadinil,三唑酮,三唑醇,三环唑,trifloxystrobin,灭菌唑,有效霉素和乙烯菌核利;杀线虫剂如涕灭威,杀线威和苯线磷;杀细菌剂如链霉素;杀螨剂如双甲脒,灭螨猛,乙酯杀螨醇,三环锡,三氯杀螨醇,除螨灵,etoxazole,噻螨醚,苯丁锡,甲氧菊酯,唑螨酯,噻螨酮,炔螨特,啞螨灵和吡螨胺;以及生物制剂如苏云金杆菌包括 aizawai 和 kurstaki 亚种,苏云金杆菌 δ 内毒素,杆状病毒,以及昆虫致病细菌,病毒和真菌。

对于这些农用保护剂,通常可参考 *The Pesticide Manual*, 12th Edition, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2000.

用于与本发明化合物混和的优选的杀虫剂和杀螨剂包括拟除虫菊

酯类如氯氟菊酯、氯氟氯菊酯、氟氯氟菊酯、高效氟氯氟菊酯、S-氟戊菊酯、氟戊菊酯和四溴菊酯;氨基甲酸酯类如苯硫威、灭多威、杀线威和硫双威;新烟碱类如噻虫胺、吡虫啉和噻虫啉;神经元钠离子通道阻滞剂如噁二唑虫;大环内酯类杀虫剂如艾克敌 105、阿维菌素、齐墩螨素和 emamectin; γ -氨基丁酸(GABA)拮抗剂如硫丹、ethiprole 和氟虫腈;脲类杀虫剂如氟虫脲和杀铃脲;保幼激素模拟物如苯虫醚和吡丙醚;吡蚜酮;以及双甲脒。用于与本发明化合物混合的优选的生物制剂包括苏云金杆菌和苏云金杆菌 δ 内毒素以及天然发生和基因改造的病毒杀虫剂包括杆状病毒科的成员以及昆虫致病性真菌。

最优选的混合物包括本发明化合物与氯氟氯菊酯的混合物;本发明化合物与高效氟氯氟菊酯的混合物;本发明化合物与 S-氟戊菊酯的混合物;本发明化合物与灭多威的混合物;本发明化合物与吡虫啉的混合物;本发明化合物与噻虫啉的混合物;本发明化合物与噁二唑虫的混合物;本发明化合物与阿维菌素的混合物;本发明化合物与硫丹的混合物;本发明化合物与 ethiprole 的混合物;本发明化合物与氟虫腈的混合物;本发明化合物与氟虫脲的混合物;本发明化合物与吡丙醚的混合物;本发明化合物与吡蚜酮的混合物;本发明化合物与双甲脒的混合物;本发明化合物与苏云金杆菌的混合物以及本发明化合物与苏云金杆菌 δ 内毒素的混合物。

在某些情况下,将具有类似防治谱但作用方式不同的其它无脊椎害虫防治用化合物或制剂与本发明化合物结合使用特别有利于抗性控制。因此,本发明组合物还可包括生物有效量具有类似防治谱但作用方式不同的至少一种其它无脊椎害虫防治化合物或制剂。将基因修饰后能表达产生植物保护化合物(例如蛋白质)的植物或植物的生长环境与生物有效量的本发明化合物接触也可获得更广谱的植物保护作用以及有利于抗药性的控制。

通过将一种或多种有效量的本发明化合物施用于害虫的周围环境包括农业和/或非农业侵染地,施用于需要保护的区域,或直接施用于需要防治的害虫上以防治农业和非农业生产中出现的无脊椎害虫。因此,本发明进一步涉及防治在农业和/或非农业生产中出现的无脊椎害虫的方法,包括将生物有效量的一种或多种本发明化合物或含有至少一种本发明化合物的组合物或包含至少一种本发明化合物和有效量的至少一

种其它生物活性化合物或制剂的组合物与无脊椎害虫或其周围环境接触。

优选的施用方法是喷雾。此外,包含本发明化合物的颗粒剂组合物可以施用于植物的叶面或土壤中。在采用液体制剂土壤浇灌法,土壤施用颗粒剂,育苗箱施药法或移栽浸苗施用,本发明化合物还可通过将植物与含本发明化合物的组合物接触后的植物内吸作用而有效输送。通过采用将含有本发明化合物的组合物局部施用至侵染区域的施用方式,化合物也同样有效。其它施用方法包括将本发明化合物或组合物通过直接和滞留喷雾,飞机喷雾,种子包衣,微胶囊化,内吸,诱饵,耳标,丸剂,弥雾器,熏蒸剂,气雾剂,粉剂和许多其它方式施用。

可将本发明化合物掺入无脊椎动物取食的饵料中或放入例如诱捕器等装置中。含有 0.01-5%活性成分,0.05-10%保湿剂和 40-99%植物性粉的颗粒剂或诱饵可以在非常低的施用量下有效地防治土壤昆虫,特别是活性成分通过取食致死而非直接接触杀的剂量。

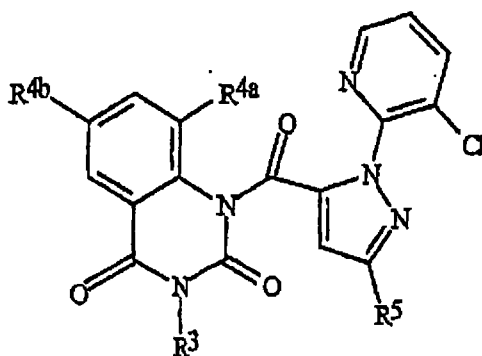
本发明化合物可以它们的纯物质形式施用,但是大多数情况下通常是施用含有一种或多种化合物与适合的载体,稀释剂,和表面活性剂的制剂的形式以及取决于预期的最终用途,还可与食物一起混合施用。优选的施用方式包括喷洒化合物的水分散液或精制的油溶液。与喷雾油,喷雾油浓制剂,展着增稠剂,助剂,其它溶剂和增效剂如胡椒基丁醚一起混合施用通常可提高化合物的防效。

有效防治所需的施药量(即“生物有效量”)取决于下列因素:需防治的无脊椎动物种类,害虫的生长周期,生长阶段,害虫的大小,地点,一年中的时期,寄生作物或动物,取食行为,交配行为,环境湿度和温度等。在通常环境条件下,约为每公顷 0.01-2 公斤活性成分的施用量可足够用以防治农业生态系统中的害虫,但是少至 0.0001 公斤/公顷可能也是有效的或多至 8 公斤/公顷也可能是需要的。对于非农业应用,有效用量范围是大约 1.0-50 毫克/平方米,但是少至 0.1 毫克/平方米可能是有效的,或多至 150 毫克/平方米也可能是需要的。本领域技术人员可以容易地根据所需无脊椎害虫防治水平确定生物有效量。

本发明生物实施例中的下列试验证实了用于保护植物免受特定的节肢动物害虫侵害的本发明方法的效果。“防效”表示抑制节肢动物的发育(包括死亡),由此导致明显地减少取食。然而,由这些化合物提供

的害虫防治保护效果并不限于下述这些害虫种类。关于化合物的说明见索引表 A-D。在索引表中使用的下列缩写如下:t 为叔,n 为正,i 为异,s 为仲,c 为环,Me 为甲基,Et 为乙基,Pr 为丙基和 Bu 为丁基;相应的 i-Pr 为异丙基,s-Bu 为仲丁基等。缩写“Ex”代表“实施例”以及其后标记的数字表示在这个实施例中制备的化合物。

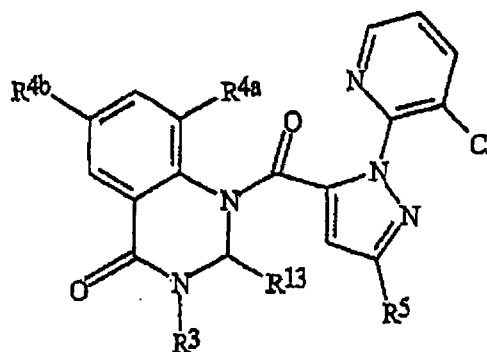
索引表 A



化合物	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
1	i-Pr	Me	H	CF ₃	*
2	Me	Me	Br	CF ₃	*
3	i-Pr	Me	Br	CF ₃	*
4	i-Bu	Me	Br	CF ₃	*
5	Me	Me	Br	Br	*
6 (Ex. 1)	i-Pr	Me	Br	Br	*

¹H NMR 数据参见索引表 D.

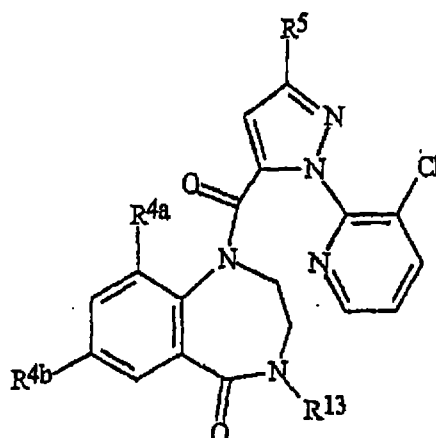
索引表 B



化合物	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ¹³	m.p. (°C)
7 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	H	*
8	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	H	192-194
9	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	H	207-208
10	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	H	167-168
11	Me	Cl	Cl	Cl	H	173-178
12	Me	Cl	Cl	Br	H	200-202
13	Me	Cl	Cl	CF ₃	H	157-158
14	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	H	219-220
15	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	H	228-231
16	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	H	213-214
17	Me	Me	Cl	Cl	H	238-240
18	Me	Me	Cl	Br	H	254-255
19	Me	Me	Cl	CF ₃	H	207-208
20	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	CO ₂ H	143-190
21	Me	Cl	Cl	Cl	CO ₂ H	*
22	Cl	Cl	Cl	Cl	3-吡啶基	135-156
23	Cl	Cl	Cl	Cl	2-咪唑基	*
24	Cl	Cl	Cl	Cl	4-咪唑基	*
25	Me	Cl	Cl	Cl	CO ₂ Et	*
26	Me	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ Me	*
27	Me	Cl	Cl	Cl	4-(CO ₂ Me)Ph	178-232
28	H	Cl	Cl	Cl	H	181-192
29	H	Cl	Cl	CF ₃	H	162-177

¹H NMR 数据参见索引表 D.

索引表 C



化合物	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	m.p. (°C)
30	H	Cl	Cl	Cl	*
31	H	Cl	Cl	CF ₃	*

¹H NMR 数据参见索引表 D.

索引表 D

化合物序号 ¹H NMR 数据(除非另有说明CDCl₃)^a

1	DMSO- <i>d</i> ₆ 8.6-8.5 (dd, 1H), 8.4 (dd, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.0 (d, 1H), 7.8 (dd, 1H), 7.6 (d, 1H), 7.4-7.3 (t, 1H), 5.0 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 1.41 (d, 6H).
2	8.41 (dd, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.96 (dd, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.38 (s, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).
3	8.36 (dd, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.94 (dd, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.37 (s, 1H), 5.08 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 1.46 (d, 6H).
4	8.44 (dd, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.28 (s, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.64 (s, 9H).
5	8.39 (dd, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.93 (dd, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.12 (s, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).
6	8.34 (dd, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.91 (dd, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.12 (s, 1H), 5.08 (m, 1H), 2.17 (s, 3H), 1.47 (d, 6H).
7	8.3 (m, 1H), 7.9-7.8 (m, 2H), 7.4-7.3 (m, 3H), 6.0-5.9 (s, 1H), 5.9 (d, 1H), 5.0-4.8 (m, 1H), 4.4-4.3 (d, 1H), 2.10 (s, 3H), 1.3-1.1 (m, 6H).
21	DMSO- <i>d</i> ₆ 8.50 (dd, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.87-7.75 (m, 2H), 7.61 (ddd, 1H), 5.83 (bs, 1H), 3.01 (s, 3H).
23	DMSO- <i>d</i> ₆ 8.38 (d, 1H), 8.22 (bs, 1H), 7.9-7.7 (bm, 2H), 7.58 (t, 1H), 7.16-7.05 (m, 2H), 6.83 (bs, 1H), 3.15 (bs, 3H).

化合物序号 ^1H NMR 数据(除非另有说明 CDCl_3)^a

24	DMSO- d_6 8.48 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.87-7.77 (m, 2H), 7.70 (s, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.01 (s, 2H), 6.90 (s, 1H), 3.18 (bs, 3H)
25	DMSO- d_6 8.4-8.2 (b, 2H), 8.1-7.8 (b, 2H), 7.55 (b, 1H), 7.2-7.1 (m, 2H), 6.8-6.6 (b, 1H), 4.3-3.9 (b, 2H), 3.11 (s, 3H), 1.2-0.9 (b, 3H)
26	DMSO- d_6 8.30 (d, 1H), 8.20 (bs, 1H), 7.98 (bs, 1H), 7.82 (bs, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.41 (bs, 1H), 6.08 (bs, 1H), 3.60 (b, 2H), 3.04 (s, 3H)
30	DMSO- d_6 8.27 (dd, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.44 (dd, 1H), 7.17 (s, 1H), 4.44 (t, 2H), 3.99 (t, 2H)
31	DMSO- d_6 8.24 (dd, 1H), 8.03 (dd, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 4.33 (t, 2H), 3.91 (t, 2H)

^a ^1H NMR 数据是以 ppm 表示的来自四甲基硅烷的低场。偶合通过以下符号表示: (s)-单峰, (d)-双峰, (t)-三重峰, (q)-四重峰, (m)-多重峰, (dd)-双重的双峰, (dt)-双重的三重峰, (br s)-宽单峰。

本发明的生物实施例

试验 A

用于评估小菜蛾(*Plutella xylostella*)防治效果的试验装置由小开口的容器制成,其中已放置有生长 12-14 天的萝卜植物。取一片昆虫饵料上的 10-15 头新生幼虫预侵染萝卜植物,这是采用心土采样器从一片生长着许多幼虫的硬化的昆虫饵料上切下(圆柱状的)一小块然后将这块包括幼虫和饵料的样品转移至试验装置中。随着饵料变干,幼虫迁移至试验植株。

用含下列物质的溶液配制试验化合物:10%丙酮,90%水和 300ppm X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非离子型表面活性剂,该表面活性剂含有烷芳基聚氧乙烯,游离脂肪酸,乙二醇和异丙醇(Loveland Industries, Inc.)。通过 SUJ2 雾化喷嘴施用 1ml 的所述配制化合物液体,该雾化喷嘴位于各试验装置上方 1.27cm(0.5 英寸)处,带有 1/8 JJ 定制的箱体(Spraying System Co.)。将在这一屏蔽(screen)中的所有试验化合物均以 50ppm 的量喷洒并重复喷洒 3 次。在喷洒所述配制的试验化合物后,使各试验装置干燥 1 小时,然后在顶部加盖黑色遮蔽盖。在 25℃,70% 相对湿度的生长室中将试验装置放置 6 天。然后目测植物的害虫取食损害程度。

在所试验的化合物中,下列化合物提供了很好的植物保护水平(20%

或更低的取食损害):1,2,3,5,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17,18,19,22,23, 24,26,28 和 29.

试验 B

为了评估对草地粘虫(*Spodoptera frugiperda*)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 4-5 天的玉米植株。如试验 A 所述方法通过采用心土采样器取一块昆虫饵料上的 10-15 头 1 天龄的幼虫预侵染玉米植株。

如试验 A 所述配制试验化合物并以 50ppm 进行喷洒。重复喷洒三次。喷洒后,将试验装置放置在生长室中,然后如试验 A 所述进行目测评定。

在所试验的化合物中,下列化合物提供了很好的植物保护水平(20%或更低的取食损害):5,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17,18,19,23,24,28 和 29.

试验 C

为了评估对烟草夜蛾(*Heliothis virescens*)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 6-7 天的棉花植株。如试验 A 所述方法采用心土采样器取一片昆虫饵料上的 8 头 2 天龄的幼虫预侵染棉花植株。

如试验 A 所述配制试验化合物并以 50ppm 进行喷洒。重复喷洒三次。喷洒后,将试验装置放置在生长室中,然后如试验 A 所述进行目测评定。

所试验的化合物中,下列化合物表现出非常好的植物保护水平(20%或更低的取食损害):1,2,5,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17,18,19,21,23 和 24.

试验 D

为了评估对甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 4-5 天的玉米植株。如试验 A 所述方法采用心土采样器取一片昆虫饵料上的 10-15 头 1 天龄的幼虫预侵染玉米植株。

如试验 A 所述配制试验化合物并以 50ppm 进行喷洒。重复喷洒三次。喷洒后,将试验装置放置在生长室中,然后如试验 A 所述进行目测评定。

所试验的化合物中,下列化合物表现出非常好的植物保护水平(20%或更低的取食损害):2,5,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17,18,19,23 和 24。

试验 E

通过触杀和/或内吸方式评估对桃蚜(*Myzus persicae*)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 12-15 天的萝卜植株。通过将培养植物上切下(切叶方法)的带有 30-40 头蚜虫的一片叶子放置在试验植物的叶片上使之预侵染萝卜植株。随着叶片的干枯,幼虫迁移至试验植物上。预侵染后,将试验装置的土壤用沙层覆盖。

用含下列物质的溶液配制试验化合物:10%丙酮,90%水和 300ppm X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非离子型表面活性剂,该表面活性剂含有烷芳基聚氧乙烯,游离脂肪酸,乙二醇和异丙醇(Loveland Industries,Inc.)。通过 SU J2 雾化喷嘴施用 1ml 的所述配制化合物液体,该雾化喷嘴位于各试验装置上方 1.27cm(0.5 英寸)处,带有 1/8 JJ 定制的箱体(Spraying System Co.)。将在这一屏蔽(screen)中的所有试验化合物均以 250ppm 的量喷洒并重复喷洒 3 次。在喷洒所述配制的试验化合物后,使各试验装置干燥 1 小时,然后在顶部加盖黑色遮蔽盖。在 19-21℃ 和 50-70%相对湿度的生长室中将试验装置放置 6 天。然后对每个试验装置目测评估昆虫死亡率。

在所试验化合物中,下列化合物获得至少 80% 的死亡率:8,9,11,12,13,19,28 和 29。

试验 F

通过触杀和/或内吸方式评估对棉(瓜)蚜(*Aphis gossypii*)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 6-7 天的棉花植株。根据试验 E 所述切叶方法将带有 30-40 头蚜虫的叶片预侵染棉花植株,将试验装置的土壤用沙层覆盖。

如试验 E 所述配制试验化合物并以 250ppm 进行喷洒。重复喷洒三次。喷洒后,将试验装置放置在生长室中,然后如试验 E 所述进行目测评定。

所试验化合物中,下列化合物获得至少 80% 死亡率:8,9,11,12,13,15,16,19 和 29。

试验 G

通过触杀和/或内吸方式评估对菲岛玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)的

防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 3-4 天的玉米植株(穗)。试验前将白沙加至土壤上。如试验 E 所述配制试验化合物并以 250ppm 进行喷洒,重复三次。喷洒后,用 10-20 头菲岛玉米蜡蝉(18-20 天龄的若虫),即用盐瓶将它们撒布在砂子上对试验植物进行后侵染之前,将试验装置干燥 1 小时。在圆柱形容器的顶部加盖黑色遮蔽盖。在 19-21℃和 50-70%相对湿度的生长室中将试验装置放置 6 天。然后对每个试验装置目测评估昆虫死亡率。

在所试验的化合物中,下列化合物获得至少 80%的死亡率:12 和 13。

试验 H

通过触杀和/或内吸方式评估对马铃薯微叶蝉(*Empoasca fabae* Harris)的防治,试验装置由小开口的容器制成,其中放置有已生长 5-6 天的 Longio 豆植物(长出初生叶)。试验前将白沙加至土壤上并切下一片初生叶。如试验 E 所述配制试验化合物并以 250ppm 进行喷洒,重复三次。喷洒后,用 5 头马铃薯微叶蝉(18-21 天龄的成虫)对试验植物进行后侵染之前,将试验装置干燥 1 小时。在圆柱形容器的顶部加盖黑色遮蔽盖。在 19-21℃和 50-70%相对湿度的生长室中将试验装置放置 6 天。然后对每个试验装置目测评估昆虫死亡率。

在所试验的化合物中,下列化合物获得至少 80%的死亡率:8,9,10,11,12,13,15,16,19,24 和 29。